

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2019-534881

(P2019-534881A)

(43) 公表日 令和1年12月5日(2019.12.5)

| (51) Int.Cl. | F I | テーマコード (参考) |
|------------------------------|-----------------|-------------|
| CO7D 271/06 (2006.01) | CO7D 271/06 CSP | 4C056 |
| CO7D 413/12 (2006.01) | CO7D 413/12 | 4C063 |
| AO1P 3/00 (2006.01) | AO1P 3/00 | 4H011 |
| AO1N 43/836 (2006.01) | AO1N 43/836 | |
| AO1N 53/12 (2006.01) | AO1N 53/12 | |

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 83 頁) 最終頁に続く

| | | | |
|--------------------|------------------------------|----------|--|
| (21) 出願番号 | 特願2019-518516 (P2019-518516) | (71) 出願人 | 300091441 シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー スイス国4058 バーゼル、シュバルツ バルトアレー 215 |
| (86) (22) 出願日 | 平成29年10月3日 (2017.10.3) | (74) 代理人 | 100094569 弁理士 田中 伸一郎 |
| (85) 翻訳文提出日 | 令和1年5月15日 (2019.5.15) | (74) 代理人 | 100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦 |
| (86) 国際出願番号 | PCT/EP2017/075080 | (74) 代理人 | 100109070 弁理士 須田 洋之 |
| (87) 国際公開番号 | W02018/065414 | (74) 代理人 | 100119013 弁理士 山崎 一夫 |
| (87) 国際公開日 | 平成30年4月12日 (2018.4.12) | (74) 代理人 | 100123777 弁理士 市川 さつき |
| (31) 優先権主張番号 | 16192518.5 | | |
| (32) 優先日 | 平成28年10月6日 (2016.10.6) | | |
| (33) 優先権主張国・地域又は機関 | 欧州特許庁 (EP) | | |

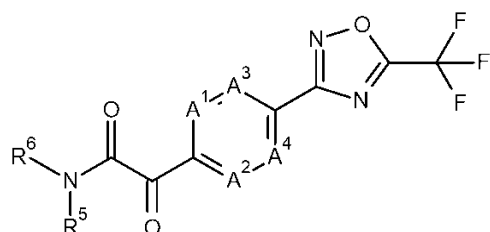
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺微生物オキサジアゾール誘導体

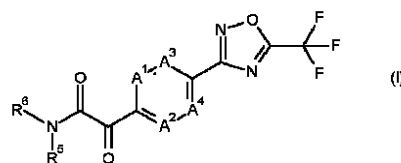
(57) 【要約】

有害生物防除剤として、特に殺菌・殺カビ剤として有用である、式(I)の化合物(式中、置換基は請求項1に定義されているとおりである)。

【化1】



(I)



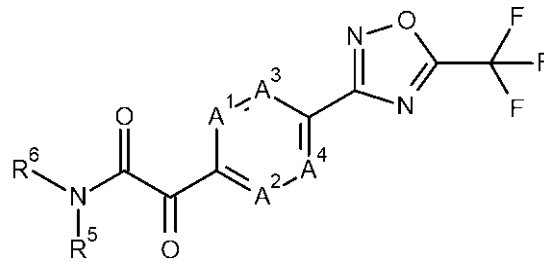
(II)

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

10

(式中、

A^1 はNまたは CR^1 であり、 A^2 は CR^2 であり、 A^3 はNまたは CR^3 であり、 A^4 は CR^4 であり、ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は各々独立して、水素またはハロゲンを表し、

ここで、 A^1 および A^3 の一方のみがNであり；

R^5 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、シクロプロピルまたはシクロプロピルメチルであり；

20

R^6 は、水素、ヒドロキシ、アミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-6} アルキニル、 C_{3-4} アルキニルオキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、シアノ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、ジ- (C_{1-2} アルコキシ) C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルファニル C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノ、アミノ C_{1-4} アルキル、N - C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、N - C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル、N - C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-2} アルキル、ベンジルオキシ、ヘテロアリアルまたはヘテロアリアル C_{1-2} アルキル (ここで、前記ヘテロアリアル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香族環である)、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリル C_{1-2} アルキル (ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環である) であり、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルまたはヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、 R^7 から選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換されており；

30

40

R^7 は、メチル、エチル、イソプロピル、クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、シアノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシおよびシクロプロピルから選択されるか；または

R^6 が、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、ヘテロシクリルもしくはヘテロシクリル C_{1-2} アルキルである場合、 R^7 は、オキソ (=O) を表し得るか；または

R^5 および R^6 は、これらが結合している窒素原子と一緒に、O、S、 $S(O)_2$ 、カルボニル ($C=O$) または NR^8 から選択される追加のヘテロ原子またはヘテロ基を任意に含有する4~6員環を形成し；ここで、

R^8 は、水素、メチルまたはメトキシである)

50

の化合物またはその塩もしくはN - オキシド。

【請求項 2】

R⁵が、水素、C₁₋₄アルキルまたはC₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R⁵が、水素、メチルまたはメトキシエチルである、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R⁶が、水素、C₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₄アルケニルオキシ、C₃₋₆アルキニル、C₃₋₄アルキニルオキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₄ハロアルコキシ、シアノC₁₋₆アルキル、ヒドロキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキル、ジ - (C₁₋₂アルコキシ)C₁₋₄アルキル、C₁₋₂アルキルスルファニルC₁₋₄アルキル、N, N - ジ - C₁₋₄アルキルアミノ、アミノC₁₋₄アルキル、N, N - ジ - C₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニルC₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニルC₁₋₆アルキル、N - C₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニルアミノC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニルアミノC₁₋₄アルキル、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₂アルキル、C₃₋₈シクロアルキルカルボニルアミノC₁₋₂アルキル、フェニル、フェニルC₁₋₂アルキル、ベンジルオキシ、ヘテロアリールまたはヘテロアリールC₁₋₂アルキル（ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香族環である）、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルC₁₋₂アルキル（ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環である）であり、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、R⁷から選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換されており；ここで、

R⁷は、メチル、エチル、フルオロおよびメトキシから選択されるか；または

R⁶がヘテロシクリルである場合、R⁷はオキソ (= O) を表してもよい、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

R⁶が、水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₂アルコキシ、C₃₋₄アルケニル、C₃₋₄アルケニルオキシ、C₃₋₄アルキニル、C₃₋₄アルキニルオキシ、C₁₋₂ハロアルキル、C₁₋₂ハロアルコキシ、シアノメチル、ヒドロキシエチル、メトキシC₁₋₂アルキル、ジメトキシC₁₋₂アルキル、メチルスルファニルC₁₋₂アルキル、N, N - ジ - C₁₋₂アルキルアミノ、アミノC₁₋₂アルキル、N, N - ジ - C₁₋₂アルキルアミノC₁₋₂アルキル、C₁₋₂アルキルカルボニルC₁₋₂アルキル、メチルアミノカルボニルC₁₋₂アルキル、C₁₋₂アルコキシカルボニルC₁₋₂アルキル、C₁₋₂アルキルカルボニルアミノC₁₋₂アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニルアミノC₁₋₂アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₂アルキル、C₃₋₆シクロアルキルカルボニルアミノC₁₋₂アルキル、フェニル、フェニルC₁₋₂アルキル、ベンジルオキシ、ヘテロアリールまたはヘテロアリールC₁₋₂アルキル（ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香族環である）、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルC₁₋₂アルキル（ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環である）であり、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、R⁷から選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換されており；ここで、

R⁷は、メチル、エチル、フルオロおよびメトキシから選択されるか；または

R⁶がヘテロシクリルである場合、R⁷はオキソ (= O) を表してもよい、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

10

20

30

40

50

R⁶が、C₁₋₃アルキル、C₃アルケニル、C₃アルキニル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、C₁₋₂アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキルメチルまたはヘテロアリールであり、ここで、シクロアルキルまたはヘテロアリール部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、R⁷から選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換され、ここで、R⁷はメチル、エチル、フルオロおよびメトキシから選択される、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R⁵およびR⁶が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、OおよびNR⁸から選択される追加のヘテロ原子またはヘテロ基を任意に含有する5員または6員環を形成し；ここで、R⁸は、水素、メチルまたはメトキシである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項8】

R⁵およびR⁶が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、モルホリノ、ピロリジニルまたはメトキシピペラジニル環を形成する、請求項1～3または7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

A¹がCR¹であり、A³がCR³であり、A²およびA⁴が各々C-Hであり、ここで、R¹およびR³は各々独立して、水素またはフルオロである、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

A¹、A²、A³およびA⁴が各々C-Hである、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項11】

殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物を含む農芸化学組成物。

【請求項12】

少なくとも1種の追加の有効成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤もしくはキャリアをさらに含む、請求項11に記載の組成物。

【請求項13】

植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除または予防する方法であって、殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物、または有効成分としてこの化合物を含む組成物が、前記植物、その一部またはその生息地に適用される方法。

30

【請求項14】

殺菌・殺カビ剤としての、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、例えば、特に殺菌・殺カビ(fungicidal)活性といった殺微生物活性を有する有効成分としての殺微生物オキサジアゾール誘導体に関する。本発明はまた、少なくとも1種のオキサジアゾール誘導体を含む農芸化学組成物、これらの化合物の調製プロセス、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オキサジアゾール誘導体または組成物の使用に関する。

40

【背景技術】

【0002】

欧州特許第0276432号明細書および国際公開第2015/185485号には、植物病原性真菌を駆除するための置換オキサジアゾールの使用が記載されている。

【発明の概要】

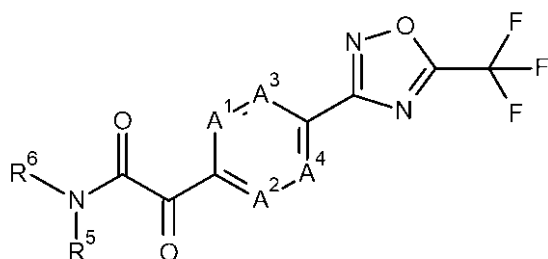
【課題を解決するための手段】

50

【0003】

本発明によれば、式(I)の化合物：

【化1】



(I)

10

(式中、

A^1 はNまたは CR^1 であり、 A^2 は CR^2 であり、 A^3 はNまたは CR^3 であり、および、 A^4 は CR^4 であり、ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は各々独立して、水素またはハロゲンを表し、ならびに

ここで、 A^1 および A^3 の一方のみがNであり；

R^5 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、シクロプロピルまたはシクロプロピルメチルであり；

R^6 は、水素、ヒドロキシ、アミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-6} アルキニル、 C_{3-4} アルキニルオキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、シアノ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、ジ- (C_{1-2} アルコキシ) C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルファニル C_{1-4} アルキル、N, N-ジ- C_{1-4} アルキルアミノ、アミノ C_{1-4} アルキル、N- C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、N, N-ジ- C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、N- C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル、N, N-ジ- C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル、N- C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-2} アルキル、ベンジルオキシ、ヘテロアリールまたはヘテロアリール C_{1-2} アルキル(ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香族環である)、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリル C_{1-2} アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環である)であり、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、 R^7 から選択される1もしくは2個の置換基によって任意選択により置換されており；

20

30

40

R^7 は、メチル、エチル、イソプロピル、クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、シアノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシおよびシクロプロピルから選択され；または

R^6 が、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、ヘテロシクリルもしくはヘテロシクリル C_{1-2} アルキルである場合、 R^7 は、オキソ(=O)を表し得；または

R^5 および R^6 は、これらが結合している窒素原子と一緒に、O、S、 $S(O)_2$ 、カルボニル($C=O$)または NR^8 から選択される追加のヘテロ原子またはヘテロ基を任意選択により含有する4~6員環を形成し；ここで、

R^8 は、水素、メチルまたはメトキシである)またはその塩もしくはN-オキシドが提供されている。

【0004】

50

意外なことに、式(I)の新規な化合物が、實際上、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非常に有利なレベルの生物学的活性を有することが見出された。

【発明を実施するための形態】

【0005】

本発明の第2の態様によれば、殺菌・殺カビ的に(fungicidally)有効な量の式(I)の化合物を含む農芸化学組成物が提供される。このような農業用組成物は、少なくとも1種の追加の有効成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤またはキャリアをさらに含み得る。

【0006】

本発明の第3の態様によれば、植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除または予防する方法であって、殺菌・殺カビ的に有効な量の式(I)の化合物、または有効成分としてこの化合物を含む組成物が、植物、その一部またはその生息地に適用される方法が提供される。

【0007】

本発明の第4の態様によれば、殺菌・殺カビ剤(fungicide)としての式(I)の化合物の使用が提供される。本発明のこの特定の態様によれば、使用は、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を除いてもよい。

【0008】

本明細書において用いられるところ、「ハロゲン」または「ハロ」という用語は、フッ素(フルオロ)、塩素(クロロ)、臭素(プロモ)またはヨウ素(ヨード)、好ましくは、フッ素、塩素または臭素を指す。

【0009】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₆アルキル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、不飽和を含まず、1~6個の炭素原子を含み、ならびに、単結合によって分子の残部に結合している直鎖または分岐鎖炭化水素鎖ラジカルを指す。C₁₋₄アルキルおよびC₁₋₂アルキルは相応に解釈されるべきである。C₁₋₆アルキルの例としては、これらに限定されないが、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル(イソプロピル)、n-ブチル、2-メチルプロピル(イソブチル)および1-ジメチルエチル(t-ブチル)が挙げられる。「C₁₋₆アルキレン」基は、C₁₋₆アルキル(ならびに、C₁₋₄アルキルおよびC₁₋₃アルキル)の対応する定義を指すが、ただし、このようなラジカルは、2つの単結合によって分子の残部に結合している。C₁₋₆アルキレンの例としては、これらに限定されないが、-CH₂-、-CH₂CH₂-および-(CH₂)₃-が挙げられる。

【0010】

本明細書において用いられるところ、シアノは-CN基を意味する。

【0011】

本明細書において用いられるところ、ヒドロキシは-OH基を意味する。

【0012】

本明細書において用いられるところ、アミノは-NH₂基を意味する。

【0013】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄アルコキシ」という用語は、式-OR_aのラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記において定義されているC₁₋₄アルキルラジカルである。C₁₋₄アルコキシおよびC₁₋₂アルコキシは相応に解釈されるべきである。C₁₋₆アルコキシの例としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシおよびt-ブトキシが挙げられる。

【0014】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₆ハロアルキル」という用語は、1個以上の同一または異なるハロゲン原子によって置換されている、一般に上記において定義されているC₁₋₆アルキルラジカルを指す。C₁₋₄ハロアルキルおよびC₁₋₂ハロアルキルは相

10

20

30

40

50

応に解釈されるべきである。C₁₋₆ハロアルキルの例としては、これらに限定されないが、フルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルおよび2, 2, 2-トリフルオロエチルが挙げられる。

【0015】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₆アルケニル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、(E)配置または(Z)配置のいずれかのものであり得る少なくとも1つの二重結合を含み、3~6個の炭素原子を有し、単結合によって分子の残りの部分に結合された直鎖または分岐鎖炭化水素鎖ラジカル基を指す。「C₃₋₄アルケニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。C₃₋₆アルケニルの例としては、これらに限定されないが、プロパ-1-エニル、アリール(プロパ-2-エニル)、およびブタ-1-エニルが挙げられる。

10

【0016】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₄アルケニルオキシ」という用語は、式R_aO-のラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記において定義されているC₃₋₄アルケニルラジカルである。

【0017】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₆アルキニル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、少なくとも1つの三重結合を含み、3~6個の炭素原子を有し、かつ単結合によって分子の残りの部分に結合された直鎖または分岐鎖炭化水素鎖ラジカル基を指す。C₃₋₆アルキニルの例としては、これらに限定されないが、プロパ-1-イニル、ブタ-1-イニルが挙げられる。「C₃₋₄アルキニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。C₃₋₆アルキニルの例としては、これらに限定されないが、プロパ-1-イニル、プロパルギル(プロパ-2-イニル)、およびブタ-1-イニルが挙げられる。

20

【0018】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₄アルキニルオキシ」という用語は、式R_aO-のラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記において定義されているC₃₋₄アルキニルラジカルである。

【0019】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄ハロアルコキシ」という用語は、1個以上の同一または異なるハロゲン原子によって置換されている、上記に定義されているC₁₋₄アルコキシ基を指す。C₁₋₂ハロアルコキシ(C₁₋₂フルオロアルコキシを含む)は、相応に解釈されるべきである。C₁₋₄ハロアルコキシの例としては、これらに限定されないが、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、トリフルオロメトキシおよびトリフルオロエトキシが挙げられる。

30

【0020】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキル」という用語は、式R_b-O-R_a-のラジカルを指し、ここで、R_bは一般に上記において定義されているC₁₋₂アルキルラジカルであり、および、R_aは一般に上記において定義されているC₁₋₄アルキレンラジカルである。

40

【0021】

本明細書において用いられるところ、「アミノC₁₋₄アルキル」という用語は、式H₂N R_a-のラジカルを指し、ここで、R_aは一般に上記において定義されているC₁₋₄アルキレンラジカルである。

【0022】

本明細書において用いられるところ、「N-C₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル」という用語は、式R_bNH-R_a-のラジカルを指し、ここで、R_bは一般に上記において定義されているC₁₋₄アルキルラジカルであり、および、R_aは一般に上記において定義されているC₁₋₄アルキレンラジカルである。

【0023】

50

本明細書において用いられるところ、「 $N - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル」という用語は、式 $R_b NHC(O)R_a -$ のラジカルを指し、ここで、 R_b は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルラジカルであり、および、 R_a は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキレンラジカルである。

【0024】

本明細書において用いられるところ、「 $N - C_{1-4}$ アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル」という用語は、式 $R_b C(O)NHR_a -$ のラジカルを指し、ここで、 R_b は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルラジカルであり、および、 R_a は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキレンラジカルである。

【0025】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル」という用語は、式 $R_b OC(O)NHR_a -$ のラジカルを指し、ここで、 R_b は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルラジカルであり、および、 R_a は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキレンラジカルである。 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-4} アルキルの例としては、これらに限定されないが、*t*-ブトキシカルボニルアミノエチルが挙げられる。

【0026】

本明細書において用いられるところ、「ヒドロキシ C_{1-6} アルキル」という用語は、1つ以上の水酸基によって置換された、一般に上記において定義されている C_{1-6} アルキルラジカルを指す。

【0027】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-2} アルキルスルファニル C_{1-4} アルキル」という用語は、式 $R_a SR_b -$ のラジカルを指し、ここで、 R_a は一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキルラジカルであり、および、 R_b は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキレンラジカルである。用語メチルスルファニル C_{1-2} アルキルは、相応に解釈されるべきである。

【0028】

本明細書において用いられるところ、「シアノ C_{1-6} アルキル」という用語は、1つ以上のシアノ基によって置換された、一般に上記において定義されている C_{1-6} アルキルラジカルを指す。シアノ C_{1-4} アルキルは相応に解釈されるべきである。シアノ C_{1-6} アルキルの例としては、これらに限定されないが、シアノメチルが挙げられる。

【0029】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル」という用語は、式 $R_b C(O)R_a$ のラジカルを指し、ここで、 R_a は、一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルであり、および、 R_b は一般に上記において定義されている C_{1-6} アルキレンラジカルである。 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-4} アルキルは相応に解釈されるべきである。

【0030】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル」という用語は、式 $R_b C(O)OR_a$ のラジカルを指し、ここで、 R_a は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルラジカルであり、および、 R_b は、一般に上記において定義されている C_{1-6} アルキレンラジカルである。

【0031】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル」という用語は、式 $R_b C(O)NHR_a$ のラジカルを指し、ここで、 R_a は一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルラジカルであり、および、 R_b は、一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキレンラジカルである。

【0032】

本明細書において用いられるところ、「 C_{3-8} シクロアルキル」という用語は、飽和または部分飽和であると共に3～8個の炭素原子を含有する安定な単環式環ラジカルを指す

10

20

30

40

50

。C₃₋₆シクロアルキルは相応に解釈されるべきである。C₃₋₈シクロアルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルが挙げられる。

【0033】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₂アルキル」という用語は、上記に定義されているC₁₋₂アルキレンラジカルによって分子の残部に結合している、上記に定義されているC₃₋₈シクロアルキル環を指す。用語「C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₂アルキル」は相応に解釈されるべきである。C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₂アルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピル-メチルおよびシクロブチル-エチルが挙げられる。

10

【0034】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₈シクロアルキルカルボニルアミノC₁₋₂アルキル」という用語は、式-C(O)NHR_a-のラジカル(式中、R_aは一般に上記において定義されているC₁₋₂アルキレンラジカルである)を介して分子の残部に結合している、上記に定義されているC₃₋₈シクロアルキル環を指す。C₃₋₈シクロアルキルカルボニルアミノC₁₋₂アルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピルカルボニルアミノエチルが挙げられる。

【0035】

本明細書において用いられるところ、「フェニルC₁₋₂アルキル」という用語は、上記に定義されているC₁₋₂アルキレンラジカルによって分子の残部に結合しているフェニル環を指す。フェニルC₁₋₂アルキルの例としては、これらに限定されないが、ベンジルが挙げられる。

20

【0036】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリール」という用語は、窒素、酸素および硫黄から個々に選択される1、2、3もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員単環式芳香族環基を指す。ヘテロアリールラジカルは、炭素原子またはヘテロ原子を介して分子の残部に結合していてもよい。ヘテロアリールの例としては、フラニル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル、ピリジル、およびインドリルが挙げられる。

30

【0037】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリールC₁₋₂アルキル」という用語は、上記に定義されているC₁₋₂アルキレンラジカルによって分子の残部に結合している上記に定義されているヘテロアリール環を指す。

【0038】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリル」または「複素環式」という用語は、窒素、酸素および硫黄から個々に選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子を含む安定な5員または6員非芳香族単環式環基を指す。ヘテロシクリルラジカルは、炭素原子またはヘテロ原子を介して分子の残部に結合していてもよい。ヘテロシクリルの例としては、これらに限定されないが、ピロリニル、ピロリジル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル、ペペリジル、ペペラジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、モルホリニル、オキサジナニル、オキセタニル、ラクタミル、パーヒドロアゼピニル、インドリニルまたはベンズイミダゾールが挙げられる。好ましくは、ヘテロシクリルの例は、モルホリニル、オキサジナニル、オキセタニルおよびペペラジニル(特にモルホリニル、オキセタニルおよびペペラジニル)である。

40

【0039】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリルC₁₋₂アルキル」という用語は、上記に定義されているC₁₋₂アルキレンラジカルによって分子の残部に結合している、上記に定義されている複素環を指す。

【0040】

50

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、その化合物がキラル異性形態、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ブ異性体が生じ得る。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、存在する場合、すべての可能性のある互変異性体(ラクタム-ラクチム互変異性およびケト-エノール互変異性を含む)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。

【0041】

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、共有結合的に水和した形態、または、例えば農業経済学的に使用可能なまたは農芸化学的に許容可能な塩形態といった塩形態である。

【0042】

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。

【0043】

以下のリストは、本発明の式(I)の化合物に関する置換基 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 についての、好ましい定義を含む定義を提供する。これらの置換基のいずれか1つについて、以下に示される定義のいずれかが、以下または本明細書の他の箇所に示されるいずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わせられ得る。

【0044】

A^1 はNまたは CR^1 であり、 A^2 は CR^2 であり、 A^3 はNまたは CR^3 であり、および、 A^4 は CR^4 であり、ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は各々独立して、水素またはハロゲンを表し、ならびに、ここで、 A^1 および A^3 の一方のみがNである。

【0045】

好ましくは、 A^1 はNまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、フルオロおよびクロロから選択される。より好ましくは、 R^1 は水素またはフルオロである。もっとも好ましくは、 R^1 は水素である。

【0046】

好ましくは、 R^2 は、水素、フルオロおよびクロロから選択される。より好ましくは、 R^2 は水素またはフルオロである。もっとも好ましくは、 R^2 は水素である。

【0047】

好ましくは、 A^3 はNまたは CR^3 を表し、ここで、 R^3 は、水素、フルオロおよびクロロから選択される。より好ましくは、 R^3 は水素またはフルオロである。もっとも好ましくは、 R^3 は水素である。

【0048】

好ましくは、 R^4 は、水素、フルオロおよびクロロから選択される。より好ましくは、 R^4 は水素またはフルオロである。もっとも好ましくは、 R^4 は水素である。

【0049】

一実施形態において、 A^1 は CR^1 であり、 A^3 は CR^3 であり、 A^2 および A^4 は各々C-Hであり、ここで、 R^1 および R^3 は、各々独立して、水素またはフルオロである。

【0050】

さらなる実施形態において、 A^1 は CR^1 であり、ここで、 R^1 はフルオロを表し、ならびに、 A^2 、 A^3 および A^4 は各々水素を表す。さらなる実施形態において、 A^1 、 A^2 および A^4 は各々水素を表し、ならびに、 A^3 は CR^3 であり、ここで、 R^3 はフルオロを表す。

【0051】

10

20

30

40

50

好ましくは、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の少なくとも2つはC - Hである。より好ましくは、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の少なくとも3つはC - Hであり、ここで、 A^1 がNである場合、 A^2 、 A^3 および A^4 はすべてC - Hを表し、ならびに、 A^3 がNである場合、 A^1 、 A^2 および A^3 は各々C - Hを表す。一実施形態において、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 は各々C - Hである。

【0052】

R^5 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、シクロプロピル、またはシクロプロピルメチルである。好ましくは、 R^5 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、シクロプロピルまたはシクロプロピルメチルである。より好ましくは、 R^5 は、水素、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキルである。さらにより好ましくは、 R^5 は、水素、メチル、エチル、メトキシ、メトキシメチルまたはメトキシエチルである。さらにより好ましくは、 R^5 は、水素、メチルまたはメトキシエチルである。もっとも好ましくは、 R^5 は水素である。

10

【0053】

R^6 は、水素、ヒドロキシ、アミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-6} アルキニル、 C_{3-4} アルキニルオキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、シアノ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、ジ - (C_{1-2} アルコキシ) C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルファニル C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノ、アミノ C_{1-4} アルキル、N - C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、N - C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル、N - C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-2} アルキル、ベンジルオキシ、ヘテロアリアル、ヘテロアリアル C_{1-2} アルキル(ここで、ヘテロアリアル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-2} アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環である)であり、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルまたはヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、 R^7 から選択される1もしくは2個の置換基によって任意選択により置換されている。

20

30

【0054】

好ましくは、 R^6 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-6} アルキニル、 C_{3-4} アルキニルオキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、シアノ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、ジ - (C_{1-2} アルコキシ) C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルファニル C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノ、アミノ C_{1-4} アルキル、N, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、N - C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-2} アルキル、ベンジルオキシ、ヘテロアリアル、ヘテロアリアル C_{1-2} アルキル(ここで、ヘテロアリアル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-2} アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環である)から選択され、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルまたはヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、 R^7 から

40

50

選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されている。

【 0 0 5 5 】

より好ましくは、 R^6 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-4} アルキニル、 C_{3-4} アルキニルオキシ、 C_{1-2} ハロアルキル、 C_{1-2} ハロアルコキシ、シアノメチル、ヒドロキシエチル、メトキシ C_{1-2} アルキル、ジメトキシ C_{1-2} アルキル、メチルスルファニル C_{1-2} アルキル、 N, N -ジ- C_{1-2} アルキルアミノ、アミノ C_{1-2} アルキル、 N, N -ジ- C_{1-2} アルキルアミノ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルキルカルボニル C_{1-2} アルキル、メチルアミノカルボニル C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルコキシカルボニル C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキルカルボニルアミノ C_{1-2} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-2} アルキル、ベンジルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリール C_{1-2} アルキル（ここで、ヘテロアリール部分は、 N 、 O および S から独立して選択される 1 または 2 個のヘテロ原子を含む 5 員または 6 員芳香族環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-2} アルキル（ここで、ヘテロシクリル部分は、 N 、 O および S から独立して選択される 1 または 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 6 員非芳香族環である）から選択され、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、 R^7 から選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されている。

10

【 0 0 5 6 】

さらにより好ましくは、 R^6 は、水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、エトキシ、アリル、アリルオキシ、プロプ-2-イニル、プロプ-2-イノキシ、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジフルオロエトキシ、シアノメチル、ヒドロキシエチル、2-メトキシエチル、2,2-ジメトキシエチル、メチルスルファニルエチル、 N, N -ジメチルアミノ、アミノエチル、 N, N -ジメチルアミノエチル、メチルカルボニルメチル、メトキシカルボニルメチル、メチルアミノカルボニルメチル、メチルカルボニルアミノエチル、 t ブトキシカルボニルアミノエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルカルボニルアミノエチル、フェニル、ベンジル、ベンジルオキシ、2-ピリジル、2-チエニルメチル、オキセタン-3-イル、イソキサゾリジン-4-イル、1,4-ジオキササン-2-イルメチルから選択され、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、 R^7 から選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されている。

20

30

【 0 0 5 7 】

さらにより好ましくは、 R^6 は、水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、エトキシ、アリル、アリルオキシ、プロプ-2-イニル、プロプ-2-イノキシ、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジフルオロエトキシ、シアノメチル、ヒドロキシエチル、2-メトキシエチル、2,2-ジメトキシエチル、メチルスルファニルエチル、 N, N -ジメチルアミノ、アミノエチル、 N, N -ジメチルアミノエチル、メチルカルボニルメチル、メトキシカルボニルメチル、メチルアミノカルボニルメチル、メチルカルボニルアミノエチル、 t ブトキシカルボニルアミノエチル、シクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロペンチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルカルボニルアミノエチル、フェニル、2-フルオロベンジル、ベンジルオキシ、6-メトキシ-2-ピリジル、3-メチル-2-チエニルメチル、オキセタン-3-イル、2-エチル-3-オキソ-イソキサゾリジン-4-イルおよび1,4-ジオキササン-2-イルメチルから選択される。

40

【 0 0 5 8 】

さらにより好ましくは、 R^6 は、エチル、 n -プロピル、アリル、プロプ-2-イニル、2-フルオロエチル、 t ブトキシカルボニルアミノエチル、シクロプロピルメチル、6-メトキシ-2-ピリジルおよび2,2-ジフルオロシクロペンチルから選択される。

50

【0059】

R⁷は、メチル、エチル、イソプロピル、クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、シアノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシおよびシクロプロピルから選択され；好ましくは、R⁷は、メチル、エチル、イソプロピル、クロロ、フルオロ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシおよびジフルオロメトキシから選択され；より好ましくは、R⁷は、メチル、エチル、フルオロおよびメトキシから選択され、もっとも好ましくは、R⁷はフルオロまたはメトキシである。

【0060】

R⁶が、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₂アルキル、C₃₋₈シクロアルキルカルボニルアミノC₁₋₂アルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルC₁₋₂アルキルである場合、R⁷はオキソ(=O)をも表し得；好ましくは、R⁶がC₃₋₈シクロアルキルまたはヘテロシクリルである場合、R⁷はオキソ(=O)をも表し得；より好ましくは、R⁶がヘテロシクリルである場合、R⁷はオキソ(=O)をも表し得る。

10

【0061】

あるいは、R⁵およびR⁶は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、O、S、S(O)₂、オキソ(=O)およびNR⁸から選択される追加のヘテロ原子またはヘテロ基を任意選択により含有する4~6員環を形成し；ここで、R⁸は、水素、メチルまたはメトキシである。

【0062】

好ましくは、R⁵およびR⁶は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、OおよびNR⁸から選択される追加のヘテロ原子またはヘテロ基を任意選択により含有する5員または6員環を形成し；ここで、R⁸は、水素、メチルまたはメトキシである。

20

【0063】

より好ましくは、R⁵およびR⁶は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、モルホリノ、1,2-オキサジナニル、1,4-オキサジナニル、ピロリジニルまたはメトキシピペラジニル環を形成する。

【0064】

さらにより好ましくは、R⁵およびR⁶は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、モルホリノ、ピロリジニルまたはメトキシピペラジニル環を形成する。

30

【0065】

一定の実施形態において、R⁶は、C₁₋₃アルキル、C₃アルケニル、C₃アルキニル、C₁₋₄アルコキシカルボニルC₁₋₂アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキルメチルまたはヘテロアリアルから選択され、ここで、シクロアルキルまたはヘテロアリアル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、R⁷から選択される1もしくは2個の置換基によって任意選択により置換され、ここで、R⁷は、メチル、エチル、フルオロおよびメトキシから選択される。

【0066】

好ましくは、式(I)に係る化合物は、表T1(以下)に列挙されている化合物1.1~1.46から選択される。

40

【0067】

好ましくは、本発明の式(I)に係る化合物において、A¹、A²、A³およびA⁴はC-Hであり；

R⁵は水素であり；

R⁶は、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₆アルキニル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニルアミノC₁₋₄アルキル、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₂アルキルまたはヘテロアリアルであり、ここで、ヘテロアリアル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香族環であり、ならびに、ここで、シクロアルキルおよびヘテロアリアル部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、R⁷から選択される1もしくは2個の置換基によ

50

って任意選択により置換されており；ならびに

R⁷は、メチル、エチル、フルオロまたはメトキシである。

【0068】

より好ましくは、A¹、A²、A³およびA⁴はC - Hであり；

R⁵は水素であり；

R⁶は、C₁₋₄アルキル、C₁₋₂ハロアルキル、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₆アルキニル、C₁₋₄アルコキシカルボニルアミノC₁₋₂アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₂アルキルまたはヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、1個の窒素原子を含む6員芳香族環であり、ならびに、ここで、シクロアルキルおよびヘテロアリール部分のいずれかは、同一であっても異なってもよい、R⁷から選択される1

10

もしくは2個の置換基によって任意選択により置換されており；ならびに

R⁷はフルオロまたはメトキシである。

【0069】

さらにより好ましくは、A¹、A²、A³およびA⁴は各々各C - Hであり；

R⁵は水素であり；ならびに

R⁶は、エチル、n - プロピル、2 - フルオロエチル、アリル、プロブ - 2 - イニル、tブトキシカルボニルアミノエチル、シクロプロピルメチル、2, 2 - ジフルオロシクロペンチルまたは6 - メトキシ - 2 - ピリジルである。

【0070】

水性媒体中にある場合、本発明に係る式(I)の化合物は、対応する共有結合的な水和形態(すなわち、CF₃ - オキサジアゾールモチーフで式(I - I b)および式(I - I I b))の化合物として互変異性形態で存在し得る以下に示されている式(I - I a)および式(I - I I a)の化合物)との可逆的な平衡で存在し得ることが理解される。この動的平衡は、式(I)の化合物の生物学的活性に重要であり得る。

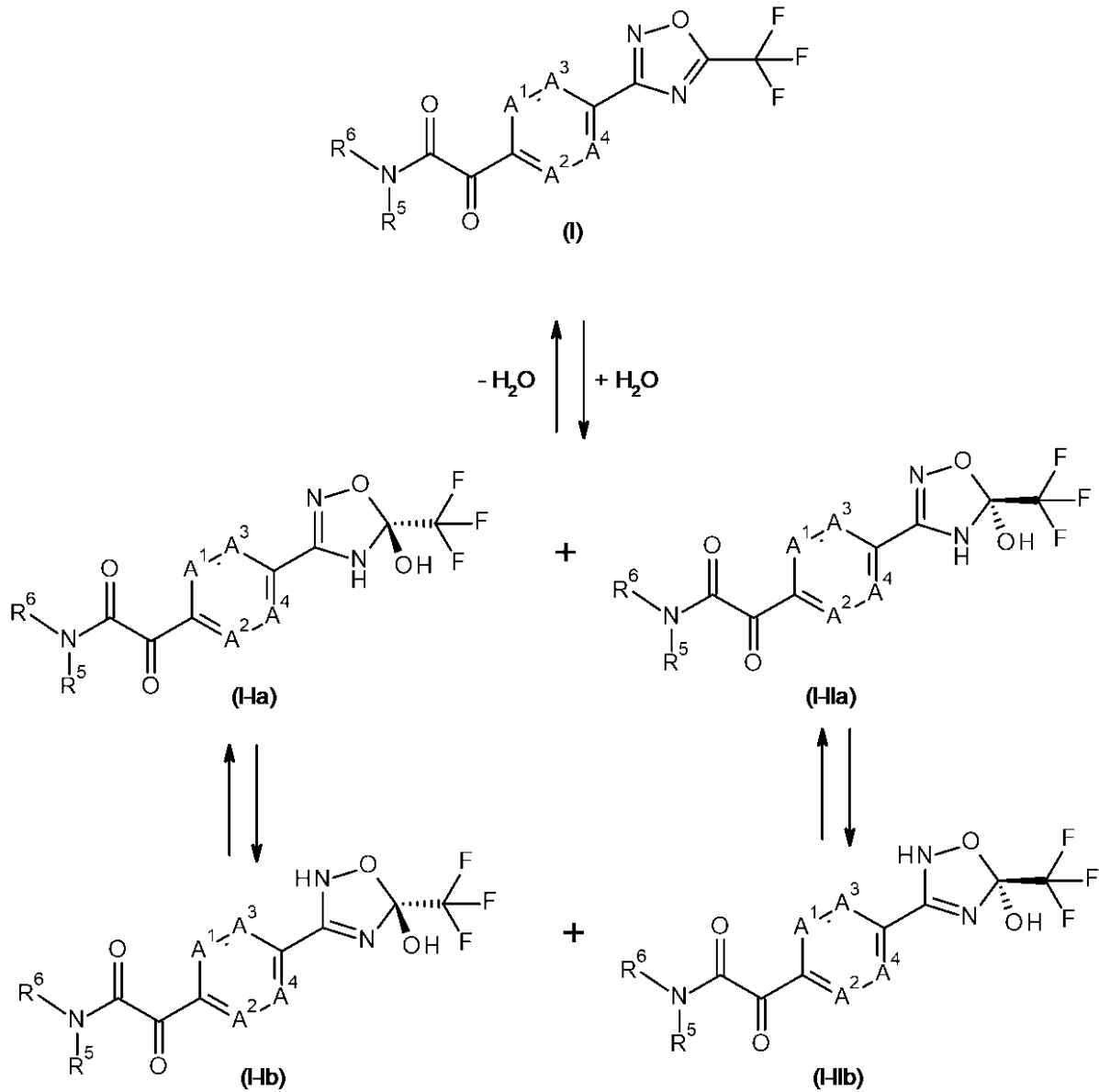
20

【0071】

本発明の式(I)の化合物に関連するA¹、A²、A³、A⁴、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR⁸に係る記載は、一般に式(I - I)および式(I - I I)の化合物に適用され、ならびに、表1. 1 ~ 1. 5(以下)もしくは表2. 1 ~ 2. 3(以下)中の式(I)の化合物、または、表T 1(以下)に記載の化合物1. 1 ~ 1. 46について表記されている、A¹、A²、A³、A⁴、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR⁸の組み合わせに係る特定の開示に適用される。

30

【化2】



10

20

30

【0072】

本発明の化合物は、以下のスキーム1～12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、各可変要素の定義は式(I)の化合物について本明細書に定義されているとおりである。

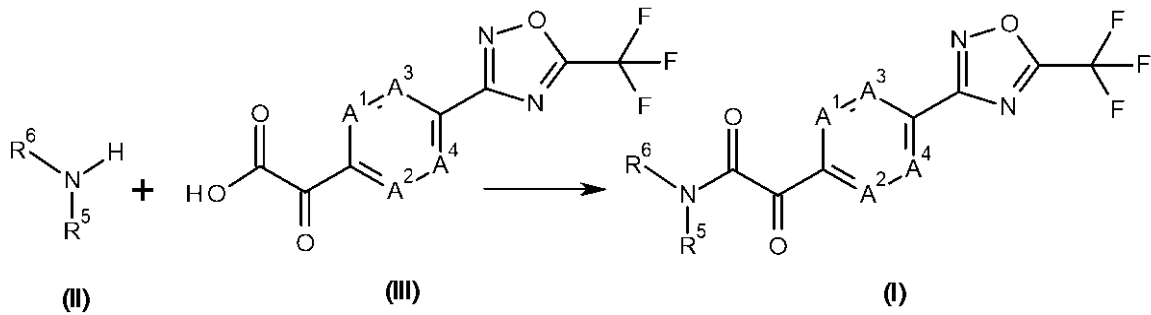
【0073】

式(I)の化合物は、好ましくは好適な溶剤(例えば、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン)中において、好ましくは25～100の温度で、および、任意選択により、トリエチルアミンもしくはN,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下に、または、アミドカップリングについて文献に記載されている条件下で、式(III)の化合物のカルボン酸官能基を活性化させることによる式(II)の化合物および式(III)の化合物を伴うアミドカップリング変換によって得ることが可能である(このプロセスは通常、式(II)の化合物による処理の前に、例えば(COCl)₂またはSOCl₂を用いることにより、カルボン酸の-OHを塩化物基などの良好な脱離基に変換することによって行われる)。例えば、Valeur, E.; Bradley, M. Chem. Soc. Rev. (2009), 38, 606、および、Chinchilla, R., Najera, C. Chem. Soc. Rev. (2011), 40, 5084を参照のこと。式(III)の化合物は既知であるか、または市販されているかのいずれかである。これは以下のスキーム1に示されている。

40

50

【化3】



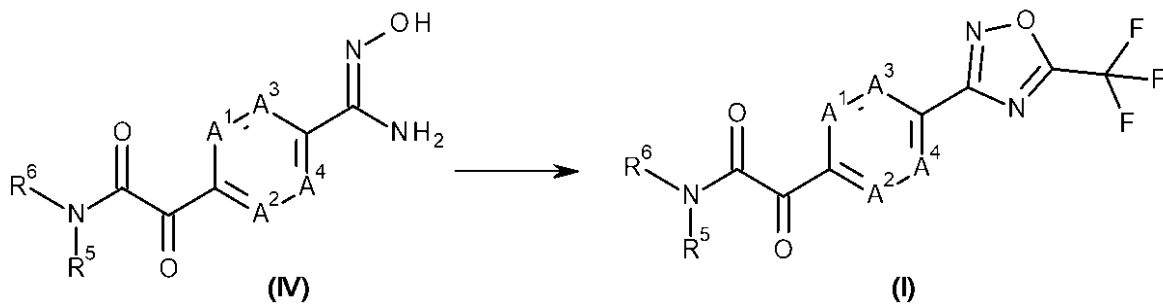
スキーム 1

10

【0074】

あるいは、式 (I) の化合物は、塩基 (例えば、ピリジンまたは 4 - ジメチルアミノピリジン) の存在下に、テトラヒドロフランまたはエタノールなどの好適な溶剤中、25 ~ 75 の温度におけるトリフルオロ酢酸無水物による処理によって、式 (IV) の化合物から調製可能である。関連する例については：国際公開第 2003 / 028729 号および国際公開第 2010 / 045251 号を参照のこと。この反応は以下のスキーム 2 に示されている。

【化4】



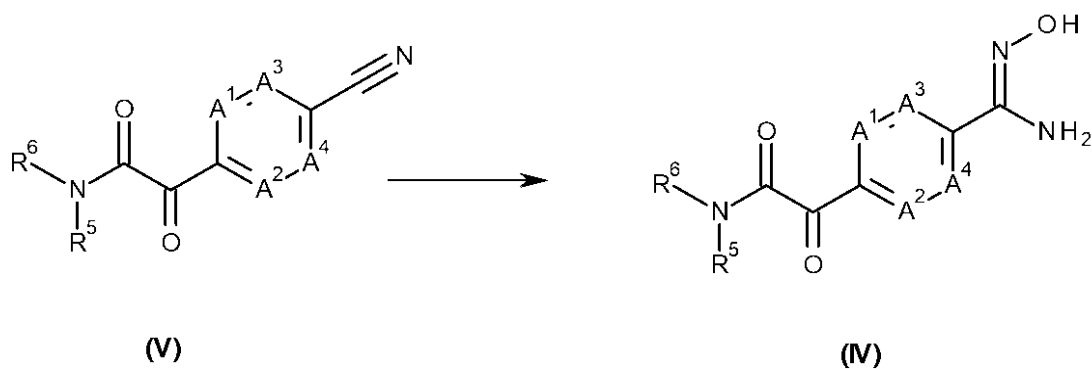
スキーム 2

20

【0075】

式 (IV) の化合物は、トリエチルアミンなどの塩基の存在下に、メタノールなどの好適な溶剤中、0 ~ 100 の温度における塩酸ヒドロキシルアミンによる処理によって、式 (V) の化合物から調製可能である。関連する例については、Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268、および、国際公開第 2013 / 066838 号を参照のこと。この反応は以下のスキーム 3 に示されている。

【化5】



スキーム 3

40

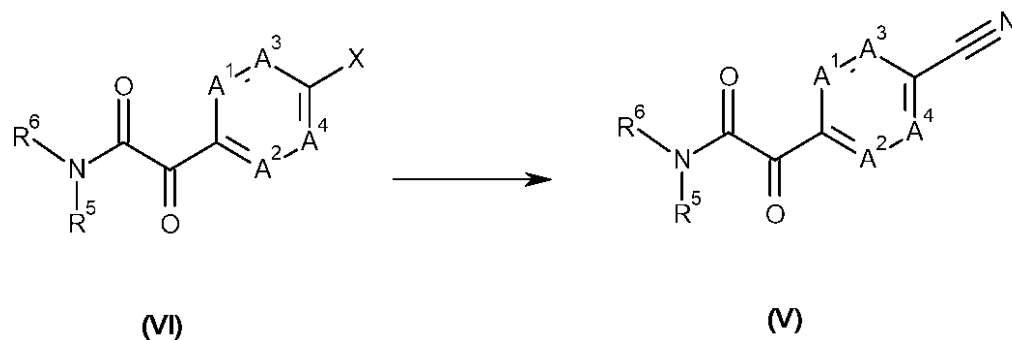
【0076】

式 (V) の化合物は、好適な溶剤 (例えばジメチルホルムアミドまたは N - メチルピロリドン) 中、100 ~ 120 の高温における Pd (0) / Zn (CN)₂ または Cu

50

CNなどの好適なシアン化物試薬を伴う金属促進反応を介して、式(VI)の化合物(式中、XはBrまたはIである)から調製可能である。関連する例については、米国特許出願公開第2007/0155739号明細書、および、国際公開第2009/022746号を参照のこと。この反応は以下のスキーム4に示されている。

【化6】



10

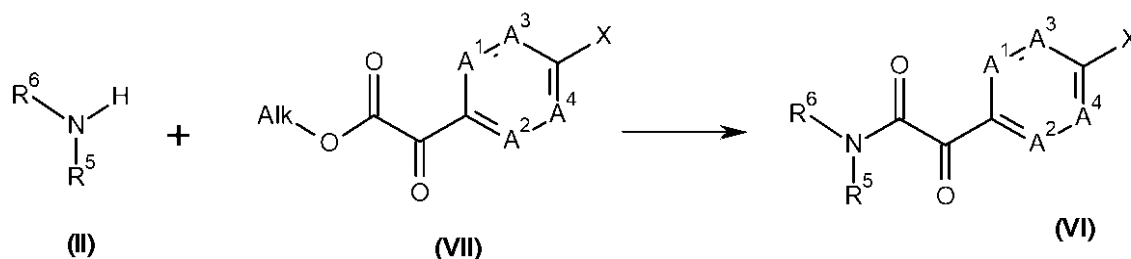
スキーム4

【0077】

式(VI)の化合物(式中、Xは、Br、IまたはCNである)は、好ましくは好適な溶剤(例えば、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン)中、25 ~ 100 の温度における、式(II)の化合物および式(VII)の化合物(式中、Alkはメチルまたはエチルである)を伴うアミドカップリング転換により得ることが可能である。式(II)の化合物および式(VII)の化合物は公知であるか、または、市販されている。この反応は以下のスキーム5に示されている。

20

【化7】



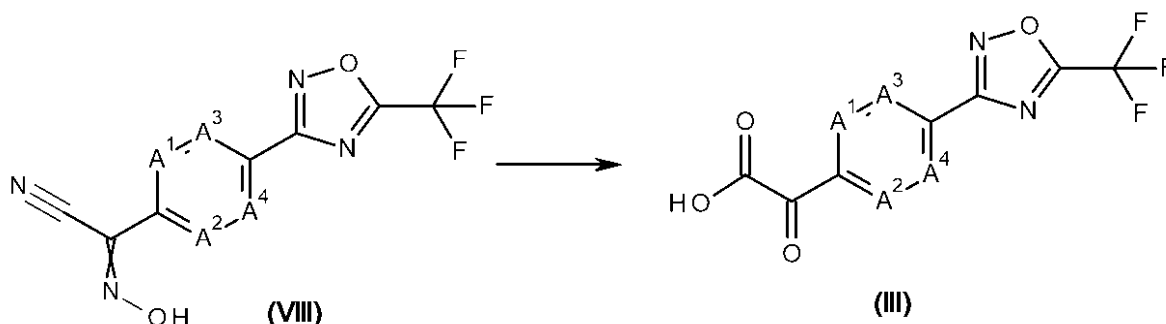
30

スキーム5

【0078】

式(III)の化合物は、80 ~ 100 の高温で、濃縮水性塩酸と、好ましくは酢酸またはトリフルオロ酢酸といった第2の酸性成分とを用いて、式(VIII)の化合物から得ることが可能である。この反応は以下のスキーム6に示されている。

【化8】



40

スキーム6

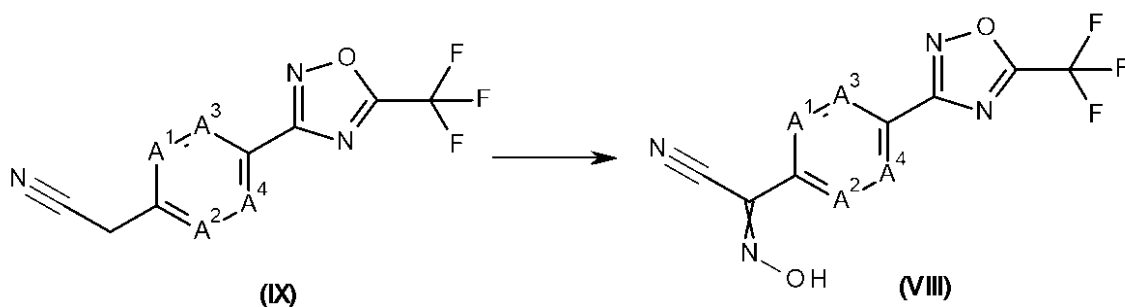
【0079】

式(VIII)の化合物は、酸(例えば、HCl)の存在下、好適な溶剤(例えば、ジオキサン)中、0 ~ 25 の温度において、好ましくは亜硝酸ナトリウムを伴う酸化性

50

条件を用いて、式 (IX) の化合物を得ることが可能である。この反応は以下のスキーム 7 に示されている。

【化 9】



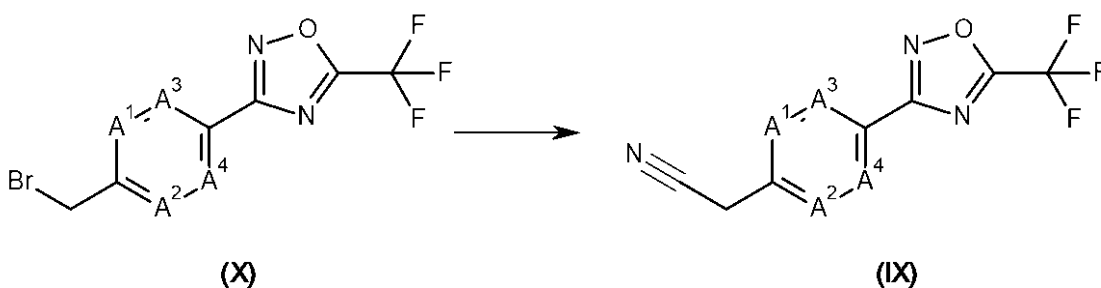
スキーム 7

10

【0080】

式 (IX) の化合物は、フッ化物供給源 (例えば、テトラブチルフッ化アンモニウム) の存在下、好ましくは好適な溶剤 (例えば、アセトニトリルまたは DMSO) 中、0 ~ 25 の温度における、好ましくは KCN またはトリメチルシリルシアニドを伴う求核置換を介して、式 (X) の化合物から得ることが可能である。関連する例については、Friedman, L. Shechter, H. J. Org. Chem. (1960), 877 を参照のこと。この反応は以下のスキーム 8 に示されている。

【化 10】



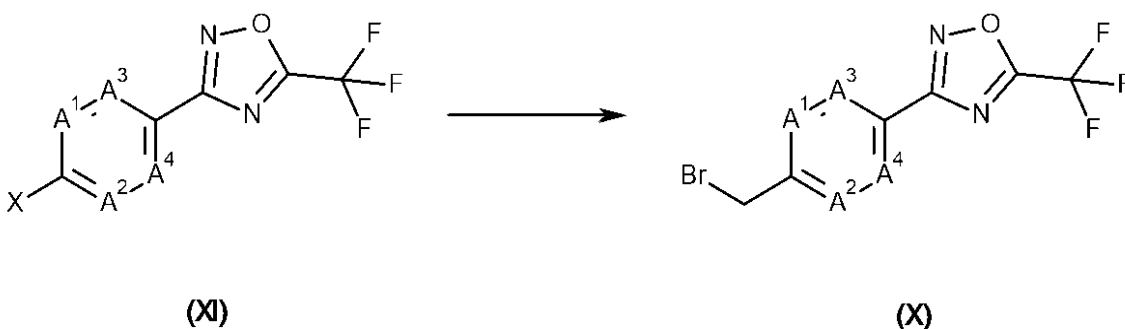
スキーム 8

20

【0081】

式 (X) の化合物は、テトラクロロメタンなどの好適な溶剤中、55 ~ 100 の温度、紫外光の存在下における、ハロゲン供給源 (例えば、N-ブロモスクシンイミド (NBS) または N-クロロスクシンイミド (NCS)) およびラジカル開始剤 (例えば、(PhCO₂)₂ またはアゾビスイソブチロニトリル (AIBN)) を伴う処理によって、式 (XI) の化合物 (式中、X は CH₃ である) から調製可能である。関連する例については、Liu, S. et al Synthesis (2001), 14, 2078 および Kompella, A. et al Org. Proc. Res. Dev. (2012), 16, 1794 を参照のこと。この反応はスキーム 9 に示されている。

【化 11】



スキーム 9

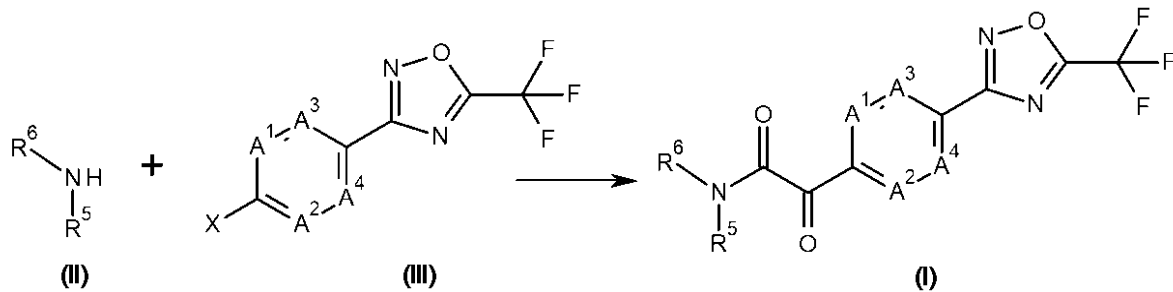
40

【0082】

50

式 (I) の化合物は、一酸化炭素雰囲気 (例えば、5 bar) で、好適な塩基 (例えば、 K_2CO_3) の存在下、好適な溶剤 (例えば、ジオキサン) 中、25 ~ 35 の温度においてパラジウム触媒錯体 (例えば、PEPPSI (商標) - IPr 触媒またはキサントホス - 結合 Pd - 触媒前駆体) を用いて、パラジウム触媒アミノジ - カルボニル化転換を介して、式 (XI) の化合物 (式中、X は I である) および式 (II) のアミンから得ることが可能である。関連する例については、Fang, W. et al. Org. Lett., 2013, 15, 3678; Friis, D. et al. Org. Lett., 2014, 16, 4296 - 4299 を参照のこと。この反応は以下のスキーム 10 に示されている。

【化 12】

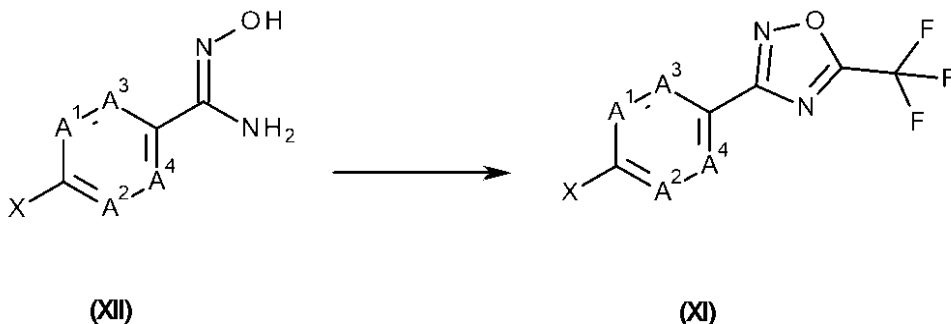


スキーム 10

【0083】

式 (XI) の化合物 (式中、X は I または CH_3 である) は、塩基 (例えば、ピリジンまたは 4 - ジメチルアミノピリジン) の存在下、テトラヒドロフランまたはエタノールなどの好適な溶剤中、25 ~ 75 の温度における、トリフルオロ酢酸無水物、トリフルオロ酢酸クロリドまたはトリフルオロ酢酸フロリドを伴う処理により式 (XII) の化合物から調製可能である。関連する例については、国際公開第 2003/028729 号および国際公開第 2010/045251 号を参照のこと。これはスキーム 11 に示されている。

【化 13】



スキーム 11

【0084】

式 (XIII) の化合物 (式中、X は I または CH_3 である) は、トリエチルアミンなどの塩基の存在下、メタノールなどの好適な溶剤中、0 ~ 100 の温度における、塩酸ヒドロキシルアミンを伴う処理により式 (XIII) の化合物から調製可能である。関連する例については、Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268、および、国際公開第 2013/066838 号を参照のこと。式 (XIII) の化合物は公知であるか、または、市販されている。この反応は以下のスキーム 12 に示されている。

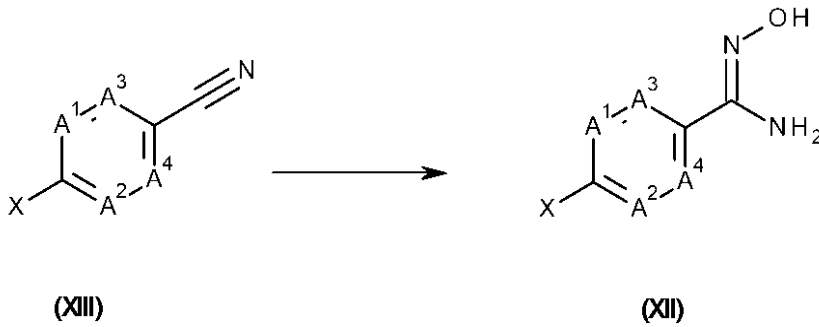
10

20

30

40

【化 1 4】



スキーム 1 2

10

【 0 0 8 5】

既に示されるように、意外なことに、本発明の式 (I) の新規な化合物が、實際上、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非常に有利なレベルの生物学的活性を有することがここで見出された。

【 0 0 8 6】

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有効成分として用いられることが可能である。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性、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。

20

【 0 0 8 7】

本発明はさらに、植物または植物繁殖体および / または収穫された食品作物を処理することによって、微生物被害を受けやすい植物または植物繁殖体および / または収穫された食品作物の外寄生を防除または予防するための方法であって、有効量の式 (I) の化合物が、植物、その一部またはその生息地に適用される方法に関する。

30

【 0 0 8 8】

式 (I) の化合物を殺菌・殺カビ剤として用いることも可能である。「殺菌・殺カビ剤」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖を防除し、変性させ、または、防止する化合物を意味する。「殺菌・殺カビ的に有効な量」という用語は、本明細書において用いられるところ、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 0 8 9】

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り得る。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) の活性化合物はまた、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。

40

【 0 0 9 0】

50

さらに、式(I)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。

【0091】

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。

【0092】

式(I)の化合物は、例えば、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に対して効果的である。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. terreus*) を含むアスペルギルス属の一種 (*Aspergillus* spp.)、A.プルランス (*A. pullulans*) を含むアウレオバシジウム属の一種 (*Aureobasidium* spp.)、ブラストミセスデルマチチディス (*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス (*Blumeria graminis*)、ブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*)、B.ドチデア (*B. dothidea*)、B.オブツサ (*B. obtusa*) のボトリオスファエリア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、B.シネレア (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、C.アルビカンス (*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 (*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)、クラビセプスプルプレア (*Claviceps purpurea*)、コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp)、C.ムサエ (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、クリプトコッカスネオフォルマン (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp)、エルウィニアアミロボラ (*Ervwinia amylovora*)、E.シコラセアルム (*E. cichoracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、F.クルモルム (*F. culmorum*)、F.グラミネアルム (*F. graminearum*)、F.ラングセチエ (*F. langsethiae*)、F.モニリホルメ (*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 (*F. subglutinans*)、F.ソラニ (*F. solani*) を含むフザリウム属の一種 (*Fusarium* spp.)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、ギベレラフジクロイ (*Gibberella*

10

20

30

40

50

a 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ベリ-ヴィルギニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginiana*)、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. capsulatum* を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma spp.*)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、レプトグラフィウムリンデルギ (*Leptographium lindbergi*)、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*)、ミクロスボルム属の一種 (*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. pomi* を含むミコスファエレラ属の一種 (*Mycosphaerella spp.*)、オンコバシジウムテオブロマエオン (*Oncobasidium 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. digitatum*、*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. maydis*、*P. philippinensis* および *P. sorghi* を含むペロノスクレロスポラ属の一種 (*Peronosclerospora spp.*)、ペロノスポラ属の一種 (*Peronospora spp*)、コムギふ枯病菌 (*Phaeosphaeria nodorum*)、ファコブソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フェリヌスイグニアルス (*PHELLINUS igniarius*)、フィアロフォラ属の一種 (*Phialophora spp*)、フォーマ属の一種 (*Phoma spp*)、ホモプシスビティコーラ (*Phomopsis viticola*)、*P. infestans* を含むフィトフトラ属の一種 (*Phytophthora spp.*)、*P. halstedii*、*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.*)、リングうどんこ病菌 (*P. leucotricha*) を含むポドスファエラ属の一種 (*Podosphaera spp.*)、ポリミキサグラミニス (*Polymyxa graminis*)、ポリミキサベタエ (*Polymyxa betae*)、シュードセルコスボレラヘルポトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、シュードモナス属の一種 (*Pseudomonas spp*)、*P. cubensis*、*P. humuli* を含むシュードペロノスポラ属の一種 (*Pseudoperonospora spp.*)、シュードペジザトラケイフィラ (*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. hordei*、*P. recondita*、*P. striiformis*、*P. 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. 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*)、

リゾプスアリズス (*Rhizopus arrhizus*)、リンコスポリウム属の一種 (*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. prolificans*) 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*)、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. トリティシ* (*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 fuliginosa*))、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ラ (*Thielaviopsis basicola*)、チレチア属の一種 (*Tilletia* spp)、*T. ハルジアヌム* (*T. harzianum*)、*T. シュードコニングイ* (*T. pseudokoningii*)、*T. ヴィリデ* (*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. イナエクアリス* (*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)。

【0093】

式 (I) の化合物は、例えば芝生、観賞用作物、例えば花、低木、広葉樹または常緑樹、例えば針葉樹に、ならびに、樹木注入、有害生物管理などに使用され得る。

【0094】

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。

【0095】

「有用な植物」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、HPD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-ピロビル-シキメート-3-リン酸塩-シターゼ）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。

10

【0096】

「有用な植物」という用語は、トキシン-産生バクテリア、特にバチルス属（*Bacillus*）の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有する、組換えDNA技術を用いることで形質転換された有用な植物を含むとも理解されるべきである。

【0097】

このような植物の例は、YieldGard（登録商標）（CryIA（b）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Rootworm（登録商標）（CryIIB（b1）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Plus（登録商標）（CryIA（b）およびCryIIB（b1）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry9（c）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（CryIF（a2）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）（CryIA（c）トキシンを発現する綿品種）；Bollgard I（登録商標）（CryIA（c）トキシンを発現する綿品種）；Bollgard II（登録商標）（CryIA（c）およびCryIIA（b）トキシンを発現する綿品種）；VIPCOT（登録商標）（VIPトキシンを発現する綿品種）；NewLeaf（登録商標）（CryIIIA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）、Agrisure（登録商標）RW（コーンルートワーム形質）およびProtecta（登録商標）である。

20

30

【0098】

「作物」という用語は、例えば、トキシン-産生バクテリア、特にバチルス属（*Bacillus*）の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作物植物も含むと理解されるべきである。

40

【0099】

かかる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エ（*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-エンドトキシンなどのバチルスチューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）由来の殺虫性タンパク質、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、フォトラバダスルミネッセンス（*Photographus lum*

50

inescens)、ゼノラバダスネマトフィルス(Xenorhabdus nematophilus)などの、例えばフォトラバダス属の一種(Photorhabdus spp.)もしくはゼノラバダス属の一種(Xenorhabdus spp.)といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質;サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ(wasp)トキシン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、パパイン抑制剤などのプロテナーゼ抑制剤;リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サボリンまたはプ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、スチルベンシントラーゼ、ビベンジルシントラーゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。

10

【0100】

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-エンドトキシン、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号を参照のこと)。

20

【0101】

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例が、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

30

【0102】

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

40

【0103】

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。

【0104】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含む形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は:YieldGard(登録商標)(Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種);YieldGardRootworm(登録商標)(Cry3Bb1トキシンを発現するト

50

ウモロコシ品種) ; YieldGard 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。

10

【0105】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである :

1 . Syngenta Seeds SAS , Chemin de l 'Hobit 27 , F - 31 790 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。

20

【0106】

2 . Syngenta Seeds SAS , Chemin de l 'Hobit 27 , F - 31 790 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。

30

【0107】

3 . Syngenta Seeds SAS , Chemin de l 'Hobit 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号に記載されている。

40

【0108】

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。

【0109】

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 。

50

【0110】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue T edesco, 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。

【0111】

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グエンシス (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。

【0112】

本明細書において用いられるところ、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、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、種子が土壤に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壤、種子および実生、ならびに、確立した植生を含む。

【0113】

「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。

【0114】

「植物繁殖体」という用語は、その増殖に用いられることが可能である種子などの植物の生殖部、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。発芽後もしくは土壤から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物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。

【0115】

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。

【0116】

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 号に記載されている。

【0117】

10

20

30

40

50

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。有効成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0118】

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有効成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フラー土、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%の有効成分と少量の湿潤剤、分散剤または乳化剤とを含有する。

10

【0119】

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。有効成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0120】

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%の有効成分を含有し、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。

20

30

【0121】

粉剤は、有効成分と、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。

【0122】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された有効成分の小滴または顆粒である。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に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル~1センチメートル、好ましくは1~2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押し出し成形、凝塊もしくはブ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。

40

【0123】

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

50

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有効成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って有効成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機もまた用いられ得る。

【0124】

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。

【0125】

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ビエート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサソラン、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、γ-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ル、ヘキサノール、オクタノール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。

【0126】

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。

【0127】

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_{sub}.18エトキシレートなどのアルキルフェノール-アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール-C_{sub}.16エトキシレートなどのアルコール-アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレン

10

20

30

40

50

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 1 2 8 】

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、浸透補助剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤および固着剤が挙げられる。

10

【 0 1 2 9 】

さらに加えて、他の殺生性有効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、これらのさらなる有効成分は、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有効成分は、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤および/または植物成長調節剤であり得る。

【 0 1 3 0 】

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。

20

【 0 1 3 1 】

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 1 3 2 】

式（I）の化合物は通常農芸化学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、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であることが可能であり、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伴う混合物であることが可能である。

30

【 0 1 3 3 】

式（I）の化合物は、有効成分として少なくとも１種の式（I）の化合物を含む、植物病原性微生物に対する防除もしくは保護のための（殺菌・殺カビ）組成物の形態で用いられ得、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本明細書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。

40

【 0 1 3 4 】

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

【 0 1 3 5 】

50

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

【 0 1 3 6 】

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

10

20

【 0 1 3 7 】

好適な追加の有効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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 - ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン - 5 - イル) - アミド、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸メトキシ - [1 - メチル - 2 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - エチル] - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (2 - ジクロロメチレン - 3 - エチル - 1 - メチル - インダン - 4 - イル) - アミド (1 0 7 2 9 5 7 - 7 1 - 1)、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (4 ' - メチルスルファニル - ビフェニル - 2 - イル) - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 4 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 [2 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチル - エチル] - アミド、(5 - クロロ - 2 , 4 - ジメチル - ピリジン - 3 - イル) - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フェニル) - メタノン、(5 - 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 - 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 - イミノアセトアミド、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 - メトキシアセトアミド] - y - ブチロラクトン、4 - クロロ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 5 - p - トリルイミダゾール - 1 - スルホンアミド、N - アリル - 4 , 5 , - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフエン - 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

30

40

50

ミド、N - (2 - メトキシ - 5 - ピリジル) - シクロプロパンカルボキサミド、(. + -
 .) - 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 '
 - ジブromo - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 ' - トリフルオロメチル - 1 ,
 3 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、1 - イミダゾリル - 1 - (4 ' - クロロフェ
 ノキシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - オン、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 -
 シアノフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] 3 - メトキシアクリレート
 、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - チオアミドフェノキシ) ピリミジン - 4 - イル
 オキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2
 - フルオロフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリ
 レート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 , 6 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン
 - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 -
 [3 - (ピリミジン - 2 - イルオキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (5 - メチルピリミジン - 2 - イルオキシ) - フ
 エノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (
 フェニル - スルホニルオキシ) フェノキシ] フェニル - 3 - メトキシアクリレート、メチ
 ル (E) - 2 - [2 - [3 - (4 - ニトロフェノキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メ
 トキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - フェノキシフェニル] - 3 - メトキシア
 クリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジメチル - ベンゾイル) ピロール - 1
 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - メトキシフェノ
 キシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 [2 - (2 - フェニル
 エテン - 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2
 - (3 , 5 - ジクロロフェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、
 メチル (E) - 2 - (2 - (3 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェノキ
 シ) フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - [3 - (- ヒ
 ドロキシベンジル) フェノキシ] フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E)
 - 2 - (2 - (4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオキシ) フェニル) - 3 - メトキシア
 クリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - n - プロピルオキシ - フェノキシ) フェニ
 ル] 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - イソプロピルオキシフ
 エノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (
 2 - フルオロフェノキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル
 (E) - 2 - [2 - (3 - エトキシフェノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート
 、メチル (E) - 2 - [2 - (4 - 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)
 - 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 - 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

10

20

30

40

50

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 10
 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; 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 (20
 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
 アジン - 2 - チオン、N - (2 - p - クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリ
 ド、アシベンゾラル、アシペタックス、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジモルフ
 、アリシン、アリルアルコール、アメトクトラジン、アミスルプロム、アモバム、アンブ
 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、ベンゾピンジフルピル、ベルベリン、ベトキサジン、ピロキサゾール、
 ピナパクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、ピキサフェン、プラストサ
 イジン - S、ポスカリド、プロモタロニル、プロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベ
 ート、ブチルアミン多硫酸カルシウム、カプタホール、キャプタン、カルバモルフ、カル
 ベンダジム、カルベンダジムクロリドレート、カルボキシ、カルプロパミド、カルボン
 、CGA 4 1 3 9 6、CGA 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、クリンバゾール、クロトリマ
 ザール、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、シフルフェナミド、シモキサニル、
 シペンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、デカフェ
 ンチン、デヒドロ酢酸、ジ - 2 - ピリジルジスルフィド 1, 1' - ジオキシド、ジクロフ
 ルアニド、ジクロメジン、ジクロン、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
 ノゾコート、ジフルメトリム、O - ジ - イソ - プロピル - S - ベンジルチオホスフェート、
 ジメフルアゾール、ジメタクロン、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモール、
 ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、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、ドラゾキソロン、エディフェンホス、エネス
 トロブリン、エボキシコナゾール、エタコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモー 50

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、フェンピコキサミド、フェンプロビジン、フェンプロビ
 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、フルジオキソニル、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
 ザール、フルオキサストロピン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミ
 ド、フルタニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、
 ホルムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、フルカル
 バニル、フルコナゾール、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、イブフェントリフルコナゾール、イプロベンホス、イブロジオン、イ
 プロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、イソピラザム
 、イソチアニル、イソバレジオン、イゾバムホス、カスガマイシン、クレソキシム-メチ
 ル、LY186054、LY211795、LY248908、マンコゼブ、マンジプロ
 パミド、マンネブ、メベニル、メカルピンジド、メフェノキサム、メフェントリフルコナ
 ザール、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、塩化第一水銀、メブチルジノカップ
 、メタラキシル、メタラキシル-M、メタム、メタゾキシロン、メトコナゾール、メタス
 ルホカルブ、メタフロキサム、臭化メチル、ヨウ化メチル、メチルイソチオシアネート、
 メチラム、メチラム-亜鉛、メトミノストロピン、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、オリザストロピン、
 オストール、オキサジキシル、オキサスルフロン、オキサチアピプロリン、オキシ銅、
 オキソリン酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシ、パリノール、ペフラゾエート
 、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンチオ
 ピラド、フェナマクリル、フェナジンオキシド、ホスジフェン、ホセチル-A1、リン酸
 、フタリド、ピコキシストロピン、ピペラリン、ポリカルバメート、ポリオキシンド、ポ
 リオキシリム、ポリラム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパミジン
 、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロ
 チオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフルメトフェン、ピラカルボリド、ピラクロスト
 ロピン、ピラメトロストロピン、ピラオキシストロピン、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、
 ラベンザゾール、サントニン、セダキサ、シルチオファミ、シメコナゾール、シブコナ
 ザール、5塩化石炭酸ナトリウム、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、スルト
 ロペン、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テト
 ラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン、チフルザミド、2-(
 チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオフアネート-メチル、チオキノックス、
 チラム、チアジニル、チミベンコナゾール、チオキサミド、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ピン
 、トリフルマゾール、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、ウニコナゾ
 ール、ウルバシド、バリダマイシン、バリフェナレート、ババム、ピンクロゾリン、ザリル

10

20

30

40

50

アミド、ジネブ、ジラム、およびゾキサミド。

【0138】

本発明の化合物はまた、駆虫薬薬剤との組み合わせで用いられ得る。このような駆虫薬としては、欧州特許第357460号明細書、欧州特許第444964号明細書および欧州特許第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号および国際公開第9522552号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、レバミソール、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、オキサ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ルスロンなどのフルキシド、ならびに、ブラジカンテルおよびエプシランテルなどのセストサイド (cestocide) が挙げられる。

10

【0139】

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。

20

【0140】

本発明の化合物は、国際公開第96/15121号に記載されている一般的なクラスのジオキソモルホリン抗寄生虫性薬剤の誘導体および類似体との組み合わせで、また、国際公開第96/11945号、国際公開第93/19053号、国際公開第93/25543号、欧州特許第0626375号明細書、欧州特許第0382173号明細書、国際公開第94/19334号、欧州特許第0382173号明細書、および、欧州特許第0503538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。

30

【0141】

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。

【0142】

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

40

【0143】

本発明の化合物が組み合わせられて用いられ得るこのような生物学的に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。

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、フェニトロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、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

50

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、プロバホス、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。

【0144】

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、エチオフエンカルブ、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、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、UC-51717。

10

【0145】

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、フェンプロバトリン、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。

20

【0146】

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。

30

【0147】

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、ピナバクリル、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、カンフェクロル、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナピル、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

40

50

、WL - 108477、ピリダリル、プロパルギット、プロトリフェンブト、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。

【0148】

生物剤：パチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*)、パ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。

10

【0149】

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。

【0150】

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、フロルフエニコール、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。

20

【0151】

式 (I) の化合物と有効成分との以下の混合物が好ましい。略記「TX」は、表 1.1 ~ 1.5、2.1 ~ 2.3、または表 T1 (化合物 1.1 ~ 1.46) (以下) 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 からなる物質の群から選択される補助剤、

1,1 - ビス (4 - クロロフェニル) - 2 - エトキシエタノール (IUPAC 名) (910) + TX、2,4 - ジクロロフェニルベンゼンスルホネート (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1059) + TX、2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - ナフチルアセトアミド (IUPAC 名) (1295) + TX、4 - クロロフェニルフェニルスルホン (IUPAC 名) (981) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセキノシル (3) + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、シペルメトリン (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、AVI 382 (化合物コード) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、アジンホス - エチル (44) + TX、アジンホス - メチル (45) + TX、アゾベンゼン (IUPAC 名) (888) + TX、アゾシクロチン (46) + TX、アゾトエート (889) + TX、ベノミル (62) + TX、ベノキサホス (代替名) [CCN] + TX、ベンゾキシメート (71) + TX、ベンジル安息香酸塩 (IUPAC 名) [CCN] + TX、ピフェナゼート (74) + TX、ピフェントリン (76) + TX、ピナパクリル (907) + TX、プロフェンパレレート (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、プトカルボキシム (103) + 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、多硫化カルシウム (IUPAC 名) (111) + TX、カンフェクロル (941) + TX、カーパノレート (943) + TX、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、カルボフェノチオン (947) + TX、CGA 50'439 (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、クロルジメホルム塩酸塩 (964) + TX、

30

40

50

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(97
 7)+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)+T
 X、シネリン(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、クロトキシホス(1010)+TX、クフラネブ(1013)+TX、シアン
 トエート(1020)+TX、シフルメトフェン(CAS登録番号:400882-07
 -7)+TX、シハロトリン(196)+TX、シヘキサチン(199)+TX、シペル
 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)+T
 X、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(1
 042)+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、ジエノクロル(1071)+TX、ジメホックス
 (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ソ(1089)+TX、ジノ
 ブトン(269)+TX、ジノカップ(270)+TX、ジノカップ-4[CCN]+T
 X、ジノカップ-6[CCN]+TX、ジノクトン(1090)+TX、ジノペントン(1
 092)+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、エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121)+
 TX、EPN(297)+TX、エプリノメクチン(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(3
 37)+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
 アニル(1161)+TX、フェンバレレート(349)+TX、フィブロニル(354
)+TX、フルアクリピリム(360)+TX、フルアズロン(1166)+TX、フル
 ベンジミン(1167)+TX、フルシクロクスロン(366)+TX、フルシトリネー
 ト(367)+TX、フルエネチル(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、FMC 1137(開発コード)(1185)+TX、ホル
 メタネート(405)+TX、ホルメタネート塩酸塩(405)+TX、ホルモチオン
 (1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、-HCH(430)+T
 X、グリオジン(1205)+TX、ハルフェンブロックス(424)+TX、ヘプテノ
 ホス(432)+TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート(IUPAC/ケ
 ミカルアブストラクツ名)(1216)+TX、ヘキシチアゾクス(441)+TX、ヨ
 ードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イソカルボホス(代替名)(473)+
 TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)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(6
 96)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ヨードフェンホス(1248)+T

10

20

30

40

50

X、リンダン(430)+TX、ルフェヌロン(490)+TX、マラチオン(492)+TX、マロノベン(1254)+TX、メカルバム(502)+TX、メホスホラン(1261)+TX、メスルフェン(代替名)[CCN]+TX、メタクリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メソミル(531)+TX、臭化メチル(537)+TX、メトルカルブ(550)+TX、メピンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホックス(1293)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、NC-512(化合物コード)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニコマイシン(代替名)[CCN]+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラチオン(615)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホキシム(642)+TX、ピリミホス-メチル(652)+TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(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、プロバルギット(671)+TX、プロベタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロトエート(1362)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、キナルホス(711)+TX、キンチオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、RA-17(開発コード)(1383)+TX、ロテノン(722)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、ソファミド(1402)+TX、スピロジクロフェン(738)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、SSI-121(開発コード)(1404)+TX、スルフィラム(代替名)[CCN]+TX、スルフルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、硫黄(754)+TX、SZI-121(開発コード)(757)+TX、フルバリネート(398)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、TEPP(1417)+TX、テルバム(代替名)+TX、テトラクロルピンホス(777)+TX、テトラジホン(786)+TX、テトラナクチン(代替名)(653)+TX、テトラスル(1425)+TX、チアフェノックス(代替名)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオファノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオキノックス(1436)+TX、ツリンギエンシン(代替名)[CCN]+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアラテン(1443)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリクロルホン(824)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリアクチン(代替名)(653)+TX、パミドチオン(847)+TX、パニリプロール[CCN]およびYI-5302(化合物コード)+TXからなる物質の群から選択される殺ダニ剤、ベトキサジン[CCN]+TX、ニオクタン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、硫酸銅(172)+TX、シプトリン[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、キノナミド(1379)+TX、シマジン(730)+TX、酢酸トリフェニル

10

20

30

40

50

スズ (IUPAC名) (347) および水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX からなる物質の群から選択される殺藻剤、

アバメクチン (1) + TX、クルホメート (1011) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エブリノメクチン (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 からなる物質の群から選択される駆虫薬、

クロラコース (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) およびストリキニーネ (745) + TX からなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1 - ヒドロキシ - 1H - ピリジン - 2 - チオン (IUPAC名) (1222) + TX、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC名) (748) + TX、8 - ヒドロキシキノリン硫酸塩 (446) + TX、プロノポール (97) + TX、二オクタン酸銅 (IUPAC名) (170) + TX、水酸化銅 (IUPAC名) (169) + TX、クレゾール [CCN] + TX、ジクロロフェン (232) + TX、ジピリチオン (1105) + TX、ドジシン (1112) + TX、フェナミノスルフ (1144) + TX、ホルムアルデヒド (404) + TX、ヒドラルガフェン (代替名) [CCN] + TX、カスガマイシン (483) + TX、カスガマイシン塩酸塩水和物 (483) + TX、ニッケルビス (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、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩 (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硫酸塩 (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 からなる物質の群から選択される殺菌剤、

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、アムプリセイウス属 (*Amblyseius* spp.) (代替名) (19) + TX、アナグラファファルシフェラ (*Anagrapha 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、オートグラファカリホルニカ (*Autographa californica*) NPV (代替名) (38) + TX、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) (代替名) (48) + TX、バチルススファエリクスネイデ (*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49) + TX、バチルスチューリングゲンシスベルリナー (*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis* subsp. aizawai) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. israelensis) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. japonensis) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. kurstaki) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis* subsp. tenebrionis

10

20

30

40

50

) (学名) (51) + TX、ポーベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ポーベリアブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオヒメテントウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリング (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) および H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アクリズム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV および N. レコンテイ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイネルネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマカルポカブサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラビス (*Steinernema riobravavis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマスカプテリスキ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ属 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) およびベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX、枯草菌変種アミロリケファシエンズ (*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) 菌株 FZB24 (Novozymes Biologicals Inc. (5400 Corporate Circle, Salem, VA 24153, U.S.A.) から入手可能、商標 Taegro (登録商標) で知られている) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、
 ヨードメタン (IUPAC 名) (542) および臭化メチル (537) + TX からなる物質の群から選択される土壌滅菌剤、

10

20

30

40

50

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、チオヘンパ (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 からなる物質の群から選択される不妊化剤、

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートを伴う (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC 名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールを伴う 4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC 名) (544) + TX、 - マルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、プレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルア (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、キュウルア (代替名) (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート (IUPAC 名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシップルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (589) + TX、オルフラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタールア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (785) + 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 B₁ (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₂ (代替名) (839) + T

10

20

30

40

50

X、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からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

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

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

10

20

30

40

50

ミカルアブストラクツ名) (892) + TX、バルトリン [CCN] + TX、Bayer
 22/190 (開発コード) (893) + TX、Bayer 22408 (開発コード)
) (894) + TX、ベンジオカルブ (58) + TX、ベンフラカルブ (60) + TX、
 ベンスタップ (66) + TX、 - シフルトリン (194) + TX、 - シベルメトリ
 ン (203) + TX、ピフェントリン (76) + TX、ピオアレトリン (78) + TX、
 ピオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (代替名) (79) + TX、ピオエタノメト
 リン [CCN] + TX、ピオベルメトリン (908) + TX、ピオレスメトリン (80)
 + TX、ピス (2 - クロロエチル) エーテル (IUPAC名) (909) + TX、ピスト
 リフルロン (83) + TX、ハウ砂 (86) + TX、プロフェンバレート (代替名) +
 TX、プロムフェンピンホス (914) + TX、プロモシクレン (918) + TX、プロ
 モ - DDT (代替名) [CCN] + TX、プロモホス (920) + TX、プロモホス - エ
 チル (921) + TX、プフェンカルブ (924) + TX、ププロフェジン (99) + T
 X、ブタカルブ (926) + TX、ブタチオホス (927) + TX、プトカルボキシム (1
 03) + 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、カズサホス (109) + TX、ヒ酸カルシウム [C
 CN] + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、多硫化カルシウム (IUPAC
 名) (111) + TX、カンフェクロル (941) + TX、カーバノレート (943) +
 TX、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (IU
 PAC / ケミカルアブストラクツ名) (945) + TX、四塩化炭素 (IUPAC名) (9
 46) + 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、カルタップ塩酸塩 (123) + TX、セバジン (代
 替名) (725) + TX、クロルピシクレン (960) + TX、クロルダン (128) +
 TX、クロルデコン (963) + TX、クロルジメホルム (964) + TX、クロルジメ
 ホルム塩酸塩 (964) + TX、クロルエトキシホス (129) + TX、クロルフェナピ
 ル (130) + TX、クロルフェンピンホス (131) + TX、クロルフルアズロン (1
 32) + TX、クロルメホス (136) + TX、クロロホルム [CCN] + TX、クロロ
 ピクリン (141) + TX、クロルホキシム (989) + TX、クロルブラゾホス (99
 0) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロルピリホス - メチル (146) + T
 X、クロルチオホス (994) + TX、クロマフェノジド (150) + TX、シネリン I
 (696) + TX、シネリン II (696) + TX、シネリン (696) + TX、シス -
 レスメトリン (代替名) + TX、シスメトリン (80) + TX、クロシトリン (代替名)
 + TX、クロエトカルブ (999) + TX、クロサンテル (代替名) [CCN] + TX、
 クロチアニジン (165) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、ヒ酸銅 [CCN]
 + TX、オレイン酸銅 [CCN] + TX、クマホス (174) + TX、クミトエート (1
 006) + 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、CS
 708 (開発コード) (1012) + TX、シアノフェンホス (1019) + TX、シ
 アノホス (184) + TX、シアントエート (1020) + TX、シクレトリン [CCN
] + TX、シクロプロトリン (188) + TX、シフルトリン (193) + TX、シハロ
 トリン (196) + TX、シベルメトリン (201) + TX、シフェノトリン (206)
 + TX、シロマジン (209) + TX、サイチオアート (代替名) [CCN] + TX、d
 - リモネン (代替名) [CCN] + TX、d - テトラメトリン (代替名) (788) + T
 X、DAEP (1031) + TX、ダゾメット (216) + TX、DDT (219) + T
 X、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 (10
 37) + 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 (1
 038) + 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

10

20

30

40

50

ン(1050)+TX、ジクロフェンチオン(1051)+TX、ジクロルボス(236)
)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジクレシル(代替名)[CCN]+TX、ジク
 ロトホス(243)+TX、ジシクラニル(244)+TX、ディルドリン(1070)
)+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルホスフェート(IUPAC名)(10
 76)+TX、ジフルベンズロン(250)+TX、ジロール(代替名)[CCN]+T
 X、ジメフルトリン[CCN]+TX、ジメHOOKS(1081)+TX、ジメタン(1
 085)+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(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)+T
 X、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(2
 78)+TX、ジチクロホス(1108)+TX、DNOC(282)+TX、ドラメク
 チン(代替名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、エクジステロン(代替名
) [CCN]+TX、EI 1642(開発コード)(1118)+TX、エマメクチン
 (291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、EMPC(1120)+
 TX、エンペントリン(292)+TX、エンドスルファン(294)+TX、エンドチ
 オン(1121)+TX、エンドリン(1122)+TX、EPBP(1123)+TX
 、EPN(297)+TX、エポフェノナン(1124)+TX、エプリノメクチン(代
 替名)[CCN]+TX、エスフェンバレート(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(3
 12)+TX、ギ酸エチル(IUPAC名)[CCN]+TX、エチル-DDD(代替
 名)(1056)+TX、二臭化エチレン(316)+TX、二塩化エチレン(化学名)
 (1136)+TX、エチレンオキシド[CCN]+TX、エトフェンプロックス(31
 9)+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)+T
 X、フェンクローホス(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(3
 36)+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、フェンプロバトリン(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(3
 46)+TX、フェンチオン-エチル[CCN]+TX、フェンバレート(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(3
 70)+TX、フルフェンプロックス(1171)+TX、フルメトリン(372)+
 TX、フルバリネート(1184)+TX、FMC 1137(開発コード)(1185
)+TX、ホノホス(1191)+TX、ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネ
 ート塩酸塩(405)+TX、ホルモチオン(1192)+TX、ホルムバラネート(1
 193)+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(4
 12)+TX、フレトリン(1200)+TX、-シハロトリン(197)+TX、
 -HCH(430)+TX、グアザチン(422)+TX、グアザチン酢酸塩(422
)+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ハルフェンプロックス(424
)+TX、ハロフェノジド(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(10
 70)+TX、ヘプタクロール(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)+T
 X、ヒドラメチルノン(443)+TX、シアン化水素(444)+TX、ハイドロブレ

10

20

30

40

50

ン(445)+TX、ヒキンカルブ(1223)+TX、イミダクロプリド(458)+TX、イミプロトリン(460)+TX、インドキサカルブ(465)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、イサゾホス(1231)+TX、イソベンザン(1232)+TX、イソカルボホス(代替名)(473)+TX、イソドリン(1235)+TX、イソフェンホス(1236)+TX、イソラン(1237)+TX、イソプロカルブ(472)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473)+TX、イソプロチオラン(474)+TX、イソチオエート(1244)+TX、イソキサチオン(480)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ジャスモリンI(696)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ヨードフェンホス(1248)+TX、幼若ホルモンI(代替名)[CCN]+TX、幼若ホルモンII(代替名)[CCN]+TX、幼若ホルモンIII(代替名)[CCN]+TX、ケレバン(1249)+TX、キノブレン(484)+TX、シハロトリン(198)+TX、ヒ酸鉛[CCN]+TX、レピメクチン(CCN)+TX、レプトホス(1250)+TX、リンダン(430)+TX、リリムホス(1251)+TX、ルフェヌロン(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、マジドックス(1255)+TX、メカルバム(502)+TX、メカルフォン(1258)+TX、メナゾン(1260)+TX、メホスホラン(1261)+TX、塩化第一水銀(513)+TX、メスルフェンホス(1263)+TX、メタフルミゾン(CCN)+TX、メタム(519)+TX、メタムカリウム(代替名)(519)+TX、メタムナトリウム(519)+TX、メタクリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、メタンスルホニルフルオリド(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1268)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メトクロトホス(1273)+TX、メソミル(531)+TX、メトブレン(532)+TX、メトキン-ブチル(1276)+TX、メトトリリン(代替名)(533)+TX、メトキシクロル(534)+TX、メトキシフェノジド(535)+TX、臭化メチル(537)+TX、メチルイソチオシアネート(543)+TX、メチルクロロホルム(代替名)[CCN]+TX、塩化メチレン[CCN]+TX、メトフルトリン[CCN]+TX、メトルカルブ(550)+TX、メトキサジアゾン(1288)+TX、メピンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホックス(1293)+TX、ミレックス(1294)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナフタロホス(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、ナフタレン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1303)+TX、NC-170(開発コード)(1306)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、ニコチン(578)+TX、硫酸ニコチン(578)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニテンピラム(579)+TX、ニチアジン(1311)+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、ノルニコチン(慣用名)(1319)+TX、ノバルロン(585)+TX、ノビフルムロン(586)+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057)+TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1074)+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1075)+TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424)+TX、オレイン酸(IUPAC名)(593)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデメトンメチル(609)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホト

10

20

30

40

50

ン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN]+TX、パラチオン(615)+TX、パラチオン-メチル(616)+TX、ペンフルロン(代替名)[CCN]+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、PH 60-38(開発コード)(1328)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェノトリン(630)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスニクロル(1339)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、ホキシム(642)+TX、ホキシム-メチル(1340)+TX、ピリメタホス(1344)+TX、ピリミカーブ(651)+TX、ピリミホス-エチル(1345)+TX、ピリミホス-メチル(652)+TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(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、プロベタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフェンビュート[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン(1367)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシフェン(708)+TX、カシヤ(代替名)[CCN]+TX、キナルホス(711)+TX、キナルホス-メチル(1376)+TX、キノチオン(1380)+TX、キンチオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、ラホキサニド(代替名)[CCN]+TX、レスメトリン(719)+TX、ロテノン(722)+TX、RU 15525(開発コード)(723)+TX、RU 25475(開発コード)(1386)+TX、リアニア(代替名)(1387)+TX、リアノジン(慣用名)(1387)+TX、サバジラ(代替名)(725)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、SI-0205(化合物コード)+TX、SI-0404(化合物コード)+TX、SI-0405(化合物コード)+TX、シラフルオフエン(728)+TX、SN 72129(開発コード)(1397)+TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN]+TX、シアン化ナトリウム(444)+TX、フッ化ナトリウム(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1399)+TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400)+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623)+TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名)(1401)+TX、ナトリウムチオシアネート[CCN]+TX、ソファミド(1402)+TX、スピノサド(737)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、スピロテトラマト(CCN)+TX、スルコフロン(746)+TX、スルコフロン-ナトリウム(746)+TX、スルフルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、フッ化スルフルル(756)+TX、スルプロホス(1408)+TX、タール油(代替名)(758)+TX、-フルバリネート(398)+TX、タジムカルブ(1412)+TX、TDE(1414)+TX、テブフェノジド(762)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、テブピリムホス(764)+TX、テフルベンズロン(768)+TX、テフルトリン(769)+TX、テメホス(770)+TX、TEPP(1417)+TX、テラレトリン(1418)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス

10

20

30

40

50

(773) + TX、テトラクロロエタン [CCN] + TX、テトラクロロピンホス(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、チアフェノックス(代替名) + TX、チアメトキサム(792) + TX、チクロホス(1428) + TX、チオカルボキシム(1431) + TX、チオシクラム(798) + TX、シュウ酸水素チオシクラム(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、チオスルタツプ(803) + TX、チオスルタツプ-ナトリウム(803) + TX、ツリングエンシン(代替名) [CCN] + TX、トルフェンピラド(809) + TX、トラロメトリン(812) + TX、トランスフルトリン(813) + TX、トランスペルメトリン(1440) + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアザメート(818) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリクロルメタホス-3(代替名) [CCN] + TX、トリクロロナート(1452) + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリフルムロン(835) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、トリプレン(1459) + TX、バミドチオン(847) + TX、バニリプロール [CCN] + TX、ベラトリジン(代替名)(725) + TX、ベラトリン(代替名)(725) + TX、XMC(853) + TX、キシリルカルブ(854) + TX、YI-5302(化合物コード) + TX、
 -シペルメトリン(205) + TX、
 メトリン(代替名) + TX、リン化亜鉛(640) + TX、ゾラプロホス(1469)およびZXI 8901(開発コード)(858) + TX、シアントラニリプロール [736994-63-19] + TX、クロラントラニリプロール [500008-45-7] + TX、シエノピラフェン [560121-52-0] + TX、シフルメトフェン [400882-07-7] + TX、ピリフルキナゾン [337458-27-2] + TX、スピネトラム [187166-40-1+187166-15-0] + TX、スピロテトラマト [203313-25-1] + TX、スルホキサフロール [946578-00-3] + TX、フルフィプロール [704886-18-0] + TX、メベルフルトリン [915288-13-0] + TX、テトラメチルフルトリン [84937-88-2] + TX、トリフルメゾピリム(国際公開第2012/092115号に開示されている) + TXからなる物質の群から選択される殺虫剤、

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913) + TX、プロモアセトアミド [CCN] + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、クロエトカルブ(999) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、硫酸銅(172) + TX、フェンチン(347) + TX、リン酸第二鉄(IUPAC名)(352) + TX、メタアルデヒド(518) + TX、メチオカルブ(530) + TX、ニクロシアミド(576) + TX、ニクロシアミドオラミン(576) + TX、ペンタクロロフェノール(623) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623) + TX、タジムカルブ(1412) + TX、チオジカルブ(799) + TX、酸化トリブチルスズ(913) + TX、トリフェンモルフ(1454) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)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からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤

、

AKD-3088(化合物コード) + TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1045) + TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1062) + TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063) + TX、1,3-ジクロロプロペン(233) + TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフエン1,1-ジオキシド(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1065) + TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルローダニン(IUPAC名)(980) + TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸(IUPAC名)(1286) + TX、6-イソペンテニルアミノプリン(代替名)(210) + TX、アバメクチ

ン(1) + TX、アセトブロール [CCN] + TX、アラニカルブ(15) + TX、アル
 ジカルブ(16) + TX、アルドキシカルブ(863) + TX、AZ 60541(化合
 物コード) + TX、ベンクロチアズ [CCN] + TX、ベノミル(62) + TX、ブチル
 ピリダベン(代替名) + TX、カズサホス(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、クロロピクリ
 ン(141) + TX、クロルピリホス(145) + TX、クロエトカルブ(999) + T
 X、サイトカイニン(代替名)(210) + TX、ダゾメット(216) + TX、DBC
 P(1045) + TX、DCIP(218) + TX、ジアミダホス(1044) + TX、
 ジクロフェンチオン(1051) + TX、ジクリホス(代替名) + TX、ジメトエート(2
 62) + TX、ドラメクチン(代替名) [CCN] + TX、エマメクチン(291) +
 TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、エプリノメクチン(代替名) [CCN
] + TX、エトプロホス(312) + TX、二臭化エチレン(316) + TX、フェナミ
 ホス(326) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、フェンスルホチオン(1158
) + TX、ホスチアゼート(408) + TX、ホスチエタン(1196) + TX、フルフ
 ラール(代替名) [CCN] + TX、GY-81(開発コード)(423) + TX、ヘテ
 ロホス [CCN] + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、イサミドホ
 ス(1230) + TX、イサゾホス(1231) + TX、イベルメクチン(代替名) [C
 CN] + TX、キネチン(代替名)(210) + TX、メカルフォン(1258) + TX
 、メタム(519) + TX、メタムカリウム(代替名)(519) + TX、メタムナトリ
 ウム(519) + TX、臭化メチル(537) + TX、メチルイソチオシアネート(54
 3) + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン(代
 替名) [CCN] + TX、クワ暗斑病菌(*Myrothecium verrucaria*
a)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) [C
 CN] + TX、スピノサド(737) + TX、テルバム(代替名) + TX、テルブホス
 (773) + TX、テトラクロロチオフェン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)
 (1422) + TX、チアフェノックス(代替名) + TX、チオナジン(1434) + T
 X、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、キシレノルス [C
 CN] + TX、YI-5302(化合物コード)およびゼアチン(代替名)(210) +
 TX、フルエンシルホン [318290-98-1] + TX からなる物質の群から選択さ
 れる殺線虫剤、
 エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] およびニトラピリン(580) + TX からなる
 物質の群から選択される硝化阻害剤、
 アシベンゾラル(6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル(6) + TX、プロベナゾー
 ル(658) およびオオイタドリ(*Reynoutria sachalinensis*
*)*抽出物(代替名)(720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、
 2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246) + TX、4-
 (キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)
 + TX、 -クロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム(640) + TX、
 アンツ(880) + TX、三酸化ヒ素(882) + TX、炭酸バリウム(891) + TX
 、ピスチオセミ(912) + TX、プロディファコウム(89) + TX、プロマジオロン
 (91) + TX、プロメタリン(92) + TX、シアン化カルシウム(444) + TX、
 クロラロース(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、クマクロール(1004) + TX、クマフリル(10
 05) + TX、クマテトラリル(175) + TX、クリミジン(1009) + TX、ジフ
 エナコウム(246) + TX、ジフェチアロン(249) + TX、ジファシノン(273
) + TX、エルゴカルシフェロール(301) + TX、フロクマフェン(357) + TX
 、フルオロアセトアミド(379) + TX、フルプロパジン(1183) + TX、フルプ
 ロパジン塩酸塩(1183) + TX、 -HCH(430) + TX、HCH(430) +

10

20

30

40

50

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

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

アントラキノ(32)+TX、クロラロース(127)+TX、ナフテン酸銅[CCN]+TX、オキシ塩化銅(171)+TX、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からなる物質の群から選択される動物忌避剤、

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

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

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

10

20

30

40

50

30 - 4] + TX、ペンフルフェン [494793 - 67 - 8] + TX、ペンコナゾール
 [66246 - 88 - 6] + TX、プロチオコナゾール [178928 - 70 - 6] + T
 X、ピリフェノックス [88283 - 41 - 4] + TX、プロクロラズ [67747 - 0
 9 - 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 - 4
 3 - 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 - 10
 43 - 6] + TX、ジメチリモール [5221 - 53 - 4] + TX、エチリモール [23
 947 - 60 - 6] + TX、ドデモルフ [1593 - 77 - 7] + TX、フェンプロビジ
 ン [67306 - 00 - 7] + TX、フェンプロピモルフ [67564 - 91 - 4] + T
 X、スピロキサミン [118134 - 30 - 8] + TX、トリデモルフ [81412 - 4
 3 - 3] + TX、シブロジニル [121552 - 61 - 2] + TX、メパニピリム [11
 0235 - 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、フルジオキソニル [131341 - 86 - 1
] + TX、フルインダピル (fl u i n d a p y r) [1383809 - 87 - 7] + T
 X、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 [706 20
 30 - 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 [24201 -
 58 - 9] + TX、イブロジオン [36734 - 19 - 7] + TX、ミクロゾリン [54
 864 - 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 - 80 - 3] +
 TX、フルトラニル [66332 - 96 - 5] + TX、フルチアニル [958647 - 1 30
 0 - 4] + TX、メプロニル [55814 - 41 - 0] + TX、オキシカルボキシシン [5
 259 - 88 - 1] + TX、ペンチオピラド [183675 - 82 - 3] + TX、チフル
 ザミド [130000 - 40 - 7] + TX、グアザチン [108173 - 90 - 6] + T
 X、ドジン [2439 - 10 - 3] [112 - 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 [149961 - 52 - 4] + TX、エネステロブリン {
 Proc . B C P C , I n t . C o n g r . , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } +
 TX、フルオキサストロピン [361377 - 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 [141517 - 21 - 7] + TX、オリザストロピン [40
 248593 - 16 - 0] + TX、ピコキシストロピン [117428 - 22 - 5] + T
 X、ピラクロストロピン [175013 - 18 - 0] + TX、ピラオキシストロピン [8
 62588 - 11 - 2] + TX、フェルバム [14484 - 64 - 1] + TX、マンコゼ
 ブ [8018 - 01 - 7] + TX、マネブ [12427 - 38 - 2] + TX、メチラム [1
 9006 - 42 - 2] + TX、プロピネブ [12071 - 83 - 9] + TX、チラム [1
 37 - 26 - 8] + TX、ジネブ [12122 - 67 - 7] + TX、ジラム [137 - 3
 0 - 4] + TX、カプタホール [2425 - 06 - 1] + TX、キャプタン [133 - 0
 6 - 2] + TX、ジクロフルアニド [1085 - 98 - 9] + TX、フルオロイミド [4
 1205 - 21 - 4] + TX、ホルベット [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 [50

20427-59-2]+TX、オキシ塩化銅[1332-40-7]+TX、硫酸銅[7758-98-7]+TX、酸化銅[1317-39-1]+TX、マンカップ[53988-93-5]+TX、オキシ銅[10380-28-6]+TX、ジノカップ[131-72-6]+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、イプロベンホス[26087-47-8]+TX、イソプロチオラン[50512-35-1]+TX、ホスジフェン[36519-00-3]+TX、ピラゾホス[13457-18-6]+TX、トルクロホス-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、ベンチアバリカルブ[413615-35-7]+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[62865-36-5]+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、SYP-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[115852-48-7]+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[239110-15-7]+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[39148-24-8]+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、ペンシクロン[66063-05-6]+TX、フタリド[27355-22-2]+TX、ピカルブトラゾクス[500207-04-5]+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、ピジフルメトフェン[1228284-64-7]+TX、ピラメトストロピン[915410-70-7]+TX、ピロキロン[57369-32-1]+TX、ピリオフェノン[688046-61-9]+TX、ピリベンカルブ[799247-52-2]+TX、ピリソキサゾール(pyrisoxazole)[847749-37-5]+TX、キノキシフェン[124495-18-7]+TX、キントゼン[82-68-8]+TX、硫黄[7704-34-9]+TX、Timorex Gold(商標)(Stockton Group製のティーツリー油を含有する植物抽出物)+TX、テブフロキン[376645-78-2]+TX、チアジニル[223580-51-6]+TX、トリアゾキシド[72459-58-6]+TX、トルプロカルブ[911499-62-2]+TX、トリクロピリカルブ[902760-40-1]+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、バリフェナレート[283159-90-0]+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、フェナマクリル(phenamacril)+TX、セダキサン[874967-67-6]+TX、トリネキサバック-エチル[95266-40-3]+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-ナフタレン

10

20

30

40

50

- 5 - イル) - アミド (国際公開第 2007/048556 号に開示されている) + TX
 、 3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3', 4',
 , 5' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第 2006/087
 343 号に開示されている) + 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, 4
 a, 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 - (10
 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 からなる群か
 ら選択される生物学的に有効な化合物、
 または N - [(5 - クロロ - 2 - イソプロピル - フェニル) メチル] - N - シクロプロピ
 ル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキ
 サミド (国際公開第 2010/130767 号に記載の手順にしたがって調製され得る)
 + TX、 2, 6 - ジメチル - 1H, 5H - [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c : 5, 6 - c
 '] ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2H, 6H) - テトロソ (国際公開第 2011/13
 8281 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、 6 - エチル - 5, 7 - ジオ
 キソ - ピロロ [4, 5] [1, 4] ジチイノ [1, 2 - c] イソチアゾール - 3 - カルボ
 ニトリル + TX、 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロ - フェニル) - N - (2 - クロロ - 6
 - フルオロ - フェニル) - 2, 5 - ジメチル - ピラゾール - 3 - アミン (国際公開第 20
 12/031061 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、 3 - (ジフルオ
 ロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1
 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2012/084812 号に記
 載の手順にしたがって調製され得る) + TX、 CAS 850881 - 30 - 0 + TX、
 3 - (3, 4 - ジクロロ - 1, 2 - チアゾール - 5 - イルメトキシ) - 1, 2 - ベンゾチ
 アゾール 1, 1 - ジオキソ (国際公開第 2007/129454 号に記載の手順にした
 がって調製され得る) + TX、 2 - [2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フ
 ェニル] - 2 - メトキシ - N - メチル - アセトアミド + TX、 3 - (4, 4 - ジフルオ
 ロ - 3, 4 - ジヒドロ - 3, 3 - ジメチルイソキノリン - 1 - イル) キノロン (国際公開第
 2005/070917 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、 2 - [2 -
 フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] フェニル] プロ
 パン - 2 - オール (国際公開第 2011/081174 号に記載の手順にしたがって調製
 され得る) + TX、 2 - [2 - [(7, 8 - ジフルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オ
 キシ] - 6 - フルオロ - フェニル] プロパン - 2 - オール (国際公開第 2011/081
 174 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、 オキサチアピプロリン + TX
 [1003318 - 67 - 9]、 tert - ブチル N - [6 - [[(1 - メチルテトラ
 ザール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カ
 ルバメート + TX、 N - [2 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) フェニル] - 3 - (トリ
 フルオロメチル) ピラジン - 2 - カルボキサミド (国際公開第 2007/072999 号
 に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチ
 ル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カ
 ルボキサミド (国際公開第 2014/013842 号に記載の手順にしたがって調製され
 得る) + TX、 2, 2, 2 - トリフルオロエチル N - [2 - メチル - 1 - [(4 - メチ
 ルベンゾイル) アミノ] メチル] プロピル] カルバメート + TX、 (2RS) - 2 - [4
 - (4 - シクロフェノキシ) - , , - トリフルオロ - o - トリル] - 1 - (1H -
 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + TX、 (2RS) - 2 -
 [4 - (4 - シクロフェノキシ) - , , - トリフルオロ - o - トリル] - 3 - メチ
 ル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール + TX、 2

10

20

30

40

50

- (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4, 5 - ジクロロチアゾール - 2 - イル) オキシ - 2, 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン (国際公開第2007/031513号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、[2 - [3 - [2 - [1 - [2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジル] チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 5 - イル] - 3 - クロロ - フェニル] メタンスルホネート (国際公開第2012/025557号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、ブタ - 3 - イニル N - [6 - [[(Z) - [(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート (国際公開第2010/000841号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、2 - [[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル] - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン (国際公開第2010/146031号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、メチル N - [[5 - [4 - (2, 4 - ジメチルフェニル) トリアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - フェニル] メチル] カルバメート + TX、3 - クロロ - 6 - メチル - 5 - フェニル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン (国際公開第2005/121104号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - シクロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール (国際公開第2013/024082号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、3 - クロロ - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン (国際公開第2012/020774号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン - 3 - カルボニトリル (国際公開第2012/020774号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、(R) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第2011/162397号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第2012/084812号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、1 - [2 - [[1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシメチル] - 3 - メチル - フェニル] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン (国際公開第2013/162072号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 2 - [[2 - メチル - 4 - (3, 4, 5 - トリメチルピラゾール - 1 - イル) フェノキシ] メチル] フェニル] テトラゾール - 5 - オン (国際公開第2014/051165号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、(Z, 2E) - 5 - [1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシ - 2 - メトキシイミノ - N, 3 - ジメチル - ペンタ - 3 - エンアミド + TX、(4 - フェノキシフェニル) メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + TX、N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [1255734 - 28 - 1] (国際公開第2010/130767号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - N - [(R) - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [1352994 - 67 - 2] + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4, 5 - ジクロロ - チアゾール - 2 - イルオキシ) - 2, 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル)

10

20

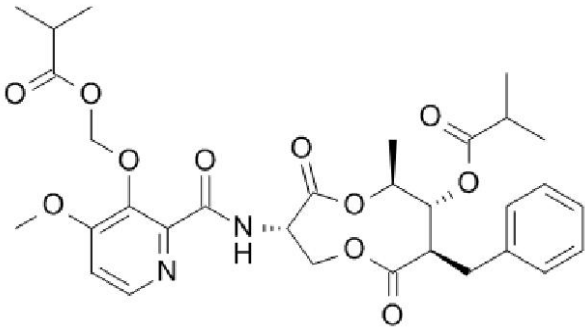
30

40

50

- N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4 , 5 - ジクロロ - チアゾール - 2 - イルオキシ) - 2 , 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、

【化 1 5】



(フェンピコキサミド [5 1 7 8 7 5 - 3 4 - 2]) + TX (国際公開第 2 0 0 3 / 0 3 5 6 1 7 号に記載されている)、2 - (ジフルオロメチル) - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (1 , 1 - ジメチル - 3 - プロピル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - イソブチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、および 2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 - ジメチル - 3 - プロピル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX (ここで、これらのカルボキサミド化合物の各々は、国際公開第 2 0 1 4 / 0 9 5 6 7 5 号および / または国際公開第 2 0 1 6 / 1 3 9 1 8 9 号に記載の手順にしたがって調製され得る) からなる群から選択される生物学的に有効な化合物。

【 0 1 5 2】

例えば [3 8 7 8 - 1 9 - 1] といった有効成分に続く括弧中の参照は、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、それらは、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) で記載されている。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。

【 0 1 5 3】

上記明細書において、上記の有効成分の大部分は、いわゆる「一般名」、関連する「ISO一般名」または別の「一般名」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。「一般名」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/ケミカルアブストラクツ名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」もしくは「開発コード」が用い

10

20

30

40

50

られており、または、これらの呼称もしくは「一般名」のいずれも用いられていない場合には、「代替名」が用いられている。「CAS登録番号」は、Chemical Abstracts Registry Numberを意味する。

【0154】

表T1(以下)に記載の化合物1.1~1.46、または、表1.1~1.5もしくは2.1~2.3(以下)に記載の式(I)の化合物から選択される式(I)の化合物と、上記の有効成分との有効成分混合物は、100:1~1:6000、特に50:1~1:50の混合比、特に20:1~1:20、特に10:1~1:10、特に5:1~1:5の比が好ましく、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の比である。これらの混合比は重量基準である。

10

【0155】

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工程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。

20

【0156】

表1.1~1.5もしくは2.1~2.3(以下)または表T1(以下)におけるものから選択される式(I)の化合物と、上記の1種以上の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の有効成分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、連続して(すなわち、数時間または数日間などの適度に短い期間のうちに次々と)適用される場合には単一の有効成分を併用して適用が可能である。表1.1~1.5もしくは2.1~2.3(以下)または表T1(以下)から選択される式(I)の化合物と、上記の有効成分と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

【0157】

本発明に係る組成物はまた、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/または粘着剤、肥料または特定の効果を達成するための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺菌・殺カビ剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤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み得る。

【0158】

本発明に係る組成物は、それ自体公知である様式において、助剤の不在下で、例えば、固体有効成分を粉末化し、スクリーニングし、および/または圧縮することにより、および少なくとも1種の助剤の存在下で、例えば、有効成分を1種または複数の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式(I)の化合物の使用も本発明の主題である。

40

【0159】

本発明の他の態様は、式(I)の化合物もしくは本明細書に定義されている好ましい個別の化合物、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菌・殺

50

カビもしくは殺虫性混合物であって、上記の他の殺菌・殺カビ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。

【0160】

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

10

【0161】

防除もしくは予防とは、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、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0162】

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菌・殺カビ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。

20

【0163】

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。

30

【0164】

有利な適用量は、通常、1ヘクタール(ha)当たり、5g~2kgの有効成分(a.i.)、好ましくは10g~1kg a.i./ha、最も好ましくは20g~600g a.i./haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg~1gの活性物質である。

【0165】

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

40

【0166】

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、病害の発生效后を意味する治療的に適用される。

【0167】

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

50

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。

【0168】

このような組成物は、従来の様式で、例えば有効成分を、適切な不活性配合物（希釈剤、溶剤、充填材、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選択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、およびエトキシル化アルキルフェノールおよびエトキシル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。

10

【0169】

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、単一種の有効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有効成分の組み合わせを含有していてもよい。

20

【0170】

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、任意選択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。

30

【0171】

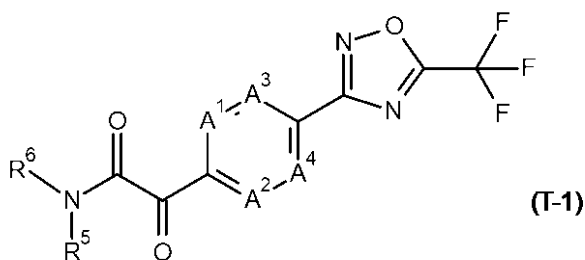
市販の製品を濃縮物として配合することが好ましいが、エンドユーザーは通常配合物を希釈して使用するであろう。

【0172】

表1.1：この表は式（T-1）の40種の特定の化合物を開示するものであり：

【化16】

40



(T-1)

ここで、A¹はC-R¹であり、A²はC-R²であり、A³はC-R³であり、A⁴はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²、R³、R⁴およびR⁵は水素であり、ならびに、R⁶は、

50

表 1 中において以下に定義されているとおりである。

【 0 1 7 3 】

表 1 . 2 ~ 1 . 5 (表 1 . 1 に続く) の各々によって式 (T - 1) の 4 0 種の個別の化合物が利用可能とされており、ここで、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は、表 1 . 2 ~ 1 . 5 (R^6 が具体的に定義されている表 1 を参照する) において具体的に定義されているとおりである。

【 0 1 7 4 】

【 表 1 】

表 1

| 化合物 No. | R^5 | 化合物 No. | R^6 |
|---------|-------------------------------|---------|--------------------------------|
| 1.001 | メチル | 1.021 | 6-メトキシ-2-ピリジル |
| 1.002 | エチル | 1.022 | シアノメチル |
| 1.003 | プロピル | 1.023 | オキセタン-3-イル |
| 1.004 | イソプロピル | 1.024 | 2,2-ジメチルヒドラジノ |
| 1.005 | ブチル | 1.025 | (2-フルオロフェニル)メチル |
| 1.006 | 2-メトキシエチル | 1.026 | (アセトアミド)メチル |
| 1.007 | アリル | 1.027 | アセトニル |
| 1.008 | プロプ-2-イニル | 1.028 | アリルオキシ |
| 1.009 | シクロプロピル | 1.029 | ベンジルオキシ |
| 1.010 | シクロプロピルメチル | 1.030 | メトキシ |
| 1.011 | 2-アセトアミドエチル | 1.031 | エトキシ |
| 1.012 | 2-ジメチルアミノエチル | 1.032 | フェニル |
| 1.013 | 2-エチル-3-オキソ-イソキサゾ リジン-4-イル | 1.033 | (3-メチル-2-チエニル)メチル |
| 1.014 | 2-フルオロエチル | 1.034 | 2-(<i>t</i> -ブトキシカルボニルアミノ)エチル |
| 1.015 | 2-メチルスルファニルエチル | 1.035 | 1,4-ジオキサソ-2-イルメチル |
| 1.016 | 水素 | 1.036 | 2,2-ジフルオロエトキシ |
| 1.017 | 2,2-ジフルオロシクロペンチル | 1.037 | 2,2-ジフルオロエチル |
| 1.018 | 2-メトキシ-2-オキソ-エチル | 1.038 | 2,2-ジメトキシエチル |
| 1.019 | プロプ-2-イノキシ | 1.039 | 2-(メチルアミノ)-2-オキソ-エチル |
| 1.020 | プロプ-2-イニル | 1.040 | イソブチル |

【 0 1 7 5 】

表 1 . 2 : この表は式 (T - 1) の 4 0 種の特定の化合物を開示するものであり、ここで、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は水素であり、 R^1 はフッ素であり、ならびに、 R^6 は表 1 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 7 6 】

表 1 . 3 : この表は式 (T - 1) の 4 0 種の特定の化合物を開示するものであり、ここで、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 は水素であり、 R^3 はフッ素であり、ならびに、 R^6 は表 1 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 7 7 】

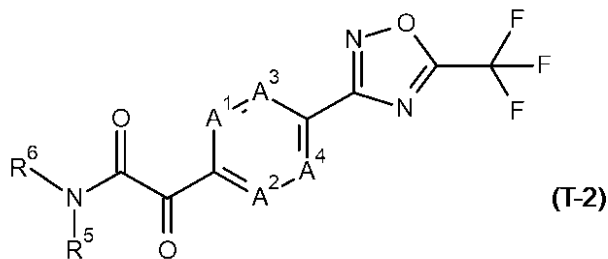
表 1. 4 : この表は式 (T - 1) の 40 種の特定の化合物を開示するものであり、ここで、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は水素であり、 R^5 はメチルであり、ならびに、 R^6 は表 1 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 7 8 】

表 1. 5 : この表は 40 種の特定の式 (T - 1) の化合物を開示するものであり、ここで、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は水素であり、 R^5 はメトキシであり、ならびに、 R^6 は、表 1 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 7 9 】

表 2. 1 : この表は 5 種の特定の式 (T - 2) の化合物を開示するものであり：
【化 1 7】



ここで、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は水素であり、ならびに、 $R^5 - N - R^6$ は、表 2 において以下に定義されているとおりである。

【 0 1 8 0 】

表 2. 2 ~ 2. 3 の各々 (表 2. 1 に続く) によって 5 種の個別の式 (T - 2) の化合物が提供されており、ここで、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は、表 2. 2 ~ 2. 3 ($R^5 - N - R^6$ が具体的に定義されている表 2 を参照する) において具体的に定義されているとおりである。

【 0 1 8 1 】

【表 2】

表 2

| 化合物 No. | $R^5 - N - R^6$ | 化合物 No. | $R^5 - N - R^6$ |
|---------|-----------------|---------|-----------------|
| 2. 001 | 4-メトキシピペラジニル | 2. 004 | 1, 2-オキサジナニル |
| 2. 002 | モルホリニル | 2. 005 | 1, 4-オキサジナニル |
| 2. 003 | ピロリジニル | | |

【 0 1 8 2 】

表 2. 2 : この表は 5 種の特定の式 (T - 2) の化合物を開示するものであり、ここで、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^2 、 R^3 および R^4 は水素であり、 R^1 はフッ素であり、ならびに、 $R^5 - N - R^6$ は、表 1 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 8 3 】

表 2. 3 : この表は 5 種の特定の式 (T - 2) の化合物を開示するものであり、ここで、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 および R^4 は水素であり、 R^3 はフッ素であり、ならびに、 R^6 は、表 2 において上記に定義されているとおりである。

【実施例】

【0184】

以下の実施例は本発明を例示するものである。

【0185】

本発明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50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 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。

【0186】

式(I)の化合物は、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、または農芸化学有効成分としての使用に係る優れた特性(例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全プロファイル(向上した作物の耐性を含む)、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。

10

【0187】

本明細書を通して、温度は摂氏度()で記載されており、「mp.」は融点を意味する。LC/MSは液体クロマトグラフィ質量分光測定を意味し、方法(方法A)の説明は以下のとおりである。

【0188】

装置および方法Aの説明は以下のとおり：

Waters製のSQ Detector 2

20

イオン化法：エレクトロスプレー

極性：陽イオンおよび陰イオン

キャピラリ(kV)3.0、コーン(V)30.00、抽出器(V)2.00、ソース温度()150、脱溶剤温度()350、コーンガス流(L/Hr)0、脱溶剤ガス流(L/Hr)650

質量範囲：100~900 Da

DAD波長範囲(nm)：210~500

以下のHPLC勾配条件によるWaters ACQUITY UPLC法

(溶剤A：水/メタノール20：1+0.05%ギ酸および溶剤B：アセトニトリル+0.05%ギ酸)

30

【0189】

【表3】

| 時間(分) | A (%) | B (%) | 流量(ml/min) |
|-------|-------|-------|------------|
| 0 | 100 | 0 | 0.85 |
| 1.2 | 0 | 100 | 0.85 |
| 1.5 | 0 | 100 | 0.85 |

【0190】

カラムタイプ：Waters ACQUITY UPLC HSS T3；カラム長：30 mm；カラム内径：2.1 mm；粒径：1.8ミクロン；温度：60。

40

【0191】

必要に応じて、鏡像異性的に純粋な最終化合物が、適宜、逆相キラルクロマトグラフィなどの標準的な物理的分離技術によって、または例えば、キラル出発材料を用いることによる立体選択的合成技術によって、ラセミ材料から得られる。

【0192】

配合物実施例

【0193】

【表 4】

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

【0194】

有効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砕して、水で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。

【0195】

【表 5】

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

【0196】

有効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砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得た。

【0197】

| | | | | |
|--|------|-----|-----|----|
| 乳化性濃縮物 | | | | 30 |
| 有効成分[式(I)の化合物] | 10 % | | | |
| オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル (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 % | |
| シクロヘキサノン | 30 % | | | |
| キシレン混合物 | 50 % | | | |

【0198】

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。

| | | | | |
|--|--|--|--|----|
| | | | | 40 |
|--|--|--|--|----|

【0199】

【表 6】

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

【0200】

すぐに使用可能な粉剤は、有効成分とキャリアとを混合し、この混合物を好適なミルで粉砕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。

【0201】

押出し顆粒

有効成分 [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 %

【0202】

有効成分を補助剤と混合および粉砕し、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。

【0203】

コーティングされた顆粒

有効成分 [式 (I) の化合物] 8 %
 ポリエチレングリコール (mol . wt . 200) 3 %
 カオリン 89 %

【0204】

細かく粉砕した有効成分を、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。

【0205】

懸濁液濃縮物

有効成分 [式 (I) の化合物] 40 %
 プロピレングリコール 10 %
 ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル 6 %
 (15 mol のエチレンオキシド)
 リグノスルホン酸ナトリウム 10 %
 カルボキシメチルセルロース 1 %
 シリコン油 (75 % 水中エマルジョンの形態) 1 %
 水 32 %

【0206】

細かく粉砕した有効成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、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。

【0207】

種子処理に係る流動性濃縮物

有効成分 [式 (I) の化合物] 40 %
 プロピレングリコール 5 %
 コポリマーブタノール PO / EO 2 %
 10 ~ 20 モルの EO 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 (20 % 水溶液の形態) 0.5 %
 モノアゾ - 顔料カルシウム塩 5 %
 シリコン油 (75 % 水中エマルジョンの形態) 0.2 %
 水 45.3 %

【0208】

細かく粉砕した有効成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存

10

20

30

40

50

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。

【0209】

緩効性カプセル懸濁液

28部の組み合わせた式(I)の化合物を、2部の芳香族溶剤および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、0.05部の脱泡剤および51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。この混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。

【0210】

得られるカプセル懸濁液を、0.25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、28%の有効成分を含有する。中程度のカプセル径は8~15ミクロンである。

【0211】

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。

【0212】

略語リスト:

AIBN = アゾビスイソブチロニトリル

CDCl₃ = クロロホルム - d

= 摂氏度

DCM = ジクロロメタン

d = 二重項

EtOAc = 酢酸エチル

h = 時間 (s)

HCl = 塩酸

M = モル濃度

min = 分間

MHz = メガヘルツ

mp = 融点

NBS = N-ブロモスクシンイミド

ppm = 百万分率

R_t = 保持時間

rt = 室温

s = 一重項

t = 三重項

THF = テトラヒドロフラン

TFAA = トリフルオロ酢酸無水物

LC/MS = 液体クロマトグラフィ質量分光測定 (LC/MS分析に用いた装置および方法の説明は上記のとおり)

【0213】

調製例

実施例1: この実施例は、2-オキソ-N-プロブ-2-イニル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド(表T1の化合物1.41)の調製を例示する。

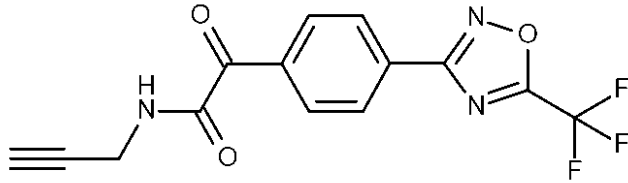
10

20

30

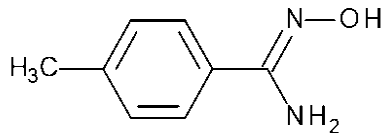
40

【化18】



ステップ1：N'-ヒドロキシ-4-メチル-ベンズアミジンの調製

【化19】

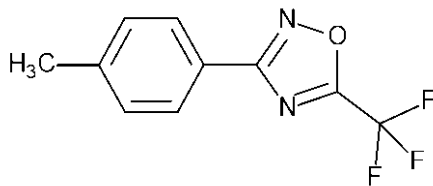


4-メチルベンゾニトリル(35.0g、0.29mol)のエタノール(220mL)および水(440mL)中の懸濁液に、室温で、塩酸ヒドロキシルアミン(41.1g、0.58mol)、炭酸カリウム(65.4g、0.47mol)および8-ヒドロキシキノリン(0.22g、1.5mmol)を添加した。反応混合物を80℃で4時間加熱し、次いで、室温に冷却し、2N HClでpH8まで希釈した。エタノールを減圧下で除去した。混合物をろ過し、水で洗浄し、減圧下で乾燥させて、39.1gのN'-ヒドロキシ-4-メチル-ベンズアミジンを得、次いで、さらに精製することなく次の調製ステップにおいてそのまま用いた。LC/MS保持時間=0.23分間、151.0(M+H)。

【0214】

ステップ2：3-(p-トリル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールの調製

【化20】



N'-ヒドロキシ-4-メチル-ベンズアミジン(38.7g、0.25mol)の2-メチルテトラヒドロフラン(750mL)中の溶液に、TFAAを0℃で添加した。反応混合物を15℃で2時間攪拌し、水で希釈した。有機層を分離し、重炭酸ナトリウム溶液、飽和塩化アンモニウム水溶液、水で順次に洗浄し、次いで、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、ヘプタン/EtOAc溶離液勾配99:1~90:10を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィに供して、54.1gの表題の化合物を清透な油として得たが、これは保管後に固化した。LC/MS保持時間=1.15分間、質量は検出せず。

^1H NMR(400MHz, CDCl_3) ppm: 8.00(d, 2H), 7.32(d, 2H), 2.45(s, 3H)。

^{19}F NMR(376MHz, CDCl_3) ppm: -65.41(s)。

【0215】

ステップ3a：3-[4-(プロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールの調製

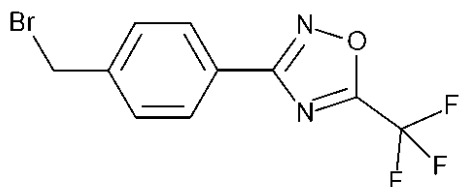
10

20

30

40

【化 2 1】



3 - (p - トリル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール (56.0 g、0.24 mol) および NBS (45.4 g、0.25 mol) のテトラクロロメタン (480 mL) 中の混合物を、アルゴン雰囲気下で 70 に加熱した。AIBN (4.03 g、24 mmol) を添加し、反応混合物を 65 で 18 時間攪拌した。混合物を室温に冷却し、ジクロロメタンおよび水で希釈し、層を分離した。有機相を重炭酸ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、シクロヘキサン / EtOAc 溶離液勾配 100 : 0 ~ 95 : 5 を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィに供して、44.7 g の表題の化合物を白色の固体 (mp : 58 ~ 63) として得た。

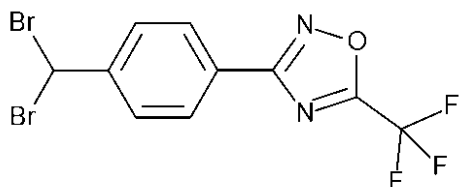
^1H NMR (400 MHz , CDCl_3) ppm : 8.11 (d , 2 H) , 7.55 (d , 2 H) , 4.53 (s , 2 H) .

^{19}F NMR (400 MHz , CDCl_3) ppm : - 65.32 (s) .

【 0 2 1 6】

副生成物である、3 - [4 - (ジブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾールを、白色の固体 (mp : 61 ~ 66) として単離する。

【化 2 2】



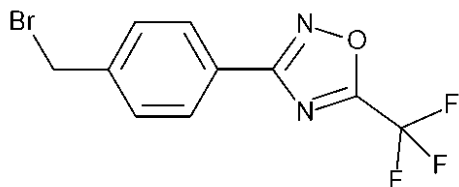
^1H NMR (400 MHz , CDCl_3) ppm : 8.15 (d , 2 H) , 7.73 (d , 2 H) , 6.68 (s , 1 H) .

^{19}F NMR (376 MHz , CDCl_3) ppm : - 65.34 (s) .

【 0 2 1 7】

ステップ 3 b : 3 - [4 - (プロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾールの調製

【化 2 3】



3 - [4 - (プロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾールおよび 3 - [4 - (ジブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール (10.2 g) のアセトニトリル (95 mL) 中の 1 : 9 比混合物に、水 (1.9 mL)、DIPEA (6.20 mL、35.7 mmol) および垂リン酸ジエチル (4.7 mL、35.7 mmol) を 5 で添加した。混合物を 5 ~ 10 で 2 時間攪拌し、水および 1 M HCl を添加し、アセトニトリルを減圧下で蒸発させた。白色のスラリーをジクロロメタンで 3 回抽出し、組み合わせた有機層を

硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過した。溶剤を減圧下で除去し、得られた粗残渣を、シクロヘキサン/EtOAc 99:1~9:1を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィに供して、7.10 gの3-[4-(ブロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールを得た。

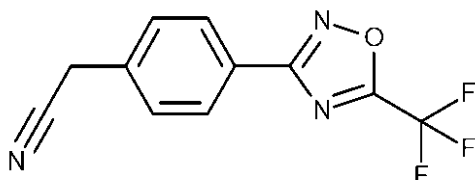
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.11 (d, 2H), 7.55 (d, 2H), 4.53 (s, 2H).

^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) ppm: -65.32 (s).

【0218】

ステップ4: 2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリルの調製

【化24】



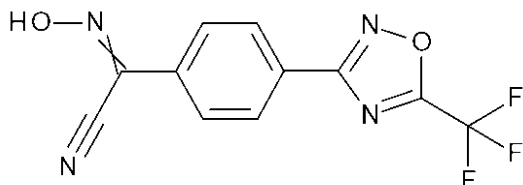
3-[4-(ブロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール (3.0 g, 9.8 mmol) のアセトニトリル (12 mL) 中の溶液に、トリメチルシリルギ酸ニトリル (1.3 g, 13 mmol) を添加した。反応混合物を 0 に冷却し、テトラブチルアンモニウムヒドロフロリド (3.3 g, 13 mmol) を 30 分間かけて導入した。25 に温めながら、攪拌を 6 時間継続した。完了した後、反応混合物を水 (100 mL) で希釈し、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、塩水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶剤を減圧下で除去し、得られた粗残渣を、シクロヘキサン/EtOAc 溶離液勾配 99:1~8:2 を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィに供して、所望の生成物である 2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリル (1.45 g, 59% 収率) を、白色の固体として得た。LC/MS 保持時間 = 1.01 分間、253 (M+H)。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.14 (d, 2H), 7.52 (d, 2H), 3.86 (s, 2H).

【0219】

ステップ5: 2-ヒドロキシイミノ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリルの調製

【化25】



2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリル (300 mg, 1.18 mmol) および HCl のジオキサン (10 mL, 40 mmol) 中の溶液を氷浴中で冷却し、続いて、t-亜硝酸ブチル (0.25 g, 2.37 mmol) を滴下した。氷浴を外し、反応を一晩攪拌した。次いで、反応混合物を塩水に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出した。有機画分を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、2-ヒドロキシイミノ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリル (307 mg, 92% 収率) を薄い黄色の固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 14.14 (s, 1H), 8.2

10

20

30

40

50

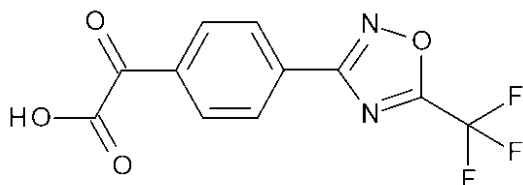
0 (d, 2H), 7.95 (d, 2H)

^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) ppm: -64.7 (s).

【0220】

ステップ6: 2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]酢酸の調製

【化26】



10

37%水性HCl (39 mL、460 mmol)中に懸濁させた2-ヒドロキシイミノ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリル (1.3 g、4.6 mmol)を含有し、90 に加熱した容器に、酢酸 (7.9 mL、140 mmol)を添加した。容器をシールし、加熱を4.5時間継続した。熱源を外し、反応の内容物を室温に冷却した。反応混合物をろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出し、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して薄い黄色の固体 (2.0 g)を得た。次いで、この固体をシクロヘキサンを用いて倍散して2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサ

20

ジアゾール-3-イル]フェニル]酢酸を得、これを、さらに精製することなく次の合成ステップにおいて用いた。LC/MS保持時間 = 0.74分間、285 (M-H)。

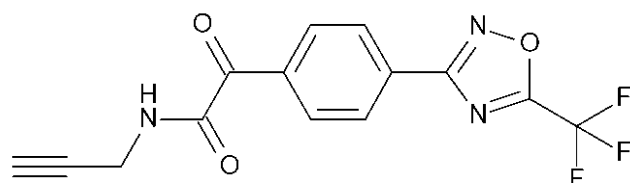
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.56 (d, 2H), 8.30 (d, 2H).

^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) ppm: -65.26 (s).

【0221】

ステップ7: 2-オキソ-N-プロブ-2-イニル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミドの調製

【化27】



30

2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]酢酸 (50 mg、0.175 mmol)をジメチルホルムアミド (0.7 mL)中に希釈し、続いて、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスフェート (HATU) (0.262 mmol、0.100 g)およびジイソプロピルエチル

40

ルアミン (0.8 mL、0.44 mmol)を添加し、混合物を5分間攪拌した。プロバギルアミン (0.02 mL、0.26 mmol)を添加し、反応を一晩室温で攪拌し、水で失活させ、酢酸エチルで抽出した。層を分離し、組み合わせた有機画分を塩水で洗浄し、 MgSO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して薄い黄色の固体を得た。粗生成物を、酢酸エチル:シクロヘキサン溶離液勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製して、2-オキソ-N-プロブ-2-イニル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド (0.01 g、18%収率)を白色の粉末として得た。mp: 79~84。LC/MS保持時間 = 1.00分間、322 (M-1)。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.52 (d, 2H), 8.25

50

(d, 2H), 7.30 (brs, 1H), 4.19 (d, 2H), 2.32 (s, 1H)
).

¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) ppm: -65.26 (s).

【0222】

必要な場合には、鏡像異性体的に純粋な最終化合物は、逆相キラルクロマトグラフィなどの標準的な物理的分離技術、または、立体選択的合成技術（例えば、キラル出発材料を用いることにより）を介して、適切なラセミ材料から入手し得る。

【0223】

【表 7 - 1】

表 T1:式(I)に係る化合物の融点(mp)データおよび/または LC/MS データ(保持時間(R_t)を含む):

| 項目 | 名称 | 構造 | R _t (min) | [M+H] (実測) | 方法 | mp (°C) |
|-----|--|----|-------------------------|---------------|----|-----------|
| 1.1 | <i>N</i> -(2-ヒドロキシエチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 147 - 148 |
| 1.2 | <i>N</i> -[2-(ジメチルアミノ)エチル]-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 0.79 | 357 | A | |
| 1.3 | 1-(4-メトキシピペラジン-1-イル)-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]エタン-1,2-ジオン | | 1.02 | 385 | A | |
| 1.4 | <i>N</i> -(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 0.9 | 366 | A | |
| 1.5 | <i>N,N</i> -ジメチル-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 0.97 | 314 | A | |

10

20

30

40

【表 7 - 2】

| | | | | | | |
|------|---|--|------|-----|---|-----------|
| 1.6 | N-アリルオキシ-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 0.98 | 342 | A | |
| 1.7 | N-[2-(メチルアミノ)-2-オキソエチル]-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 167 - 168 |
| 1.8 | N-[2-[[2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセチル]アミノ]エチル]シクロプロパンカルボキサミド | | | | | 209 - 210 |
| 1.9 | 2-[[[2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセチル]アミノ]エチルアンモニウム; クロリド | | | | | 213 - 214 |
| 1.10 | N-(2,2-ジフルオロエチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 1.04 | 348 | A | |

10

20

30

40

【表 7 - 3】

| | | | | | | |
|------|---|--|------|-----|---|---------------|
| 1.11 | <i>N</i> -(2-アセトアミドエチル)-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 0.87 | 371 | A | |
| 1.12 | <i>N</i> -ブチル-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 65.1 - 68.2 |
| 1.13 | <i>N</i> -イソプロピル-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 96 - 97.7 |
| 1.14 | <i>N</i> -(シアノメチル)-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 143.6 - 147.6 |
| 1.15 | <i>N</i> -イソブチル-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 83 - 85.3 |
| 1.16 | <i>N</i> -シクロプロピル-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 113.1 - 116 |

10

20

30

40

【表 7 - 4】

| | | | | | | |
|------|---|--|------|-----|---|---------------|
| 1.17 | <i>N</i> -メチル-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 128.1 - 130.8 |
| 1.18 | 2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 146.7 - 149.7 |
| 1.19 | <i>N,N</i> -ジメチル-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトヒドラジド | | | | | 134 - 138 |
| 1.20 | 1-ピロリジン-1-イル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]エタン-1,2-ジオン | | | | | 104 - 110 |
| 1.21 | <i>N</i> -(2-エチル-3-オキソ-イソキサゾリジン-4-イル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 162 - 165 |
| 1.22 | <i>N</i> -メチル-2-オキソ- <i>N</i> -プロピル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 1.12 | 342 | A | |

10

20

30

40

【表 7 - 5】

| | | | | | | |
|-------|--|--|-------|-----|---|--------------|
| 1. 23 | <i>N</i> -(2-メチルスル ファニルエチル) -2-オキシ-2-[4- [5-(トリフルオ ロメチル)-1, 2, 4 -オキサジアゾー ル-3-イル]フェ ニル]アセトアミ ド | | 1. 09 | 360 | A | |
| 1. 24 | <i>N</i> -(6-メトキシ-2 -ピリジル)-2-オ キシ-2-[4-[5- (トリフルオロメ チル)-1, 2, 4-オ キサジアゾール 3-イル]フェニ ル]アセトアミド | | | | | 118 - 120 |
| 1. 25 | <i>N</i> -アリル-2-オキ ソ-2-[4-[5-(トリ フルオロメチル) -1, 2, 4-オキサ ジアゾール-3- イル]フェニル] アセトアミド | | | | | 71 - 74 |
| 1. 26 | <i>N</i> -[(2-フルオロ フェニル)メチ ル]-2-オキシ-2- [4-[5-(トリフル オロメチル)-1, 2, 4-オキサジア ゾール-3-イル] フェニル]アセト アミド | | | | | 84 - 86 |
| 1. 27 | <i>N</i> -(オキセタン-3 -イル)-2-オキシ -2-[4-[5-(トリ フルオロメチル) -1, 2, 4-オキサ ジアゾール-3- イル]フェニル] アセトアミド | | | | | 131 - 136 |

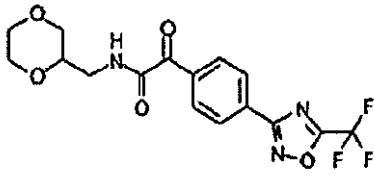
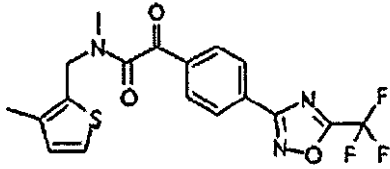
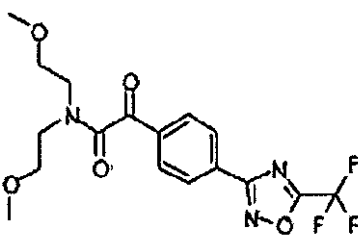
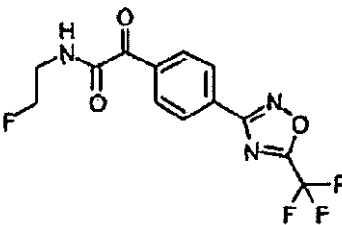
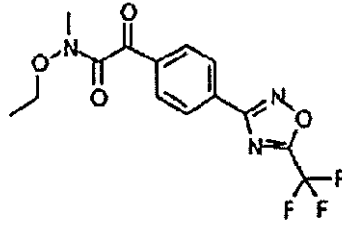
10

20

30

40

【表 7 - 6】

| | | | | | | |
|------|---|---|------|--------------|---|-------------|
| 1.28 | <i>N</i> -(1,4-ジオキササン-2-イルメチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | 1.03 | 384 (M-H) | A | |
| 1.29 | <i>N</i> -メチル- <i>N</i> [(3-メチル-2-チエニル)メチル]-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | 1.22 | 410 | A | |
| 1.30 | <i>N,N</i> -ビス(2-メトキシエチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | 1.12 | 402 | A | |
| 1.31 | <i>N</i> -(2-フルオロエチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | | | | 94 - 100 |
| 1.32 | <i>N</i> -エトキシ- <i>N</i> -メチル-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | 1.1 | 344 | A | |

10

20

30

40

【表 7 - 7】

| | | | | | | |
|------|--|--|------|-----|---|-----------|
| 1.33 | <i>N</i> -メチル-2-オキソ- <i>N</i> -フェニル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 1.13 | 376 | A | |
| 1.34 | <i>N</i> -(2,2-ジフルオロシクロペンチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 64 - 70 |
| 1.35 | 1-モルホリノ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]エタン-1,2-ジオン | | | | | 140 - 144 |
| 1.36 | 2-[[2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセチル]アミノ]酢酸メチル | | | | | 89 - 90 |
| 1.37 | <i>tert</i> -ブチル <i>N</i> -[2-[[2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセチル]アミノ]エチル]カルバメート | | | | | 155 - 156 |

10

20

30

40

【表 7 - 8】

| | | | | | | |
|-------|--|--|------|-----|---|-----------|
| 1. 38 | <i>N</i> -(2,2-ジメトキシエチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 88 - 89 |
| 1. 39 | <i>N</i> -エチル-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 105 - 110 |
| 1. 40 | <i>N</i> -(2-メトキシエチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | 0.99 | 344 | A | |
| 1. 41 | 2-オキソ- <i>N</i> -プロップ-2-イニル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 79 - 84 |
| 1. 42 | 2-オキソ- <i>N</i> -プロピル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 78 - 83 |
| 1. 43 | <i>N</i> -(シクロプロピルメチル)-2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド | | | | | 86 - 95 |

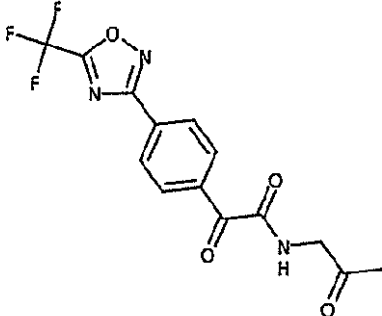
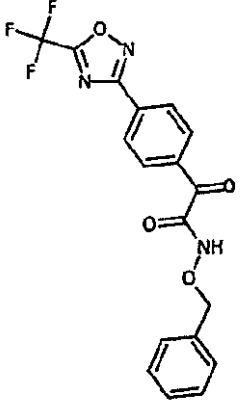
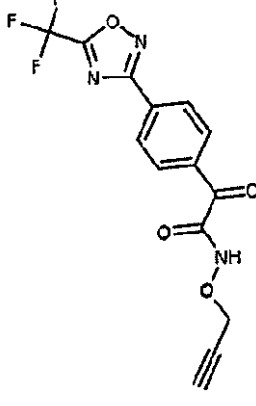
10

20

30

40

【表 7 - 9】

| | | | | | | |
|------|--|---|------|-----|---|--|
| 1.44 | N-アセトニル-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | 0.97 | 340 | A | |
| 1.45 | N-ベンジルオキシ-2-オキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | 1.11 | 390 | A | |
| 1.46 | 2-オキシ-N-プロプ-2-イノキシ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド |  | 0.97 | 340 | A | |

10

20

30

【0224】

生物学的実施例

ウェルプレートにおける葉片テストの一般的実施例：

様々な植物種の葉片または葉切片を、温室で生育した植物から切り取る。切り取られた葉片または葉切片を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の素寒天培地上に載せる。播種前（予防）または播種後（治療）に、葉片にテスト溶液を噴霧する。テストされる化合物を、DMSO溶液（最大10mg/ml）として調製し、それを、噴霧の直前に0.025%のTween 20で適切な濃度に希釈する。播種された葉片または葉切片を、それぞれのテストシステムに応じて、所定の条件（温度、相対湿度、光など）下でインキュベートする。病害のレベルの単一の評価を、病原体応答系に応じて、播種から3~14日後に行う。次いで、未処理の検査用葉片または葉切片と比した病害防除割合を計算する。

40

【0225】

ウェルプレートにおける液体培養テストの一般的実施例：

50

真菌の液体培養から新たに調製されたかまたは極低温保管しておいた真菌の菌糸体断片または分生子懸濁液を、栄養液体培地に直接混合する。テスト化合物（最大10mg/ml）のDMSO溶液を0.025%のTween 20で50倍に希釈し、10μlのこの溶液をピペットでマイクロタイタープレート（96ウェル型）に入れる。次いで、真菌の芽胞/菌糸断片を含有する栄養液体培地を加えて、テスト化合物の最終濃度を得る。テストプレートを、暗所にて24および96%の相対湿度でインキュベートする。真菌の成長の阻害を、病原体応答系に応じて、2~7日後に測光法により計測し、未処理の対照と比した抗真菌活性割合を計算する。

【0226】

実施例1：プッシニアレコンディタ *f. sp. トリシティ* (*Puccinia reconditata f. sp. tritici*) に対する殺菌・殺カビ活性/コムギ/葉片予防（赤さび病）

コムギ葉切片 (cv. Kanzler) を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天上に載せ、水で希釈された配合されたテスト化合物を噴霧した。葉片に、適用から1日後に真菌の胞子懸濁液を播種した。播種された葉切片を、気候キャビネット中において、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下で、19および75%の相対湿度 (rh) でインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉切片に現われた時点で（適用から7~9日後）、未処理のものとは比した病害防除割合として評価した。

【0227】

以下の化合物は、適用される配合物中200ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

【0228】

化合物（表T1より）1.1、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.12、1.13、1.14、1.15、1.16、1.17、1.18、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.27、1.28、1.31、1.32、1.34、1.35、1.37、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42および1.43。

【0229】

実施例2：プッシニアレコンディタ *f. sp. トリシティ* (*Puccinia reconditata f. sp. tritici*) に対する殺菌・殺カビ活性/コムギ/葉片治療（赤さび病）

コムギ葉切片 (cv. Kanzler) を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天上に載せる。次いで、葉切片に、真菌の胞子懸濁液を播種する。プレートを暗所にて19および75%の相対湿度で保管した。水で希釈された配合されたテスト化合物を、播種から1日後に適用した。葉切片を、気候キャビネット中において、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下で、19および75%の相対湿度でインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉切片に現われた時点で（適用から6~8日後）、未処理のものとは比した病害防除割合として評価した。

【0230】

以下の化合物は、適用される配合物中200ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも80%の病害防除もたらす。

【0231】

化合物（表T1より）1.1、1.5、1.7、1.9、1.10、1.11、1.12、1.13、1.14、1.15、1.16、1.17、1.18、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.25、1.26、1.27、1.28、1.30、1.31、1.32、1.34、1.35、1.36、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42および1.43。

10

20

30

40

50

【0232】

実施例3：ファコプソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) に対する殺菌・殺カビ活性/ダイズ/葉片予防(アジア型ダイズさび病)

ダイズ葉片を、マルチウェルプレート(24ウェル型)中の素寒天培地上に載せ、水で希釈された配合されたテスト化合物を噴霧する。適用から1日後、下側の葉面に孢子懸濁液を噴霧することによって、葉片に播種する。気候キャビネット中において、20 および75%の相対湿度で、暗闇で24~36時間のインキュベーション期間の後、葉片を、12時間の光/日および75%の相対湿度で、20 に保持する。化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉片に現われた時点で(適用から12~14日後)、未処理のものとはした病害防除割合として評価する。

10

【0233】

以下の化合物は、適用される配合物中200ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

【0234】

化合物(表T1より)1.21、1.24、1.25、1.31、1.34、1.37、1.39、1.41、1.42、および1.43。

【0235】

実施例4：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*)) に対する殺菌・殺カビ活性、液体培養/キュウリ/予防(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、真菌孢子を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを24 でインキュベートし、適用から3~4日後に、成長の阻害を測光法により計測する。

20

【0236】

以下の化合物は、適用される配合物中20ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

30

【0237】

化合物(表T1より)1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.12、1.13、1.14、1.15、1.16、1.17、1.18、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.27、1.28、1.29、1.30、1.31、1.32、1.33、1.34、1.35、1.36、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42および1.43。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

| |
|---|
| International application No PCT/EP2017/075080 |
|---|

| A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. A01N43/82 C07D413/10 C07D271/06 ADD. | | |
|---|--|--|
| According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC | | |
| B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A01N C07D | | |
| Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched | | |
| Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data | | |
| C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
| A | WO 2015/185485 A1 (BASF SE) 10 December 2015 (2015-12-10) cited in the application claim 1 ----- | 1-14 |
| A,P | WO 2017/157962 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 21 September 2017 (2017-09-21) claims ----- | 1-14 |
| A,P | WO 2017/076742 A1 (BASF SE) 11 May 2017 (2017-05-11) claims ----- | 1-14 |
| <input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex. | | |
| * Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family | | |
| Date of the actual completion of the international search | | Date of mailing of the international search report |
| 21 November 2017 | | 05/12/2017 |
| Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016 | | Authorized officer |
| | | Elliott, Adrian |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2017/075080

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|--|------------------|-------------------------|-----------------------------|
| WO 2015185485 | A1 | 10-12-2015 | AR 100770 A1 02-11-2016 |
| | | | AU 2015270651 A1 22-12-2016 |
| | | | CA 2950084 A1 10-12-2015 |
| | | | CN 106455572 A 22-02-2017 |
| | | | EP 3151669 A1 12-04-2017 |
| | | | US 2017144980 A1 25-05-2017 |
| | | | WO 2015185485 A1 10-12-2015 |
| ----- | | | |
| WO 2017157962 | A1 | 21-09-2017 | NONE |
| ----- | | | |
| WO 2017076742 | A1 | 11-05-2017 | NONE |
| ----- | | | |

フロントページの続き

| (51)Int.Cl. | | | F I | | | テーマコード(参考) |
|--------------------------------|--|--|---------|-------|--|------------|
| A 0 1 N 43/84 (2006.01) | | | A 0 1 N | 43/84 | | 1 0 1 |
| A 0 1 N 47/12 (2006.01) | | | A 0 1 N | 47/12 | | 1 0 1 |

(81)指定国・地域 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT

(特許庁注：以下のものは登録商標)

1 . T W E E N

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100196405

弁理士 小松 邦光

(72)発明者 ホフマン トマス ジェイムズ

スイス 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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 スティエルリ ダニエル

スイス 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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ボーデニエ ルノー

スイス 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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 プリオ マルタン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ピッテルナ トマス

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

Fターム(参考) 4C056 AA01 AB02 AC05 AD01 AE03 FA16 FB01 FC01

4C063 AA01 BB09 CC58 CC72 CC82 CC92 DD51 DD58 EE03

4H011 AA01 BA01 BB10 BB13 BB15 BC01 BC03 BC05 BC06 BC07

BC16 BC18 BC19 BC20 DA02 DA05 DA15 DA16 DD03 DH03

DH10