

(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2019-526535
(P2019-526535A)

(43) 公表日 令和1年9月19日(2019.9.19)

(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 53/12 (2006.01)	AO1N 53/12	
AO1N 43/836 (2006.01)	AO1N 43/836	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 72 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2019-503235 (P2019-503235)
 (86) (22) 出願日 平成29年7月19日 (2017.7.19)
 (85) 翻訳文提出日 平成31年1月21日 (2019.1.21)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2017/068277
 (87) 国際公開番号 W02018/015458
 (87) 国際公開日 平成30年1月25日 (2018.1.25)
 (31) 優先権主張番号 16180826.6
 (32) 優先日 平成28年7月22日 (2016.7.22)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁 (EP)

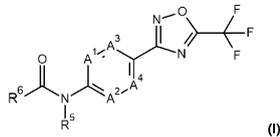
(71) 出願人 300091441
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アーゲー
 スイス国4058 バーゼル、シュバルツ
 バルトアレー 215
 (74) 代理人 100094569
 弁理士 田中 伸一郎
 (74) 代理人 100088694
 弁理士 弟子丸 健
 (74) 代理人 100103610
 弁理士 ▲吉▼田 和彦
 (74) 代理人 100084663
 弁理士 箱田 篤
 (74) 代理人 100093300
 弁理士 浅井 賢治

最終頁に続く

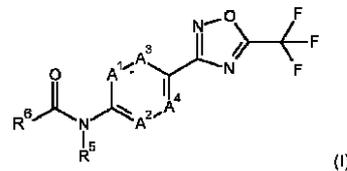
(54) 【発明の名称】 殺微生物オキサジアゾール誘導体

(57) 【要約】

有害生物防除剤、特に、殺菌・殺力ビ剤として有用な、式(I)



(I)



(II)

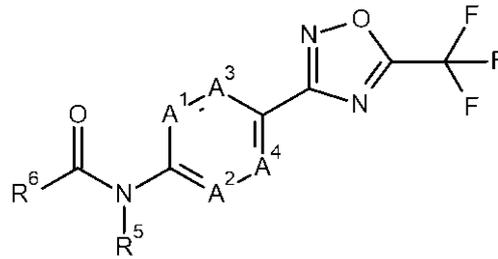
(式中、置換基は、請求項1に定義されているとおりである)の化合物。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

10

(式中、

A¹はCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシであり；

A²はCR²を表し、ここで、R²は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシであり；

A³はCR³を表し、ここで、R³は、水素またはハロゲンであり；

A⁴はCR⁴を表し、ここで、R⁴は、水素またはハロゲンであり；

ここで、A¹、A²、A³またはA⁴の少なくとも1つはC-Hではなく；

R⁵は、水素、C₁₋₄アルキル、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₆アルキニル、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキルを表し；

R⁶は、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₃アルキル、フェニル、フェニルC₁₋₃アルキル、フェノキシC₁₋₃アルキル、フェニルチオC₁₋₃アルキル、ヘテロアリーールまたはヘテロアリーールC₁₋₃アルキル（ここで、前記ヘテロアリーール部分はN、OおよびS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5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC₁₋₃アルキルまたはヘテロシクリルオキシC₁₋₃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4員～6員非芳香族環である）を表し、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリーールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、R⁷から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基によって任意に置換されており；

R⁷は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルコキシ、C₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、N-C₁₋₄アルキルアミノカルボニルまたはN、N-ジ-C₁₋₄アルキルアミノカルボニルを表すと共に、追加的に、シクロアルキルおよびヘテロシクリル部分については、オキソ(=O)を表す

の化合物、または、その塩もしくはN-オキシド。

【請求項 2】

A¹がCR¹であり、ここで、R¹はフルオロまたはメチルであり、および、A²～A⁴はC-Hである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

R⁵が水素である、請求項1または請求項2に記載の化合物。

【請求項 4】

R⁶が、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₃アルキル、フェニル、フェニルC₁₋₃アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC₁₋₃アルキルまたはヘテロシクリルオキシC₁₋₃アルキルであり、前記ヘテロシクリル部分が、N、OおよびSから個々に選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員非芳香族環である、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

50

R⁶が、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₃アルキル、フェニル、フェニルC₁₋₃アルキル、ヘテロシクリルであり、前記ヘテロシクリル部分が、1もしくは2個の酸素原子を含む5員非芳香族環である、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R⁶が、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、フェニル、テトラヒドロフラン-2-イルまたはテトラヒドロフラン-3-イルである、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R⁶が、R⁷から選択される同一であっても異なってもよい1もしくは2個の置換基によって任意に置換されている、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項8】

R⁷が、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、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、メトキシカルボニル、メチルアミノカルボニルまたはN,N-ジメチルアミノカルボニルである、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

R⁷が、フルオロ、クロロ、シアノ、メチル、エチルまたはメトキシである、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項1～9のいずれか一項に記載の式(I)の化合物を含む農芸化学組成物。

20

【請求項11】

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む、請求項10に記載の組成物。

【請求項12】

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1～9のいずれか一項に記載の式(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、前記植物、その一部またはその生息地に適用されることを特徴とする、方法。

【請求項13】

殺菌・殺カビ剤としての、請求項1～9のいずれか一項に記載の式(I)の化合物の使用。

30

【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】

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。

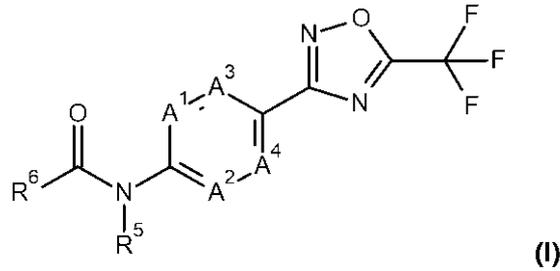
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明によれば、式(I)の化合物：

【化 1】



(式中、

10

A¹はCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシであり；

A²はCR²を表し、ここで、R²は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシであり；

A³はCR³を表し、ここで、R³は水素またはハロゲンであり；

A⁴はCR⁴を表し、ここで、R⁴は水素またはハロゲンであり；

ここで、A¹、A²、A³またはA⁴の少なくとも1つはC-Hではなく；

R⁵は、水素、C₁₋₄アルキル、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₆アルキニル、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキルを表し；

R⁶は、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₃アルキル、フェニル、フェニルC₁₋₃アルキル、フェノキシC₁₋₃アルキル、フェニルチオC₁₋₃アルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーールC₁₋₃アルキル（ここで、ヘテロアリーール部分はN、OおよびS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5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC₁₋₃アルキルまたはヘテロシクリルオキシC₁₋₃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4員～6員非芳香族環である）を表し、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリーールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、R⁷から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基によって任意選択により置換されており；

20

R⁷は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄ハロアルコキシ、C₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、N-C₁₋₄アルキルアミノカルボニルまたはN,N-ジ-C₁₋₄アルキルアミノカルボニルを表すと共に、追加的に、シクロアルキルおよびヘテロシクリル部分については、オキソ(=O)を表す)

30

または、その塩もしくはN-オキシドが提供されている。

【0004】

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】

40

【0005】

本発明の第2の態様によれば、殺菌・殺力比的に(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・殺力比的に有効な量の式(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。

50

【0007】

本発明の第4の態様によれば、殺菌・殺力ピ剤 (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、シアノは -CN 基を意味する。

10

【0010】

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。

【0011】

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。

【0012】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄アルキル」という用語は、炭素原子および水素原子のみからなり、不飽和を含有せず、1~4個の炭素原子を有し、および、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。C₁₋₂アルキルは相応に解釈されるべきである。C₁₋₄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-ブチルおよび1-ジメチルエチル (t-ブチル) が挙げられる。「C₁₋₄アルキレン」基は、C₁₋₆アルキル (および、C₁₋₂アルキルおよびC₁₋₃アルキル) の対応する定義を指すが、2つの単結合によって分子の残部に結合しているラジカルは除く。C₁₋₄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。

20

【0013】

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)、ブタ-1-エニルが挙げられる。

30

【0014】

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)、ブタ-1-イニルが挙げられる。

40

【0015】

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、一般に上記に定義されているC₁₋₄アルキルラジカルである。C₁₋₂アルコキシは相応に解釈されるべきである。C₁₋₄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、t-ブトキシが挙げられる。

【0016】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄ハロアルキル」という用語は、同一または異なる1個以上のハロゲン原子によって置換されている一般に上記に定義されているC

50

C_{1-4} アルキルラジカルを指す。 C_{1-4} 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、2, 2, 2 - トリフルオロエチルが挙げられる。

【0017】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} 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_a は、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキレンラジカルである。 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキルは相応に解釈されるべきである。

【0018】

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」という用語は式 $-C(O)OR_a$ のラジカルを指し、ここで、 R_a は、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルラジカルである。

10

【0019】

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」という用語は式 $-C(O)NHR_a$ のラジカルを指し、ここで、 R_a は、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルラジカルである。

【0020】

本明細書において用いられるところ、「 $N, N - ジ - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル」という用語は式 $-C(O)N(R_a)(R_b)$ のラジカルを指し、ここで、 R_a および R_b は相互に独立して、同一のまたは異なる、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルラジカルである。

20

【0021】

本明細書において用いられるところ、オキソは、 $=O$ 基、例えば、ケトニル ($-C(=O)-$) 酸素を意味する。

【0022】

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。 C_{3-6} シクロアルキルは相応に解釈されるべきである。 C_{3-8} 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。

30

【0023】

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 C_{1-3} アルキル」という用語は、上記に定義されている C_{1-3} 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 C_{3-8} シクロアルキル環を指す。「 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキル」および「 C_{3-4} シクロアルキル C_{1-2} アルキル」という用語は相応に解釈されるべきである。 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-3} 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、シクロブチル - エチルおよびシクロペンチル - プロピルが挙げられる。

【0024】

本明細書において用いられるところ、「フェニル C_{1-3} アルキル」という用語は、上記に定義されている C_{1-3} 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 C_{1-3} 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。

40

【0025】

本明細書において用いられるところ、「フェノキシ C_{1-3} アルキル」という用語は、上記に定義されている C_{1-3} 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ノキシラジカル ($PhO-$) を指す。

【0026】

本明細書において用いられるところ、「フェニルチオ C_{1-3} アルキル」という用語は、上記に定義されている C_{1-3} 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

50

ニルチオラジカル (PhS-) を指す。

【0027】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリアル」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もしくは3個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員単環式芳香族環を指す。ヘテロアリアルラジカルは、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。ヘテロアリアルの例としては、フリル、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、ピリミジニルまたはピリジニルが挙げられる。

【0028】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリアルC₁₋₃アルキル」という用語は、上記に定義されているC₁₋₃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アル環を指す。

【0029】

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4員～6員非芳香族単環式環を指す。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、ピロリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル、ペペリジニル、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、 β -ラクタミル、ペルヒドロアゼピニルが挙げられる。

【0030】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリルC₁₋₃アルキル」という用語は、上記に定義されているC₁₋₃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。

【0031】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリルオキシC₁₋₃アルキル」という用語は式 -R_aOR_bのラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記に定義されているC₁₋₃アルキレンラジカルであり、および、R_bは、上記に定義されているヘテロシクリルラジカルである。

【0032】

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。

【0033】

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。

【0034】

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. Albin and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

10

20

30

40

50

【0035】

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 および R^7 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る。

【0036】

A^1 は CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシである。好ましくは、 R^1 は、クロロ、フルオロまたはメチルであり、より好ましくはフルオロまたはメチルである。

10

【0037】

A^2 は CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシである。好ましくは、 R^2 は、水素、クロロ、フルオロまたはメチルである。より好ましくは、 R^2 は水素である。

【0038】

A^3 は CR^3 を表し、ここで、 R^3 は、水素またはハロゲンである。好ましくは、 R^3 は水素またはフルオロである。より好ましくは、 R^3 は水素である。

20

【0039】

A^4 は CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素またはハロゲンである。好ましくは、 R^4 は水素である。

【0040】

本発明によれば、 A^1 、 A^2 、 A^3 または A^4 の少なくとも1つはC-Hではない。好ましくは、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の3つがC-Hであり、特に、 A^2 、 A^3 および A^4 がC-Hである。もっとも好ましくは、 A^1 が CR^1 である場合、 R^1 は、クロロ、フルオロまたはメチルであり、および、 $A^2 \sim A^4$ はC-Hである。

【0041】

R^5 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキルを表す。好ましくは、 R^5 は、水素、メチルまたはメトキシを表す。より好ましくは、 R^5 は水素である。

30

【0042】

R^6 は、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-3} アルキル、フェノキシ C_{1-3} アルキル、フェニルチオ C_{1-3} アルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーール C_{1-3} アルキル(ここで、ヘテロアリーール部分はN、OおよびS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5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-3} アルキルまたはヘテロシクリルオキシ C_{1-3} 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4員~6員非芳香族環である)を表し、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリーールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、 R^7 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基によって任意選択により置換されている。

40

【0043】

好ましくは、 R^6 は、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-3} アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-3} アルキルまたはヘテロシクリルオキシ C_{1-3} アルキルであり、ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから個々に選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員非芳香族環である。より好ましくは、 R^6 は、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-3} アルキル、ヘテロシクリルであり、ここで、ヘテロシクリル部分は1もしくは2個の酸素原子を含む5員非芳香族環である。さらにより好まし

50

くは、 R^6 は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、フェニル、ベンジル、テトラヒドロフラン - 2 - イルまたはテトラヒドロフラン - 3 - イルである。さらにより好ましくは、 R^6 は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、フェニル、テトラヒドロフラン - 2 - イルまたはテトラヒドロフラン - 3 - イルである。

【0044】

R^6 は、 R^7 から選択される同一であっても異なってもよい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てもよい。

【0045】

R^7 は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニルまたはN, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノカルボニルを表すと共に、追加的に、シクロアルキルおよびヘテロシクリル部分については、オキソ (= O) を表す。好ましくは、 R^7 は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、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、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、N - C_{1-4} アルキルアミノカルボニルまたはN, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノカルボニルを表す。より好ましくは、 R^7 は、フルオロ、クロロ、シアノ、メチル、エチル、メトキシから選択される。

【0046】

好ましくは、式 (I) に係る化合物は、表 T 1 (以下) に列挙されている化合物 1. 1 ~ 1. 21 から選択される。

【0047】

好ましくは、本発明の式 (I) に係る化合物において、 A^1 は CR^1 であり、ここで、 R^1 は、クロロ、フルオロまたはメチルであり；

$A^2 \sim A^4$ はC - Hであり；

R^5 は、水素、メチルまたはメトキシであり；ならびに

R^6 は、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-3} アルキル、フェノキシ C_{1-3} アルキル、フェニルチオ C_{1-3} アルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーール C_{1-3} アルキル (ここで、ヘテロアリーール部分はN、OおよびS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5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-3} アルキルまたはヘテロシクリルオキシ C_{1-3} 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4員 ~ 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、ヘテロアリーールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、 R^7 から選択される同一であっても異なってもよい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；ならびに

R^7 は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、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、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、N - C_{1-4} アルキルアミノカルボニルまたはN, N - ジ - C_{1-4} アルキルアミノカルボニルである。

【0048】

より好ましくは、 A^1 は CR^1 であり、ここで、 R^1 は、クロロ、フルオロまたはメチルであり；

$A^2 \sim A^4$ はC - Hであり；

R^5 は、水素、メチルまたはメトキシであり；および

R^6 は、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-3} アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-3} アルキルまたはヘテロシクリルオキシ C_{1-3} アルキルであり、ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから個々に選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員非芳香族環であり、な

10

20

30

40

50

らびに、シクロアルキル、フェニルおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、 R^7 から選択される同一であっても異なってもよい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；ならびに

R^7 は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、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、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $N - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニルまたは $N, N - ジ - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニルである。

【0049】

さらにより好ましくは、 A^1 は CR^1 であり、ここで、 R^1 は、クロロ、フルオロまたはメチルであり；

$A^2 \sim A^4$ は $C - H$ であり；

R^5 は水素であり；ならびに

R^6 は、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-3} アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-3} アルキルまたはヘテロシクリルオキシ C_{1-3} アルキルであり、ここで、ヘテロシクリル部分は、 N 、 O および S から個々に選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員非芳香族環であり、ならびに、シクロアルキル、フェニルおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、 R^7 から選択される同一であっても異なってもよい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；ならびに

R^7 は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、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、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $N - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニルまたは $N, N - ジ - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニルである。

【0050】

さらにより好ましくは、 A^1 は CR^1 であり、ここで、 R^1 はフルオロまたはメチルであり；

$A^2 \sim A^4$ は $C - H$ であり；

R^5 は水素であり；ならびに

R^6 は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、フェニル、ベンジル、テトラヒドロフラン - 2 - イルまたはテトラヒドロフラン - 3 - イルであり、ここで、シクロアルキル、フェニルおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、 R^7 から選択される同一であっても異なってもよい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；ならびに

R^7 は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、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、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $N - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニルまたは $N, N - ジ - C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニルである。

【0051】

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、 CF_3 -オキサジアゾールモチーフで式(I-Ib)および式(I-Ia)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-Ia)および式(I-IIa)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。本発明の式(I)の化合物に対する参照における A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の記載は、式(I-I)および式(I-II)の化合物に広く適用され、以下の表1.1~1.12の化合物、または、表T1(以下)に記載の化合物1.1~1.21において表記されている A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 の組み合わせの特定の開示についても同様である。

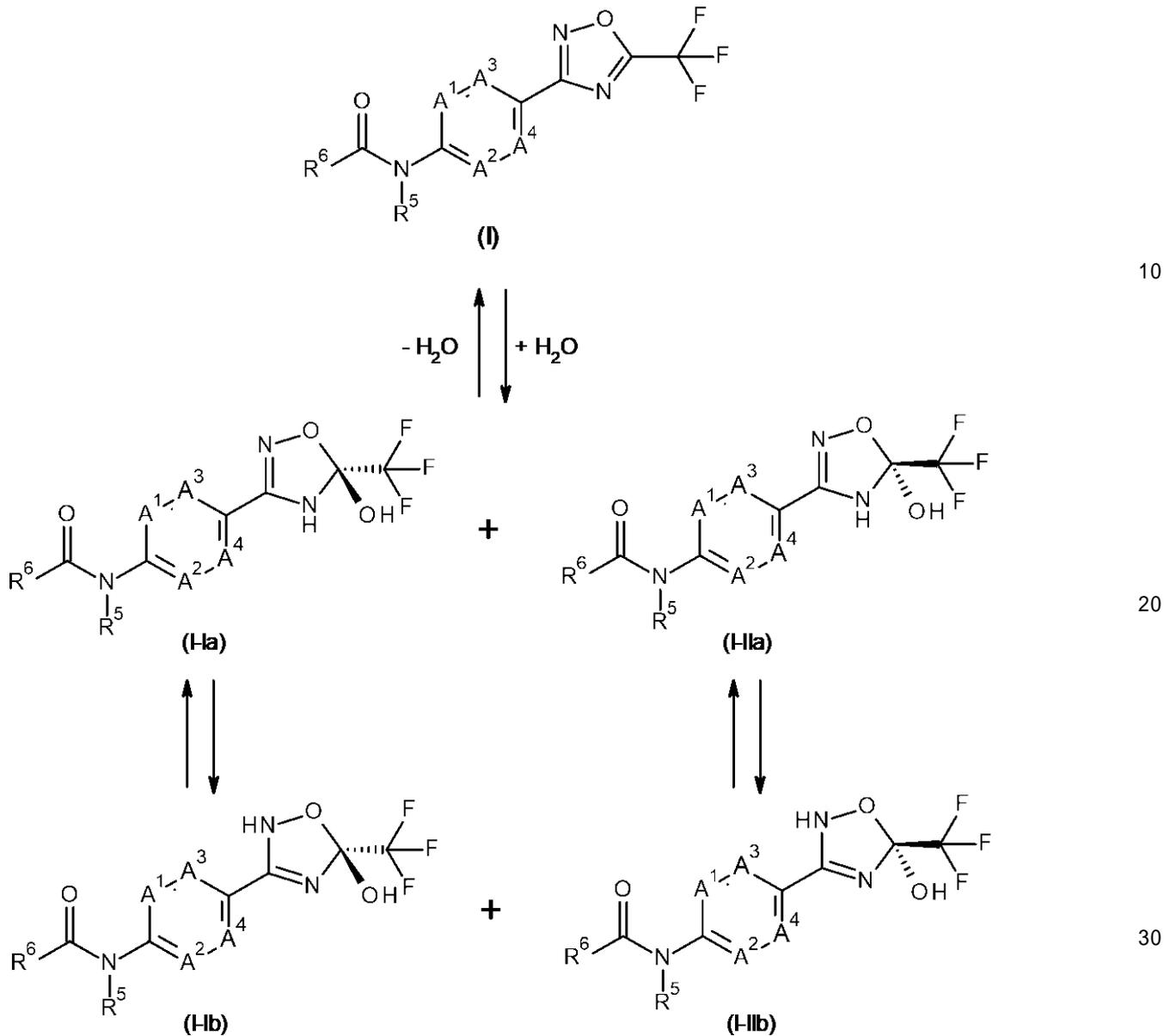
10

20

30

40

【化2】



10

20

30

【0052】

本発明の化合物は、以下のスキーム1～5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)の化合物について上記に定義されているとおりである。

【0053】

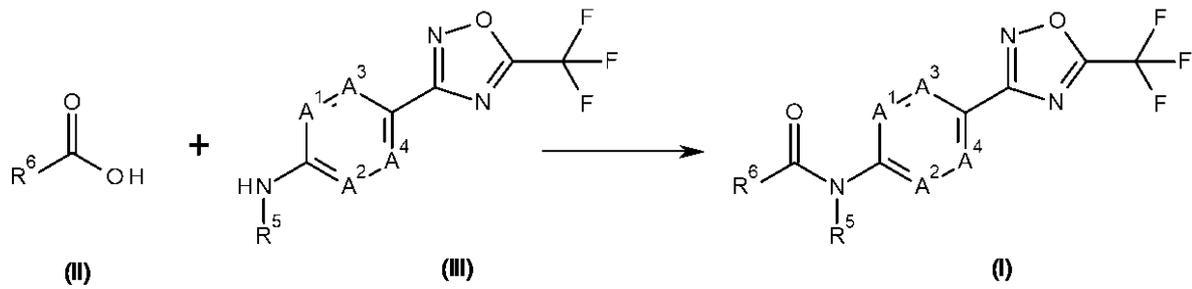
式(I)の化合物は、好ましくは好適な溶剤(例えば、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン)中において、好ましくは25～100の温度で、および、任意選択により、トリエチルアミンもしくはN,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下に、または、アミドカップリングについて文献に記載されている条件下で、式(II)の化合物のカルボン酸官能基を活性化させることによる式(II)の化合物および式(III)の化合物を伴うアミドカップリング変換によって得ることが可能である(このプロセスは通常、式(III)の化合物による処理の前に、例えば(COCl)₂またはSOCl₂を用いることにより、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)。これは以下のスキーム1に示されている。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(II)の化

40

50

化合物は市販されている。これは以下のスキーム 1 に示されている。

【化 3】



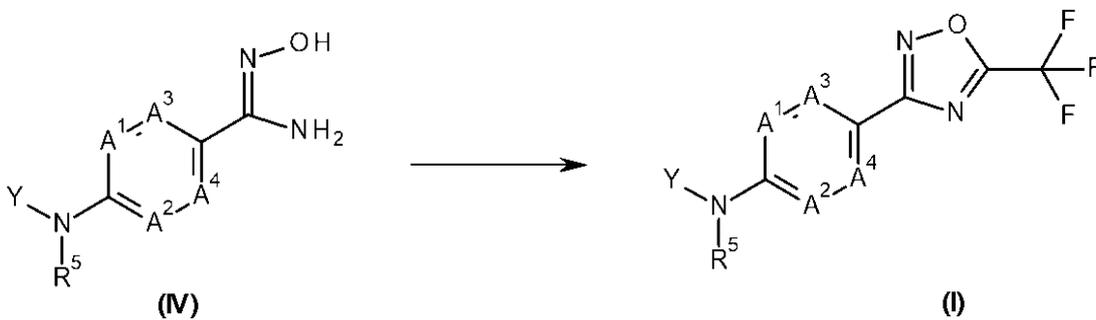
スキーム 1

10

【0054】

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 (式中、Y は H または C (=O) R⁶ を表す) 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】



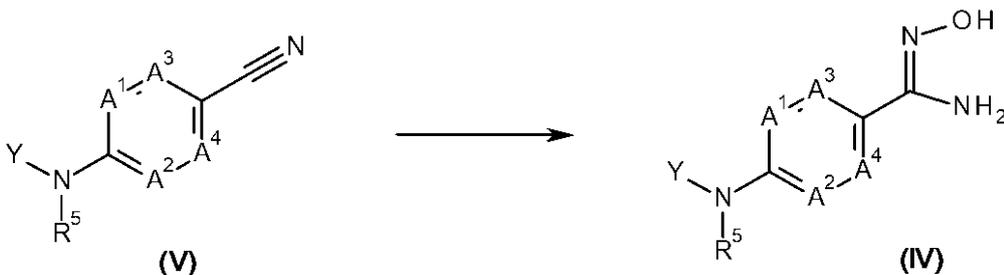
スキーム 2

20

【0055】

式 (IV) の化合物 (式中、Y は H または C (=O) R⁶ を表す) 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塩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。この反応はスキーム 3 に示されている。

【化 5】



スキーム 3

40

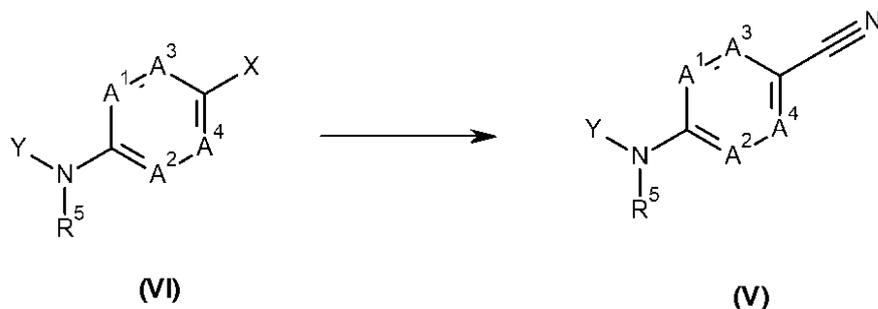
【0056】

さらに、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 CuCN 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

50

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。この反応はスキーム4に示されている。

【化6】

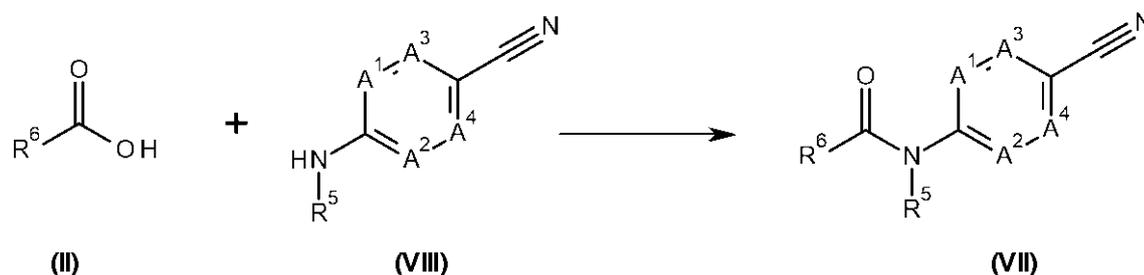


スキーム4

【0057】

式(VII)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(II)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(VIII)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(VIII)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）。これは以下のスキーム5に示されている。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(II)の化合物および式(VIII)の化合物は市販されている。これは以下のスキーム5に示されている。

【化7】



スキーム5

【0058】

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。

【0059】

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

10

20

30

40

50

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。

【0060】

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。

【0061】

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。

10

【0062】

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。

20

【0063】

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。

30

【0064】

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。

【0065】

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. terrus*) を含むアスペルギルス属の一種 (*Aspergillus spp.*)、*A. プルランス* (*A. pullulans*) を含むアウレオバシジウム属の一種 (*Aureobasidium spp.*)、*ブラストミセスデルマチチディス* (*Blastomyces dermatitidis*)、*ブルメリアグラミニス* (*Blumeria graminis*)、*プレミアラクツカエ* (*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

40

50

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ズ (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp.)、*C.アラキジコラ* (*C. arachidicola*) を含むセルコスポラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスפורリジウムペルソナツム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスפור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ズ (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp.)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp.)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp.)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp.)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp.)、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、*E.シコラセアルム* (*E. cichoracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、*F.クルモルム* (*F. culmorum*)、*F.グラミネアルム* (*F. graminearum*)、*F.ラングセチエ* (*F. langsethiae*)、*F.モニリホルメ* (*F. moniliforme*)、*F.オキシスポルム* (*F. oxysporum*)、*F.プロリフェラツム* (*F. proliferatum*)、*F.スブグルチナンス* (*F. subglutinans*)、*F.ソラニ* (*F. 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ROI (*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムムサルム (*Gloeosporium musarum*)、グロメラリングレート (*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.カプストラツム* (*H. capsulatum*) を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、レプトグラフィウムリンデルギ (*Leptographium lindbergi*)、レベイルラタウリカ (*Leveillula taurica*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、ミクロスポルム属の一種 (*Microsporium* spp.)、モニリニア属の一種 (*Monilinia* spp.)、ムコール属の一種 (*Mucor* spp.)、コムギ葉枯病菌 (*M. graminicola*)、*M.ポミ* (*M. pomi*) を含むミコスファエレラ属の一種 (*Mycosphaerella* spp.)、オンコバシジウムテオブロマエオン (*Oncobasidium theobromaen*)、オフィオストマピセエ (*Ophiostoma piceae*)、パラコジディオイデス属の一種 (*Paracoccidioides* spp.)、*P.ディジタツム* (*P. digitatum*)、*P.イタリクム* (*P. italicum*) を含むペニシリウム属の一種 (*Penicillium* spp.)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium* spp.)、*P.メイディス* (*P. m*

aydis)、P. フィリピンシス (P. philippinensis) および P. ソルギ (P. sorghi) を含むペロノスクレロスポラ属の一種 (Peronosclerospora spp.)、ペロノスポラ属の一種 (Peronospora spp.)、コムギふ枯病菌 (Phaeosphaeria nodorum)、ファコブソラパチリジ (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.)、ホモブシスビティコーラ (Phomopsis viticola)、P. インフェスタンス (P. infestans) を含むフィトフトラ属の一種 (Phytophthora spp.)、P. ハルステジイ (P. halstedii)、P. ビチコーラ (P. viticola) を含む 10 プラスモパラ属の一種 (Plasmopara spp.)、プレオスポラ属の一種 (Pleospora spp.)、リンゴうどんこ病菌 (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. クベンシス (P. cubensis)、P. フムリ (P. humuli) を含むシュードペロノスポラ属の一種 (Pseudoperonospora spp.)、シュードベジザトラケイフィラ (Pseudopeziza tracheiphila)、P. ホルデイ (P. hordei)、P. レコンディタ (P. 20 recondita)、P. ストリイホルミス (P. striiformis)、P. トリチシナ (P. trititina) を含むプッシニア属の一種 (Puccinia spp.)、ピレノベジザ属の一種 (Pyrenopeziza spp.)、ピレノフォラ属の一種 (Pyrenophora spp.)、イネいもち病菌 (P. oryzae) を含むピリクラリア属の一種 (Pyricularia spp.)、P. ウルチムム (P. ultimum) を含むピシウム属の一種 (Pythium spp.)、ラムラリア属の一種 (Ramularia spp.)、リゾクトニア属の一種 (Rhizoctonia spp.)、リゾムコールプシルス (Rhizomucor pusillus)、リゾプスアリズス (Rhizopus arrhizus)、リンコスפורウム属の一種 (Rhynchosporium spp.)、S. アピオスペルムム (S. apiospermum) および S. プロリフィカンス (S. proliferans) を含むセドスפור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)、チエラビオブシスバシコーラ (Thielaviopsis basicola)、チレチア属の一種 (Tilletia spp.)、T. ハルジアヌム (T. harzianum)、T. シュードコニンギイ (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 50

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)。

【0066】

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。

【0067】

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；例えばパミュダグラス、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、オリヴ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。

【0068】

「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、HPPD抑制剤、ALS抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロンおよびトリフロキシスルフロン、EPSPS (5-エノール-ピロピル-シキメート-3-リン酸塩-シターゼ) 抑制剤、GS (グルタミンシンターゼ) 抑制剤またはPPO (プロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ) 抑制剤など) に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来の交配方法 (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。

【0069】

「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。

【0070】

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) (CryIIIB (b1) トキシンを発現するトウモロコシ品種)；YieldGard

10

20

30

40

50

Plus (登録商標) (CryIA(b)およびCryIIIB(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。

10

【0071】

「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。

20

【0072】

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センス(*Photobacterium luminescens*)、ゼノラバダスネマトフィルス(*Xenorhabdus nematophilus*)などの、例えばフォトラバダス属の一種(*Photobacterium* spp.)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イナーゼ抑制剤;リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サ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、ピ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。

30

40

【0073】

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

50

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）。

【0074】

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A-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A-0427529号明細書、欧州特許出願公開第A-451878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

10

【0075】

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A-0367474号明細書、欧州特許出願公開第A-0401979号明細書および国際公開第90/13651号から公知である。

【0076】

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。

20

【0077】

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

30

40

【0078】

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-31790 St. Sauveur, France 製Bt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断型Cry1Abトキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ（ヨーロッパアワノメイガ（Ostrinia nubilalis）およびセサミアノナグリオイデス（Sesamia nonagrioides））に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ（Zea mays）

50

。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。

【0079】

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。

10

【0080】

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。

【0081】

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。

20

【0082】

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。

【0083】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium製1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質Cry1Fの発現、および、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するためのPATタンパク質の発現のために遺伝子操作されたトウモロコシ。

30

【0084】

7. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製NK603xMON810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。NK603xMON810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CP4EPSPS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。

40

【0085】

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、種子が土壌に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壌、種子および実生、ならびに、確立した植生

50

を含む。

【0086】

「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。

【0087】

「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。発芽後もしくは土壌から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物および若芽もまた挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全または部分的な処置によって保護されてもよい。好ましくは、「植物繁殖体」は種子を表すと理解される。

10

【0088】

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

20

【0089】

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。

【0090】

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。

30

【0091】

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、フーラー土、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。

【0092】

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

40

【0093】

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、フーラー土、ア

50

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。

【0094】

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。

【0095】

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、押出し成形、凝塊もしくはプリルによって形成されるか、または、天然のものである。このような材料の例は、パーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくずおよび粒状炭素である。シェルまたはメンブラン材料は、天然および合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタンおよびデンブンザンデートを含む。

【0096】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレンおよび他の有機溶剤などの、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における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。

【0097】

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。

【0098】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアピエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサソラン、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、-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

10

20

30

40

50

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 (P E G 4 0 0)、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。

【 0 0 9 9 】

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

【 0 1 0 0 】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体および固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は通常、使用される際、0.1% ~ 15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性または高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または、他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネート塩；ノニルフェノール - C . s u b . 1 8 エトキシレートなどのアルキルフェノール - アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール - C . s u b . 1 6 エトキシレートなどのアルコール - アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ (2 - エチルヘキシル) スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびに、モノおよびジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

【 0 1 0 1 】

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、浸透剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤および固着剤が挙げられる。

【 0 1 0 2 】

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 0 3 】

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 P e s t i c i d e M a n u a l ” , 1 5 t h E d . , B r i t i s h C r o p P r o t e c t i o n C o u n c i l 2 0 0 9 から公知である。

10

20

30

40

50

【0104】

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。

【0105】

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。

10

【0106】

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。

20

【0107】

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。

【0108】

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。

30

【0109】

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

40

50

、チオフェン殺菌・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。

【0110】

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-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(9-ジクロロメチレン-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノ-ナフタレン-5-イル)-アミド、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸メトキシ-[1-メチル-2-(2,4,6-トリクロロフェニル)-エチル]-アミド、1-メチル-3-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(2-ジクロロメチレン-3-エチル-1-メチル-インダン-4-イル)-アミド(1072957-71-1)、1-メチル-3-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(4'-メチルスルファニル-ピフェニル-2-イル)-アミド、1-メチル-3-ジフルオロメチル-4H-ピラゾール-4-カルボン酸[2-(2,4-ジクロロ-フェニル)-2-メトキシ-1-メチル-エチル]-アミド、(5-クロロ-2,4-ジメチル-ピリジン-3-イル)-(2,3,4-トリメトキシ-6-メチル-フェニル)-メタノン、(5-プロモ-4-クロロ-2-メトキシ-ピリジン-3-イル)-(2,3,4-トリメトキシ-6-メチル-フェニル)-メタノン、2-{2-[(E)-3-(2,6-ジクロロ-フェニル)-1-メチル-プロブ-2-エン-(E)-イリデンアミノオキシメチル]-フェニル}-2-[(Z)-メトキシイミノ]-N-メチル-アセトアミド、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソキサゾリン-3-イル]-ピリジン、(E)-N-メチル-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシ-イミノアセタミド、4-プロモ-2-シアノ-N,N-ジメチル-6-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-1-スルホンアミド、a-[N-(3-クロロ-2,6-キシリル)-2-メトキシアセタミド]-y-ブチロラクトン、4-クロロ-2-シアノ-N,N-ジメチル-5-p-トリルイミダゾール-1-スルホンアミド、N-アリル-4,5-ジメチル-2-トリメチルシリルチオフェン-3-カルボキサミド、N-(1-シアノ-1,2-ジメチルプロピル)-2-(2,4-ジクロロフェノキシ)プロピオンアミド、N-(2-メトキシ-5-ピリジル)-シクロプロパンカルボキサミド、(.+.-)-cis-1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-シクロヘプタノール、2-(1-t-ブチル)-1-(2-クロロフェニル)-3-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)-プロパン-2-オール、2',6'-ジプロモ-2-メチル-4-トリフルオロメトキシ-4'-トリフルオロメチル-1,3-チアゾール-5-カルボキシアニリド、1-イミダゾリル-1-(4'-クロロフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-オン、メチル(E)-2-[2-[6-(2-シアノフェノキシ)ピリミジン-4-イルオキシ]フェニル]3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-[6-(2-チオアミドフェノキシ)ピリミジン-4-イルオキシ]フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-[6-(2-フルオロフェノキシ)ピリミジン-4-イルオキシ]フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-[6-(2,6-ジフルオロフェノキシ)ピリミジン-4-イルオキシ]フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-[3-(ピリミジン-2-イルオキシ)フェノキシ]フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-[3-(5-メチルピリミジン-2-イルオキシ)-フェノキシ]フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-[3-(フェニル-スルホニルオキシ)フェノキシ]フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-[3-(4-ニトロフェノキシ)フェノキシ]フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-フェノキシフェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-(3,5-ジメチル-ベンゾイル)ピロール-1-イル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-(3-メトキシフェノキシ)フェニル]-3-メトキシアクリレート、メチル(E)-2-[2-(2-フェニルエテン

10

20

30

40

50

- 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジクロロフェノキシ)ピリジン - 3 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - (3 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ)フェノキシ)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - [3 - (- ヒドロキシベンジル)フェノキシ]フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - (4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオキシ)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - n - プロピルオキシ - フェノキシ)フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - イソプロピルオキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (2 - フルオロフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - エトキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (4 - 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 - プロピニルエチルカルバメート、2 , 3 , 3 - トリヨードアリアルアルコール、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロピニルアルコール、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 (5 H) - フラノンなどのフェノール; 4 , 5 - ジクロロジチアゾリノン、4 , 5 - ベンゾジチアゾリノン、4 , 5 - トリメチレンジチアゾリノン、4 , 5 - ジクロロ - (3 H) - 1 , 2 - ジチオール - 3 - オン、3 , 5 - ジメチル - テトラヒドロ - 1 , 3 , 5 - チアジジン - 2 - チオン、N - (2 - p - クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリド、アシベンゾラル、アシベタックス、アラニカルブ、アルベンダゾール、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、アミスルブロム、アモバム、アンプロピル
 ホス、アニラジン、アソメート、オーレオフンギン、アザコナゾール、アザフェンジン、
 アジチラム、アゾキシストロピン、バリウムポリスルフィド、ベナラキシール、ベナラキシ
 ル - M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントルロン、ベンチアバリカルブ、
 ベンチアゾール、塩化ベンザルコニウム、ベンザマクリル、ベンザモルフ、ベンゾヒドロ
 キサム酸、ベルベリン、ベトキサジン、ピロキサゾール、ピナパクリル、ピフェニル、ピ
 テルタノール、ピチオノール、ピキサフェン、ブラストサイジン - S、ボスカリド、プロ
 モタロニル、ブロムコナゾール、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、カルボキシム、カルプロバミド、カルボン、C G A 4 1 3 9 6、C G A 4
 1 3 9 7、キノメチオネート、キトサン、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロ
 ラニル、クロルフェナゾール、クロロネブ、クロルピクリン、クロロタロニル、クロロゾ
 リネート、クロゾリネート、クリンバゾール、クロトリマゾール、クロジラコン、酢酸銅
 、炭酸銅、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩化銅、オキシキノリン酸銅
 、ケイ酸銅、硫酸銅、タル油酸銅、クロム酸銅亜鉛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、ジフェンゾコート、ジフルメトリム、O
 , O - ジ - イソ - プロピル - S - ベンジルチオホスフェート、ジメフルアゾール、ジメタ
 クロン、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモール、ジニコナゾール、ジニコナ
 ザール - M、ジノブトン、ジノカップ、ジノクトン、ジノペントン、ジノスルホン、ジノ
 テルボン、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジスルフィラム、ジタリムホス、ジチアノ
 ン、ジチオエーテル、ドデシルジメチル塩化アンモニウム、ドデモルフ、ドジチン、ドジ
 ン、ドグアジン、ドラゾキシロン、エディフェンホス、エネストロプリン、エポキシコナ
 ザール、エタコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモール、エトキシキン、エチリ
 シン、エチル (Z) - N - ベンジル - N ([メチル (メチル - チオエチリデンアミノ - オ
 キシカルボニル) アミノ] チオ) - - アラニナト、エトリジアゾール、ファモキサドン
 、フェンアミドン、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾ
 ール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェノキサニル、フェンピクロ
 ニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルス
 ズ、トリフェニルスズヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジ
 オキシニル、フルメトベル (f l u m e t o v e r)、フルモルフ、フルピコリド、フル
 オピラム、フルオロイミド、フルトリマゾール、フルオキサストロピン、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
 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、
 フララキシール、フラメトピル、フルカルパニル、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
 ザール、イマザリル、硫酸イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、三酢酸イ
 ミノクタジン、イネジン、ヨードカルブ、イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾ
 ール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメ
 ート、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、イソバレジオン、イゾパムホス
 、カスガマイシン、クレソキシム - メチル、L Y 1 8 6 0 5 4、L Y 2 1 1 7 9 5、L Y
 2 4 8 9 0 8、マンコゼブ、マンジプロバミド、マンネブ、メベニル、メカルピンジド、
 メフェノキサム、メフェントリフルコナゾール、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水
 銀、塩化第一水銀、メブチルジノカップ、メタラキシール、メタラキシール - M、メタム、メ

10

20

30

40

50

タゾキサロン、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、オキシシン銅、オキシリン酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシ、バリノール、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、プロバミジン、プロバモカルブ、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、シルチオフアム、シメコナゾール、シブコナゾール、5塩化石炭酸ナトリウム、ソラテノル、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、スルトロペン、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン、チフルザミド、2 - (チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオフアネート - 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、ザリルアミド、ジネブ、ジラム、およびゾキサミド。

10

20

30

40

【0111】

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、レバミゾール、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、オキサニテルまたはモランテルなどのテトラヒドロピリミジンが挙げられる。追加の駆虫薬としては、トリクラベンダゾールおよびクロ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ブシبرانテルなどのセストサイド (cestocide) が挙げられる。

【0112】

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。

50

【 0 1 1 3 】

本発明の化合物は、国際公開第 9 6 / 1 5 1 2 1 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 9 6 / 1 1 9 4 5 号、国際公開第 9 3 / 1 9 0 5 3 号、国際公開第 9 3 / 2 5 5 4 3 号、欧州特許第 0 6 2 6 3 7 5 号明細書、欧州特許第 0 3 8 2 1 7 3 号明細書、国際公開第 9 4 / 1 9 3 3 4 号、欧州特許第 0 3 8 2 1 7 3 号明細書、および、欧州特許第 0 5 0 3 5 3 8 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。

【 0 1 1 4 】

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。

10

【 0 1 1 5 】

本発明の化合物は、例えば国際公開第 9 5 / 1 9 3 6 3 号または国際公開第 0 4 / 7 2 0 8 6 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。

【 0 1 1 6 】

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。

20

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、イソチオエート、イソキサチオン、マラチオン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチル - パラチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン - メチル、パラオキソン、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロパホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダペンチオン、キナルホス、スルプロホス、テムホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルピンホス、チメトン (t h i m e t o n)、トリアゾホス、トリクロルホン、パミドチオン。

30

【 0 1 1 7 】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - s e c - 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、H C N - 8 0 1、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、U C - 5 1 7 1 7。

40

【 0 1 1 8 】

ピレスロイド：アクリナチン (a c r i n a t h i n)、アレトリン、アルファメトリン (a l p h a m e t r i n)、5 - ベンジル - 3 - フリルメチル (E) - (1 R) - シス - 2 , 2 - ジメチル - 3 - (2 - オキソチオラン - 3 - イリデンメチル) シクロプロパンカルボキシレート、ピフェントリン、 - シフルトリン、シフルトリン、 - 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、N C I - 8 5 1 9 3、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

50

スフェンバレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロパトリン、フェンバレート、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、 α -シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、プレトリン（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、 α -シベルメトリン、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、 β -シベルメトリン。

【0119】

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。

10

【0120】

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、パチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）、ベンサルタップ、ピフェナゼート、ピナパクリル、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、カンフェクロル、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナピル、クロマフェノジド、クロチアニジン（*clothianidine*）、シロマジン、ジアクロデン、ジアフェンチウロン、DBI-3204、ジナクチン、ジヒドロキシメチルジヒドロキシピロリジン、ジノプトン、ジノカップ、エンドスルファン、エチプロール、エトフェンプロクス、フェナザキン、フルマイト、MTI-800、フェンピロキシメート、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルフェンジン、フルフェンプロックス、フルプロキシフェン、ハロフェンプロックス（*halofenprox*）、ヒドラメチルノン、IKI-220、カネマイト、NC-196、ニームガード、ニジノルテルフラン、ニテンピラム、SD-35651、WL-108477、ピリダリル、プロバルギット、プロトリフェンプト、ピメトロジン（*pymethrozine*）、ピリダベン、ピリミジフェン、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、シラフルオフエン、シロマジン、スピノサド、テブフェンピラド、テトラジホン、テトラナクチン（*tetranactin*）、チアクロプリド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラド、トリアザメート、トリエトキシスピノシン、トリナクチン、ベルブチン、ベルタレク、YI-5301。

20

30

【0121】

生物剤：パチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*）、パチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*） エンドトキシン、バキュロウイルス、昆虫病原性バクテリア、ウイルスおよび真菌。

40

【0122】

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。

【0123】

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

【0124】

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1.1~1.12（以下）に記載の化合物または表T1（以下）に記載の化合物1.1~1.2

50

1 から選択される 1 種の化合物を意味する。

【 0 1 2 5 】

石油（代替名）（ 6 2 8 ） + T X 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（ I U P A C 名）（ 9 1 0 ） + T X、 2 , 4 - ジクロロフェニルベンゼンスルホネート（ I U P A C / ケミカルア
 ブストラクツ名）（ 1 0 5 9 ） + T X、 2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - ナフチルア
 セドアミド（ I U P A C 名）（ 1 2 9 5 ） + T X、 4 - クロロフェニルフェニルスルホン
 （ I U P A C 名）（ 9 8 1 ） + T X、 アバメクチン（ 1 ） + T X、 アセキノシル（ 3 ） +
 T X、 アセトプロール [C C N] + T X、 アクリナトリン（ 9 ） + T X、 アルジカルブ（
 1 6 ） + T X、 アルドキシカルブ（ 8 6 3 ） + T X、 - シペルメトリン（ 2 0 2 ） + T
 X、 アミジチオン（ 8 7 0 ） + T X、 アミドフルメト [C C N] + T X、 アミドチオエー
 ト（ 8 7 2 ） + T X、 アミトン（ 8 7 5 ） + T X、 シュウ酸水素アミトン（ 8 7 5 ） + T
 X、 アミトラズ（ 2 4 ） + T X、 アラマイト（ 8 8 1 ） + T X、 三酸化ヒ素（ 8 8 2 ） +
 T X、 A V I 3 8 2（化合物コード） + T X、 A Z 6 0 5 4 1（化合物コード） + T
 X、 アジンホス - エチル（ 4 4 ） + T X、 アジンホス - メチル（ 4 5 ） + T X、 アゾベン
 ゼン（ I U P A C 名）（ 8 8 8 ） + T X、 アゾシクロチン（ 4 6 ） + T X、 アゾトエー
 ト（ 8 8 9 ） + T X、 ベノミル（ 6 2 ） + T X、 ベノキサホス（代替名） [C C N] + T X
 、 ベンゾキシメート（ 7 1 ） + T X、 ベンジル安息香酸塩（ I U P A C 名） [C C N] +
 T X、 ビフェナゼート（ 7 4 ） + T X、 ビフェントリン（ 7 6 ） + T X、 ビナバクリル（
 9 0 7 ） + T X、 プロフェンバレート（代替名） + T X、 プロモシクレン（ 9 1 8 ） +
 T X、 プロモホス（ 9 2 0 ） + T X、 プロモホス - エチル（ 9 2 1 ） + T X、 プロモプロ
 ピレート（ 9 4 ） + T X、 ププロフェジン（ 9 9 ） + T X、 プトカルボキシム（ 1 0 3 ）
 + T X、 プトキシカルボキシム（ 1 0 4 ） + T X、 プチルピリダベン（代替名） + T X、
 多硫化カルシウム（ I U P A C 名）（ 1 1 1 ） + T X、 カンフェクロル（ 9 4 1 ） + T X
 、 カーボノレート（ 9 4 3 ） + T X、 カルバリル（ 1 1 5 ） + T X、 カルボフラン（ 1 1
 8 ） + T X、 カルボフェノチオン（ 9 4 7 ） + T X、 C G A 5 0 ' 4 3 9（開発コード
 ）（ 1 2 5 ） + T X、 チノメチオナート（ 1 2 6 ） + T X、 クロルベンシド（ 9 5 9 ） +
 T X、 クロルジメホルム（ 9 6 4 ） + T X、 クロルジメホルム塩酸塩（ 9 6 4 ） + T X、
 クロルフェナピル（ 1 3 0 ） + T X、 クロルフェネトール（ 9 6 8 ） + T X、 クロルフェ
 ンソン（ 9 7 0 ） + T X、 クロルフェンスルフィド（ 9 7 1 ） + T X、 クロルフェンピ
 ン
 ホス（ 1 3 1 ） + T X、 クロロベンジラート（ 9 7 5 ） + T X、 クロロメブホルム（ 9 7
 7 ） + T X、 クロロメチウロン（ 9 7 8 ） + T X、 クロロプロピレート（ 9 8 3 ） + T X
 、 クロルピリホス（ 1 4 5 ） + T X、 クロルピリホス - メチル（ 1 4 6 ） + T X、 クロル
 チオホス（ 9 9 4 ） + T X、 シネリン I（ 6 9 6 ） + T X、 シネリン I I（ 6 9 6 ） + T
 X、 シネリン（ 6 9 6 ） + T X、 クロフェンテジン（ 1 5 8 ） + T X、 クロサンテル（代
 替名） [C C N] + T X、 クマホス（ 1 7 4 ） + T X、 クロタミトン（代替名） [C C N
] + T X、 クロトキシホス（ 1 0 1 0 ） + T X、 クフラネブ（ 1 0 1 3 ） + T X、 シアン
 トエート（ 1 0 2 0 ） + T X、 シフルメトフェン（ C A S 登録番号： 4 0 0 8 8 2 - 0 7
 - 7 ） + T X、 シハロトリン（ 1 9 6 ） + T X、 シヘキサチン（ 1 9 9 ） + T X、 シペル
 メトリン（ 2 0 1 ） + T X、 D C P M（ 1 0 3 2 ） + T X、 D D T（ 2 1 9 ） + T X、 デ
 メフィオン（ 1 0 3 7 ） + T X、 デメフィオン - O（ 1 0 3 7 ） + T X、 デメフィオン -
 S（ 1 0 3 7 ） + T X、 デメトン（ 1 0 3 8 ） + T X、 デメトン - メチル（ 2 2 4 ） + T
 X、 デメトン - O（ 1 0 3 8 ） + T X、 デメトン - O - メチル（ 2 2 4 ） + T X、 デメト
 ン - S（ 1 0 3 8 ） + T X、 デメトン - S - メチル（ 2 2 4 ） + T X、 デメトン - S - メ
 チルスルホン（ 1 0 3 9 ） + T X、 ジアフェンチウロン（ 2 2 6 ） + T X、 ジアリホス（
 1 0 4 2 ） + T X、 ダイアジノン（ 2 2 7 ） + T X、 ジクロフルアニド（ 2 3 0 ） + T X
 、 ジクロルボス（ 2 3 6 ） + T X、 ジクリホス（代替名） + T X、 ジコホル（ 2 4 2 ） +
 T X、 ジクロトホス（ 2 4 3 ） + T X、 ジエノクロル（ 1 0 7 1 ） + T X、 ジメホックス
 （ 1 0 8 1 ） + T X、 ジメトエート（ 2 6 2 ） + T X、 ジナクチン（代替名）（ 6 5 3 ）
 + T X、 ジネクス（ 1 0 8 9 ） + T X、 ジネクスジクレキシソ（ 1 0 8 9 ） + T X、 ジノ

10

20

30

40

50

ブトン (269) + TX、ジノカップ (270) + TX、ジノカップ - 4 [CCN] + TX
 X、ジノカップ - 6 [CCN] + TX、ジノクトン (1090) + TX、ジノペントン (1092) + TX、ジノスルホン (1097) + TX、ジノテルボン (1098) + TX
 、ジオキサチオン (1102) + TX、ジフェニルスルホン (IUPAC名) (1103) + TX、ジスルフィラム (代替名) [CCN] + TX、ジスルホトン (278) + TX
 、DNOC (282) + TX、ドフェナピン (1113) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、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 (337) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンピロキシメート (345) + TX、フェンソン (1157) + TX、フェントリファニル (1161) + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィプロニル (354) + TX、フルアクリピリム (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) + TX、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ルル) サリチレート (IUPAC名) (473) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリンI (696) + TX、ジャスモリンII (696) + TX、ヨードフェンホス (1248) + TX、リンダン (430) + TX、ルフェヌロン (490) + TX、マラチオン (492) + TX、マロノベン (1254) + TX、メカルバム (502) + TX、メホスホラン (1261) + TX、メスルフェン (代替名) [CCN] + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メソミル (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

10

20

30

40

50

ット(671)+TX、プロペタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、
 プロチダチオン(1360)+TX、プロトエート(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(1
 389)+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、SZE-
 121(開発コード)(757)+TX、フルバリネート(398)+TX、テブフ
 エンピラド(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(1
 443)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリ
 クロルホン(824)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリアクチン(代替
 名)(653)+TX、バミドチオン(847)+TX、バニリプロール[CCN]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
 スズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(34
 7)+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)[C
 CN]+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)[C
 CN]+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、
 クロラロース(127)+TX、エンドリン(1122)+TX、フェンチオン(346
)+TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)およびストリキニーネ(74
 5)+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)+T
 X、ニオクタン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、水酸化銅(IUPAC名)(1
 69)+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)+T
 X、ニッケルピス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308)+TX
 、ニトラピリン(580)+TX、オクチリノン(590)+TX、オキシリン酸(60

10

20

30

40

50

6) + 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、アムブリセイウス属(*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、パチルスフィルムス(*Bacillus firmus*)(代替名)(48) + TX、パチルススファエリクスネイデ(*Bacillus sphaericus Neide*)(学名)(49) + TX、パ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、パ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、パ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、パ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、パ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、パ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*)(学名)(51) + TX、ボーベリアバシアナ(*Beauveria bassiana*)(代替名)(53) + TX、ボ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、コドリングア(*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. a*

10

20

30

40

50

nisopliae) (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プサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラビス (*Steinernema 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ス (*Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens*) 菌株 FZB24 (Novozymes Biologicals Inc. (5400 Corporate Circle, Salem, VA 24153, U.S.A.) から入手可能、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壤滅菌剤、

アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘンパ (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、フロントリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシッブルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (589) + TX、オルラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクトルア (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) + TX、トリメドルア C (代替名) (839) およびトランクコール (代替名) [CCN] + TX から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、プトピロノキシル (933) + TX、プトキシ (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 - ジクロロプロパン (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 - プトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (935)

+ TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチルカルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1084) + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ) エタノール (IUPAC 名) (986) + TX、2 - クロロビニルジエチルホスフェート (IUPAC 名) (984) + TX、2 - イミダゾリドン (IUPAC 名) (1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC 名) (1246) + TX、2 - メチル (プロパ - 2 - イニル) アミノフェニルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1284) + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート (IUPAC 名) (1433) + TX、3 - ブロモ - 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 - 10
イニル) アミノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1285) + TX、5, 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート (IUPAC 名) (1085) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセフェート (2) + TX、アセタミプリド (4) + TX、アセチオン (代替名) [CCN] + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アクリロニトリル (IUPAC 名) (861) + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、アルドリン (864) + TX、アレトリン (17) + TX、アロサミジン (代替名) [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、
- シベルメトリン (202) + TX、- エクジソン (代替名) [CCN] + TX、リン
20
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
30
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、
40
ベンスルタップ (66) + TX、- シフルトリン (194) + TX、- シベルメトリン (203) + TX、ピフェントリン (76) + TX、ピオアレトリン (78) + TX、ピオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (代替名) (79) + TX、ピオエタノメトリン [CCN] + TX、ピオベルメトリン (908) + TX、ピオレスメトリン (80) + TX、ビス (2 - クロロエチル) エーテル (IUPAC 名) (909) + TX、ピストリフルロン (83) + TX、ハウ砂 (86) + TX、プロフェンバレレート (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、ブプロフェジン (99) + TX、
40
ブタカルブ (926) + TX、ブタチオホス (927) + TX、プトカルボキシム (103) + TX、プトネート (932) + TX、プトキシカルボキシム (104) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、多硫化カルシウム (IUPAC 名) (111) + TX、カンフェクロル (941) + TX、カーバノレート (943) + TX、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (945) + TX、四塩化炭素 (IUPAC 名) (946) + TX、カルボフェノチオン (947) + TX、カルボスルファン (119) + TX、カルタップ (123) + TX、カルタップ塩酸塩 (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) +
50

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、クロルフエナビル(130)+TX、クロルフエンピンホス(131)+TX、クロルフルアズロン(132)+TX、クロルメホス(136)+TX、クロロホルム[CCN]+TX、クロロピクリン(141)+TX、クロルホキシム(989)+TX、クロルブラゾホス(990)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホス-メチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、クロマフェノジド(150)+TX、シネリンI(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリン(696)+TX、シス-レスメトリン(代替名)+TX、シスメトリン(80)+TX、クロシトリン(代替名)+TX、クロエトカルブ(999)+TX、クロサンテル(代替名)[CCN]+TX、クロチアニジン(165)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、ヒ酸銅[CCN]+TX、オレイン酸銅[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クミトエート(1006)+TX、クロタミトン(代替名)[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クルホメート(1011)+TX、氷晶石(代替名)(177)+TX、CS708(開発コード)(1012)+TX、シアノフェンホス(1019)+TX、シアノホス(184)+TX、シアントエート(1020)+TX、シクレトリン[CCN]+TX、シクロプロトリン(188)+TX、シフルトリン(193)+TX、シハロトリン(196)+TX、シペルメトリン(201)+TX、シフェノトリン(206)+TX、シロマジン(209)+TX、サイチオアート(代替名)[CCN]+TX、d-リモネン(代替名)[CCN]+TX、d-テトラメトリン(代替名)(788)+TX、DAEP(1031)+TX、ダゾメット(216)+TX、DDT(219)+TX、デカルボフラン(1034)+TX、デルタメトリン(223)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン-O(1037)+TX、デメフィオン-S(1037)+TX、デメトン(1038)+TX、デメトン-メチル(224)+TX、デメトン-O(1038)+TX、デメトン-O-メチル(224)+TX、デメトン-S(1038)+TX、デメトン-S-メチル(224)+TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039)+TX、ジアフェンチウロン(226)+TX、ジアリホス(1042)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ダイアジノン(227)+TX、ジカプトン(1050)+TX、ジクロフェンチオン(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)(1076)+TX、ジフルベンズロン(250)+TX、ジロール(代替名)[CCN]+TX、ジメフルトリン[CCN]+TX、ジメホックス(1081)+TX、ジメタン(1085)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジメトリン(1083)+TX、ジメチルピンホス(265)+TX、ジメチラン(1086)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクスジクレキシシ(1089)+TX、ジノプロブ(1093)+TX、ジノサム(1094)+TX、ジノセブ(1095)+TX、ジノテフラン(271)+TX、ジオフェノラン(1099)+TX、ジオキサベンゾホス(1100)+TX、ジオキサカルブ(1101)+TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジスルホトン(278)+TX、ジチクロホス(1108)+TX、DNOC(282)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、エクジステロン(代替名)[CCN]+TX、EI1642(開発コード)(1118)+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、EMPC(1120)+TX、エンベントリン(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(

10

20

30

40

50

312) + TX、ギ酸エチル (IUPAC名) [CCN] + TX、エチル - DDD (代替名) (1056) + TX、二臭化エチレン (316) + TX、二塩化エチレン (化学名) (1136) + TX、エチレンオキシド [CCN] + TX、エトフェンブロックス (319) + TX、エトリムホス (1142) + TX、EXD (1143) + TX、ファンファー (323) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェナザフロル (1147) + TX、フェンクロルホス (1148) + TX、フェネタカルブ (1149) + TX、フェンフルトリン (1150) + TX、フェニトロチオン (335) + TX、フェノブカルブ (336) + TX、フェノキサクリム (1153) + TX、フェノキシカルブ (340) + TX、フェンピリトリン (1155) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、フェンチオン (346) + TX、フェンチオン - エチル [CCN] + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィブロンル (354) + TX、フロニカミド (358) + TX、フルベンジアミド (CAS登録番号: 272451-65-7) + TX、フルコフロン (1168) + TX、フルシクロクスロン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネチル (1169) + TX、フルフェネリム [CCN] + TX、フルフェノクスロン (370) + TX、フルフェンブロックス (1171) + TX、フルメトリン (372) + TX、フルバリネート (1184) + TX、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 (1193) + TX、ホスメチラン (1194) + TX、ホスピレート (1195) + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、フラチオカルブ (412) + TX、フレトリン (1200) + TX、
 - シハロトリン (197) + TX、
 - HCH (430) + TX、グアザチン (422) + TX、グアザチン酢酸塩 (422) + TX、GY - 81 (開発コード) (423) + TX、ハルフェンブロックス (424) + TX、ハロフェノジド (425) + TX、HCH (430) + TX、HEOD (1070) + TX、ヘプタクロル (1211) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヘキサフルムロン (439) + TX、HHDN (864) + TX、ヒドラメチルノン (443) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ハイドロブレ (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 (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 (12

10

20

30

40

50

66) + 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、メトプレ(532) + TX、メトキン - ブチル(1276) + TX、メトト
 リン(代替名)(533) + TX、メトキシクロル(534) + TX、メトキシフェノジ
 ド(535) + TX、臭化メチル(537) + TX、メチルイソチオシアネート(543)
) + TX、メチルククロホルム(代替名)[CCN] + TX、塩化メチレン[CCN] +
 TX、メトフルトリン[CCN] + TX、メトルカルブ(550) + TX、メトキサジア
 ゾン(1288) + TX、メピンホス(556) + TX、メキサカルベート(1290)
 + TX、ミルベメクチン(557) + TX、ミルマイシンオキシム(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 - 1
 70(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(1
 313) + TX、ニトリラカルブ1 : 1塩化亜鉛錯体(1313) + TX、NNI - 01
 01(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、ノピフルムロン(586
) + TX、O - 5 - ジクロロ - 4 - ヨードフェニルO - エチルエチルホスホチオエート
 (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)(59
 3) + TX、オメトエート(594) + TX、オキサミル(602) + TX、オキシデメ
 トンメチル(609) + TX、オキシデプロホス(1324) + TX、オキシジスルホト
 ン(1325) + TX、pp' - DDT(219) + TX、パラ - ジクロロベンゼン[CC
 CN] + 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(62
 6) + TX、石油(代替名)(628) + TX、PH 60 - 38(開発コード)(13
 28) + 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(133
 9) + 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I
 I(代替名)[CCN] + TX、プレコセンIII(代替名)[CCN] + TX、プリミ
 ドホス(1349) + TX、プロフェノホス(662) + TX、プロフルトリン[CCN
] + TX、プロマシル(1354) + TX、プロメカルブ(1355) + TX、プロパホ
 ス(1356) + TX、プロペタンホス(673) + TX、プロボクサー(678) + T
 X、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

10

20

30

40

50

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、S
 I-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 7212
 9(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(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(141
 7)+TX、テラレトリン(1418)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス
 (773)+TX、テトラクロロエタン [CCN]+TX、テトラクロルピンホス(77
 7)+TX、テトラメトリン(787)+TX、-シペルメトリン(204)+TX、
 チアクロブリド(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)+T
 X、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、チオファノックス(800)+TX、チオメトン(801)
 +TX、チオナジン(1434)+TX、チオスルタップ(803)+TX、チオスルタ
 ップ-ナトリウム(803)+TX、ツリングエンシン(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、トランスベルメトリン(1440)+TX、トリアミホス(144
 1)+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(1
 455)+TX、トリフルムロン(835)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、
 トリブレン(1459)+TX、パミドチオン(847)+TX、バニリブロール [CC
 N]+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 890
 1(開発コード)(858)+TX、シアントラニリブロール [736994-63-1
 9]+TX、クロラントラニリブロール [500008-45-7]+TX、シエノピラフ
 エン [560121-52-0]+TX、シフルメトフェン [400882-07-7]

10

20

30

40

50

+ T X、ピリフルキナゾン [3 3 7 4 5 8 - 2 7 - 2] + T X、スピネトラム [1 8 7 1 6 6 - 4 0 - 1 + 1 8 7 1 6 6 - 1 5 - 0] + T X、スピロテトラマト [2 0 3 3 1 3 - 2 5 - 1] + T X、スルホキサフロール [9 4 6 5 7 8 - 0 0 - 3] + T X、フルフィプロール [7 0 4 8 8 6 - 1 8 - 0] + T X、メベルフルトリン [9 1 5 2 8 8 - 1 3 - 0] + T X、テトラメチルフルトリン [8 4 9 3 7 - 8 8 - 2] + T X、トリフルメゾピリム (国際公開第 2 0 1 2 / 0 9 2 1 1 5 号に開示されている) + T X 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 (I U P A C 名) (9 1 3) + T X、プロモアセトアミド [C C N] + T X、ヒ酸カルシウム [C C N] + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、アセト亜ヒ酸銅 [C C N] + T X、硫酸銅 (1 7 2) + T X、フェンチン (3 4 7) + T X、リン酸第二鉄 (I U P A C 名) (3 5 2) + T X、メタアルデヒド (5 1 8) + T X、メチオカルブ (5 3 0) + T X、ニクロスアミド (5 7 6) + T X、ニクロスアミドオラミン (5 7 6) + T X、ペンタクロロフェノール (6 2 3) + T X、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (6 2 3) + T X、タジムカルブ (1 4 1 2) + T X、チオジカルブ (7 9 9) + T X、酸化トリブチルスズ (9 1 3) + T X、トリフェンモルフ (1 4 5 4) + T X、トリメタカルブ (8 4 0) + T X、酢酸トリフェニルスズ (I U P A C 名) (3 4 7) および水酸化トリフェニルスズ (I U P A C 名) (3 4 7) + T X、ピリプロール [3 9 4 7 3 0 - 7 1 - 3] + T X からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、

A K D - 3 0 8 8 (化合物コード) + T X、1, 2 - ジブromo - 3 - クロロプロパン (I U P A C / ケミカルアブストラクツ名) (1 0 4 5) + T X、1, 2 - ジクロロプロパン (I U P A C / ケミカルアブストラクツ名) (1 0 6 2) + T X、1, 2 - ジクロロプロパンを伴う 1, 3 - ジクロロプロペン (I U P A C 名) (1 0 6 3) + T X、1, 3 - ジクロロプロペン (2 3 3) + T X、3, 4 - ジクロロテトラヒドロチオフェン 1, 1 - ジオキシド (I U P A C / ケミカルアブストラクツ名) (1 0 6 5) + T X、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルローダニン (I U P A C 名) (9 8 0) + T X、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1, 3, 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢酸 (I U P A C 名) (1 2 8 6) + T X、6 - イソペンテニルアミノプリン (代替名) (2 1 0) + T X、アバメクチン (1) + T X、アセトプロール [C C N] + T X、アラニカルブ (1 5) + T X、アルジカルブ (1 6) + T X、アルドキシカルブ (8 6 3) + T X、A Z 6 0 5 4 1 (化合物コード) + T X、ベンクロチアズ [C C N] + T X、ベノミル (6 2) + T X、ブチルピリダベン (代替名) + T X、カズサホス (1 0 9) + T X、カルボフラン (1 1 8) + T X、二硫化炭素 (9 4 5) + T X、カルボスルファン (1 1 9) + T X、クロロピクリン (1 4 1) + T X、クロルピリホス (1 4 5) + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、サイトカイニン (代替名) (2 1 0) + T X、ダゾメット (2 1 6) + T X、D B C P (1 0 4 5) + T X、D C I P (2 1 8) + T X、ジアミダホス (1 0 4 4) + T X、ジクロフェンチオン (1 0 5 1) + T X、ジクリホス (代替名) + T X、ジメトエート (2 6 2) + T X、ドラメクチン (代替名) [C C N] + T X、エマメクチン (2 9 1) + T X、エマメクチン安息香酸塩 (2 9 1) + T X、エプリノメクチン (代替名) [C C N] + T X、エトプロホス (3 1 2) + T X、二臭化エチレン (3 1 6) + T X、フェナミホス (3 2 6) + T X、フェンピラド (代替名) + T X、フェンスルホチオン (1 1 5 8) + T X、ホスチアゼート (4 0 8) + T X、ホスチエタン (1 1 9 6) + T X、フルフラール (代替名) [C C N] + T X、G Y - 8 1 (開発コード) (4 2 3) + T X、ヘテロホス [C C N] + T X、ヨードメタン (I U P A C 名) (5 4 2) + T X、イサミドホス (1 2 3 0) + T X、イサゾホス (1 2 3 1) + T X、イベルメクチン (代替名) [C C N] + T X、キネチン (代替名) (2 1 0) + T X、メカルフォン (1 2 5 8) + T X、メタム (5 1 9) + T X、メタムカリウム (代替名) (5 1 9) + T X、メタムナトリウム (5 1 9) + T X、臭化メチル (5 3 7) + T X、メチルイソチオシアネート (5 4 3) + T X、ミルベマイシンオキシム (代替名) [C C N] + T X、モキシデクチン (代替名) [C C N] + T X、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucari*

10

20

30

40

50

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)[CCN]+TX、スピノサド(737)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス(773)+TX、テトラクロロチオフェン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1422)+TX、チアフェノックス(代替名)+TX、チオナジン(1434)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、キシレノルス[CCN]+TX、YI-5302(化合物コード)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、

ビスチオセミ(912)+TX、プロディファコウム(89)+TX、プロマジオロン(91)+TX、プロメタリン(92)+TX、シアン化カルシウム(444)+TX、クロラロース(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(1005)+TX、クマテトラリル(175)+TX、クリミジン(1009)+TX、ジフェナコウム(246)+TX、ジフェチアロン(249)+TX、ジファシノン(273)+TX、

エルゴカルシフェロール(301)+TX、フロクマフェン(357)+TX、フルオロアセトアミド(379)+TX、フルプロバジン(1183)+TX、フルプロバジン塩酸塩(1183)+TX、-HCH(430)+TX、HCH(430)+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-プトキシエトキシ)エチルピペロニレート(IUPAC名)(934)+TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903)+TX、

ファルネソールを伴うネロリドール(代替名)(324)+TX、MB-599(開発コード)(498)+TX、MGK 264(開発コード)(296)+TX、ピペロニルプトキシド(649)+TX、ピプロタル(1343)+TX、

プロピル異性体(1358)+TX、S421(開発コード)(724)+TX、セサメックス(1393)+TX、セサモリン(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、

アントラキノン(32)+TX、クロラロース(127)+TX、ナフテン酸銅[CCN]+TX、オキシ塩化銅(171)+TX、ダイアジノン(227)+TX、ジシクロペントジエン(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、

10

20

30

40

50

ナフテン酸亜鉛 [C C N] およびジラム (8 5 6) + T X 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) [C C N] およびリバピリン (代替名) [C C N] + T X 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 (5 1 2) + T X、オクチリノン (5 9 0) およびチオファネート - メチル (8 0 2) + T X 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 [8 6 5 3 1 8 - 9 7 - 4] + T X、アミスルプロム [3 4 8 6 3 5 - 8 7 - 0] + T X、アザコナゾール [6 0 2 0 7 - 3 1 - 0] + T X、ベンゾ
 ピンジフルピル [1 0 7 2 9 5 7 - 7 1 - 1] + T X、ピテルタノール [7 0 5 8 5 - 3 6 - 3] + T X、ピキサフェン [5 8 1 8 0 9 - 4 6 - 3] + T X、プロムコナゾール [1 1 6 2 5 5 - 4 8 - 2] + T X、クモキシストロピン [8 5 0 8 8 1 - 7 0 - 8] + T X、シプロコナゾール [9 4 3 6 1 - 0 6 - 5] + T X、ジフェノコナゾール [1 1 9 4 4 6 - 6 8 - 3] + T X、ジニコナゾール [8 3 6 5 7 - 2 4 - 3] + T X、エノキサストロピン [2 3 8 4 1 0 - 1 1 - 2] + T X、エポキシコナゾール [1 0 6 3 2 5 - 0 8 - 0] + T X、フェンブコナゾール [1 1 4 3 6 9 - 4 3 - 6] + T X、フェンピラザミン [4 7 3 7 9 8 - 5 9 - 3] + T X、フルキンコナゾール [1 3 6 4 2 6 - 5 4 - 5] + T X、フルシラゾール [8 5 5 0 9 - 1 9 - 9] + T X、フルトリアホール [7 6 6 7 4 - 2 1 - 0] + T X、フルキサピロキサド [9 0 7 2 0 4 - 3 1 - 3] + T X、フルオピラム [6 5 8 0 6 6 - 3 5 - 4] + T X、フェナミンストロピン [3 6 6 8 1 5 - 3 9 - 6] + T X、イソフェタミド [8 7 5 9 1 5 - 7 8 - 9] + T X、ヘキサコナゾール [7 9 9 8 3 - 7 1 - 4] + T X、イマザリル [3 5 5 5 4 - 4 4 - 0] + T X、イミベンコナゾール [8 6 5 9 8 - 9 2 - 7] + T X、イブコナゾール [1 2 5 2 2 5 - 2 8 - 7] + T X、イブフェントリフルコナゾール [1 4 1 7 7 8 2 - 0 8 - 1] + T X、イソチアニル [2 2 4 0 4 9 - 0 4 - 1] + T X、マンデストロピン [1 7 3 6 6 2 - 9 7 - 0] (国際公開第 2 0 1 0 / 0 9 3 0 5 9 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + T X、メフェントリフルコナゾール [1 4 1 7 7 8 2 - 0 3 - 6] + T X、メトコナゾール [1 2 5 1 1 6 - 2 3 - 6] + T X、マイクロブタニル [8 8 6 7 1 - 8 9 - 0] + T X、パクロブトラゾール [7 6 7 3 8 - 6 2 - 0] + T X、ペフラゾエート [1 0 1 9 0 3 - 3 0 - 4] + T X、ペンフルフェン [4 9 4 7 9 3 - 6 7 - 8] + T X、ペンコナゾール [6 6 2 4 6 - 8 8 - 6] + T X、プロチオコナゾール [1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6] + T X、ピリフェノックス [8 8 2 8 3 - 4 1 - 4] + T X、プロクロラズ [6 7 7 4 7 - 0 9 - 5] + T X、プロピコナゾール [6 0 2 0 7 - 9 0 - 1] + T X、シメコナゾール [1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7] + T X、テブコナゾール [1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3] + T X、テトラコナゾール [1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3] + T X、トリアジメホン [4 3 1 2 1 - 4 3 - 3] + T X、トリアジメノール [5 5 2 1 9 - 6 5 - 3] + T X、トリフルミゾール [9 9 3 8 7 - 8 9 - 0] + T X、トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7] + T X、アンシミドール [1 2 7 7 1 - 6 8 - 5] + T X、フェナリモル [6 0 1 6 8 - 8 8 - 9] + T X、ヌアリモル [6 3 2 8 4 - 7 1 - 9] + T X、ブピリメート [4 1 4 8 3 - 4 3 - 6] + T X、ジメチリモール [5 2 2 1 - 5 3 - 4] + T X、エチリモール [2 3 9 4 7 - 6 0 - 6] + T X、ドデモルフ [1 5 9 3 - 7 7 - 7] + T X、フェンブプロピジン [6 7 3 0 6 - 0 0 - 7] + T X、フェンブプロピモルフ [6 7 5 6 4 - 9 1 - 4] + T X、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8] + T X、トリデモルフ [8 1 4 1 2 - 4 3 - 3] + T X、シプロジニル [1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2] + T X、メバニピリム [1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7] + T X、ピリメタニル [5 3 1 1 2 - 2 8 - 0] + T X、フェンピクロニル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + T X、フルジオキシソニル [1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1] + T X、フルインダピル (f l u i n d a p y r) [1 3 8 3 8 0 9 - 8 7 - 7] + T X、ベナラキシル [7 1 6 2 6 - 1 1 - 4] + T X、フララキシル [5 7 6 4 6 - 3 0 - 7] + T X、メタラキシル [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + T X、R - メタラキシル [7 0 6 3 0 - 1 7 - 0] + T X、オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + T X、オキサジキシル [7 7 7 3 2 - 0 9 - 3] + T X、ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2] + T X、カルベン

ダジム [1 0 6 0 5 - 2 1 - 7] + T X、デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9 1 - 6] + T X、
 フベリダゾール [3 8 7 8 - 1 9 - 1] + T X、チアベンダゾール [1 4 8 - 7 9 - 8]
 + T X、クロゾリネート [8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + T X、ジクロゾリン [2 4 2 0 1 -
 5 8 - 9] + T X、イプロジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + T X、ミクロゾリン [5 4
 8 6 4 - 6 1 - 8] + T X、プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8] + T X、ピンクロゾ
 リン [5 0 4 7 1 - 4 4 - 8] + T X、ボスカリド [1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6] + T X、
 カルボキシシン [5 2 3 4 - 6 8 - 4] + T X、フェンフラム [2 4 6 9 1 - 8 0 - 3] +
 T X、フルトラニル [6 6 3 3 2 - 9 6 - 5] + T X、フルチアニル [9 5 8 6 4 7 - 1
 0 - 4] + T X、メプロニル [5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + T X、オキシカルボキシシン [5
 2 5 9 - 8 8 - 1] + T X、ペンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + T X、チフル 10
 ザミド [1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7] + T X、グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + T
 X、ドジン [2 4 3 9 - 1 0 - 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] (遊離塩基) + T X、イミノク
 タジン [1 3 5 1 6 - 2 7 - 3] + T X、アゾキシストロピン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8
] + T X、ジモキシストロピン [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + T X、エネステロプリン {
 Proc . B C P C , Int . Congr . , Glasg ow , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } +
 T X、フルオキサストロピン [3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9] + T X、クレソキシム - メチル
 [1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0] + T X、メトミノストロピン [1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1] +
 T X、トリフロキシストロピン [1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7] + T X、オリザストロピン [2
 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0] + T X、ピコキシストロピン [1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5] + T
 X、ピラクロストロピン [1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0] + T X、ピラオキシストロピン [8 20
 6 2 5 8 8 - 1 1 - 2] + T X、フェルバム [1 4 4 8 4 - 6 4 - 1] + T X、マンコゼ
 ブ [8 0 1 8 - 0 1 - 7] + T X、マネブ [1 2 4 2 7 - 3 8 - 2] + T X、メチラム [9
 0 0 6 - 4 2 - 2] + T X、プロピネブ [1 2 0 7 1 - 8 3 - 9] + T X、チラム [1
 3 7 - 2 6 - 8] + T X、ジネブ [1 2 1 2 2 - 6 7 - 7] + T X、ジラム [1 3 7 - 3
 0 - 4] + T X、カプタホール [2 4 2 5 - 0 6 - 1] + T X、キャプタン [1 3 3 - 0
 6 - 2] + T X、ジクロフルアニド [1 0 8 5 - 9 8 - 9] + T X、フルオロイミド [4
 1 2 0 5 - 2 1 - 4] + T X、ホルペット [1 3 3 - 0 7 - 3] + T X、トリルフルアニ
 ド [7 3 1 - 2 7 - 1] + T X、ボルドー液 [8 0 1 1 - 6 3 - 0] + T X、水酸化銅 [2
 0 4 2 7 - 5 9 - 2] + T X、オキシ塩化銅 [1 3 3 2 - 4 0 - 7] + T X、硫酸銅 [7
 7 5 8 - 9 8 - 7] + T X、酸化銅 [1 3 1 7 - 3 9 - 1] + T X、マンカップー [5 30
 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + T X、オキシシン銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6] + T X、ジノカップ
 [1 3 1 - 7 2 - 6] + T X、ニトロタール - イソプロピル [1 0 5 5 2 - 7 4 - 6] +
 T X、エディフェンホス [1 7 1 0 9 - 4 9 - 8] + T X、イプロベンホス [2 6 0 8 7
 - 4 7 - 8] + T X、イソプロチオラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1] + T X、ホスジフェン
 [3 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + T X、ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8 - 6] + T X、トルク
 ロホス - メチル [5 7 0 1 8 - 0 4 - 9] + T X、アシベンゾラル - S - メチル [1 3 5
 1 5 8 - 5 4 - 2] + T X、アニラジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + T X、ベンチアバリカル
 ブ [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + T X、プラストサイジン - S [2 0 7 9 - 0 0 - 7] +
 T X、チノメチオナート [2 4 3 9 - 0 1 - 2] + T X、クロロネブ [2 6 7 5 - 7 7 -
 6] + T X、クロロタロニル [1 8 9 7 - 4 5 - 6] + T X、シフルフェナミド [1 8 0 40
 4 0 9 - 6 0 - 3] + T X、シモキサニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7] + T X、ジクロン [1
 1 7 - 8 0 - 6] + T X、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4] + T X、ジクロ
 メジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + T X、ジクロラン [9 9 - 3 0 - 9] + T X、ジエト
 フェンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9] + T X、ジメトモルフ [1 1 0 4 8 8 - 7 0 - 5
] + T X、S Y P - L I 9 0 (フルモルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9] + T X、ジチア
 ノン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + T X、エタボキサム [1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3] + T X、
 エトリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5 - 9] + T X、ファモキサドン [1 3 1 8 0 7 - 5 7
 - 3] + T X、フェンアミドン [1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7] + T X、フェノキサニル [1
 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + T X、フェンチン [6 6 8 - 3 4 - 8] + T X、フェリムゾン
 [8 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + T X、フルアジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 - 6] + T X、フル 50

オピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7] + T X、フルスルファミド [1 0 6 9 1 7 - 5 2
 - 6] + T X、フェンヘキサミド [1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + T X、ホセチル - アルミ
 ニウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] + T X、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4 - 4 4 - 1] + T
 X、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2 3 - 1 7 - 7] + T X、I K F - 9 1 6 (シアゾファ
 ミド) [1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3] + T X、カスガマイシン [6 9 8 0 - 1 8 - 3] + T
 X、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2 - 4 9 - 6] + T X、メトラフェノン [2 2 0 8 9 9
 - 0 3 - 6] + T X、ペンシクロン [6 6 0 6 3 - 0 5 - 6] + T X、フタリド [2 7 3
 5 5 - 2 2 - 2] + T X、ピカルブトラゾクス [5 0 0 2 0 7 - 0 4 - 5] + T X、ポリ
 オキシシン [1 1 1 1 3 - 8 0 - 7] + T X、プロベナゾール [2 7 6 0 5 - 7 6 - 1] +
 T X、プロパモカルブ [2 5 6 0 6 - 4 1 - 1] + T X、プロキナジド [1 8 9 2 7 8 -
 1 2 - 4] + T X、ピジフルメトフェン [1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7] + T X、ピラメト
 ストロピン [9 1 5 4 1 0 - 7 0 - 7] + T X、ピロキロン [5 7 3 6 9 - 3 2 - 1] +
 T X、ピリオフェノン [6 8 8 0 4 6 - 6 1 - 9] + T X、ピリベンカルブ [7 9 9 2 4
 7 - 5 2 - 2] + T X、ピリソキサゾール (p y r i s o x a z o l e) [8 4 7 7 4 9
 - 3 7 - 5] + T X、キノキシフェン [1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7] + T X、キントゼン [
 8 2 - 6 8 - 8] + T X、硫黄 [7 7 0 4 - 3 4 - 9] + T X、T i m o r e x G o l d
 (商標) (S t o c k t o n G r o u p 製のティーツリー油を含有する植物抽出物)
 + T X、テブフロキン [3 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2] + T X、チアジニル [2 2 3 5 8 0 -
 5 1 - 6] + T X、トリアゾキシド [7 2 4 5 9 - 5 8 - 6] + T X、トルプロカルブ [
 9 1 1 4 9 9 - 6 2 - 2] + T X、トリクロピリカルブ [9 0 2 7 6 0 - 4 0 - 1] + T
 X、トリシクラゾール [4 1 8 1 4 - 7 8 - 2] + T X、トリホリン [2 6 6 4 4 - 4 6
 - 2] + T X、バリダマイシン [3 7 2 4 8 - 4 7 - 8] + T X、バリフェナレート [2
 8 3 1 5 9 - 9 0 - 0] + T X、ゾキサミド (R H 7 2 8 1) [1 5 6 0 5 2 - 6 8 - 5
] + T X、マンジプロパミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + T X、イソピラザム [8 8 1
 6 8 5 - 5 8 - 1] + T X、フェナマクリル (p h e n a m a c r i l) + T X、セダキ
 サン [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6] + T X、トリネキサバック - エチル [9 5 2 6 6 - 4 0
 - 3] + T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸
 (9 - ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン
 - 5 - イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 7 / 0 4 8 5 5 6 号に開示されている) + T X
 、 3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3 ' , 4 '
 , 5 ' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 6 / 0 8 7
 3 4 3 号に開示されている) + T X、 [(3 S , 4 R , 4 a R , 6 S , 6 a S , 1 2 R ,
 1 2 a S , 1 2 b S) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル) オキシ] - 1 , 3 , 4 , 4
 a , 5 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1 2 b - デカヒドロ - 6 , 1 2 - ジヒドロキシ - 4 ,
 6 a , 1 2 b - トリメチル - 1 1 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2 H , 1 1 H ナフ
 ト [2 , 1 - b] ピラノ [3 , 4 - e] ピラン - 4 - イル] メチル - シクロプロパンカル
 ボキシレート [9 1 5 9 7 2 - 1 7 - 7] + T X および 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (2 -
 メチル - 1 - オキソプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [2 , 2
 , 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] -
 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8] + T X からなる群か
 ら選択される生物学的に有効な化合物、
 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 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号に記載の手順にしたがって調製され得る)
 + T X、2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジチイノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c
 '] ジピロール - 1 , 3 , 5 , 7 (2 H , 6 H) - テトロソ (国際公開第 2 0 1 1 / 1 3
 8 2 8 1 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + T X、6 - エチル - 5 , 7 - ジオ
 キソ - ピロロ [4 , 5] [1 , 4] ジチイノ [1 , 2 - c] イソチアゾール - 3 - カルボ
 ニトリル + T X、4 - (2 - 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 2 0

10

20

30

40

50

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 - ジオキシド (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 / 081174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 + 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 - (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 / 02

10

20

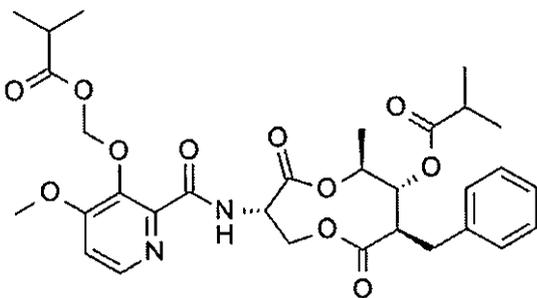
30

40

50

4082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) - 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8】



(フェンピコキサミド [517875 - 34 - 2]) + TX (国際公開第2003 / 035617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 - [(3R) - 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)

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 + T X、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 + T X (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 2 6 】

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。

10

20

【 0 1 2 7 】

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。

30

【 0 1 2 8 】

表 1 . 1 ~ 1 . 1 2 (以下) に記載の化合物または表 T 1 (以下) に記載の化合物 1 . 1 ~ 1 . 2 1 から選択される 1 種の化合物から選択される式 (I) の化合物の有効成分混合物は、1 0 0 : 1 ~ 1 : 6 0 0 0、特に 5 0 : 1 ~ 1 : 5 0 の混合比、特に 2 0 : 1 ~ 1 : 2 0、特に 1 0 : 1 ~ 1 : 1 0、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 : 6 0 0 または 1 : 3 0 0 または 1 : 1 5 0 または 1 : 3 5 または 2 : 3 5 または 4 : 3 5 または 1 : 7 5 または 2 : 7 5 または 4 : 7 5 または 1 : 6 0 0 0 または 1 : 3 0 0 0 または 1 : 1 5 0 0 または 1 : 3 5 0 または 2 : 3 5 0 または 4 : 3 5 0 または 1 : 7 5 0 または 2 : 7 5 0 または 4 : 7 5 0 の比である。これらの混合比は重量基準である。

40

【 0 1 2 9 】

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。

50

【0130】

表1.1~1.12(以下)に記載の化合物または表T1(以下)に記載の化合物1.1~1.21から選択される化合物と、上記に記載の1種以上の有効成分を含む混合物は、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1.1~1.12(以下)に記載の化合物または表T1(以下)に記載の化合物1.1~1.21から選択される化合物と、上記に記載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。

【0131】

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・殺力ビ剤、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。

【0132】

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化合物の使用も本発明の主題である。

【0133】

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・殺力ビもしくは殺虫性混合物であって、上記の他の殺菌・殺力ビ剤もしくは殺虫剤を伴う混合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。

【0134】

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

【0135】

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。

【0136】

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

10

20

30

40

50

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。

【0137】

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。

10

【0138】

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。

【0139】

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。

20

【0140】

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。

【0141】

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）、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。

30

【0142】

このような組成物は、従来様式で、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、従来緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合に採用され得る。特に、水分散性濃縮物（例えばEC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等）、水和剤および顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例えばホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート、およびエトキシ化アルキルフェノールおよびエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤および分散剤およびアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有していてもよい。

40

【0143】

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

50

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。

【0144】

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。

10

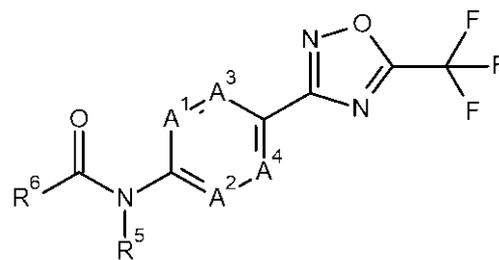
【0145】

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。

【0146】

表1.1: この表は式(T-1)の60種の特定の化合物を開示するものであり:

【化9】



(T-1)

20

ここで、 A^1 はC-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²、R⁴およびR⁵は水素であり、R³はフッ素であり、ならびに、R⁶は、表1中において以下に定義されているとおりである。

【0147】

表1.2～1.12(表1に続く)の各々によって式(T-1)の60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 、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵およびR⁶は、表1.2～1.12(R⁶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。

30

【0148】

表1

【表 1】

化合物 No.	R ⁶	化合物 No.	R ⁶
1.001	(1,2,4-トリアゾール-1-イル)メチル	1.031	2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル
1.002	(2-フルオロフェニル)メチル	1.032	2,2-ジメチルシクロプロピル
1.003	(2-チエニル)メチル	1.033	2-クロロフェニル
1.004	(3,3-ジフルオロシクロブチル)メチル	1.034	2-フルオロシクロプロピル
1.005	(3,4,5-トリメトキシフェニル)エチル	1.035	2-メチルシクロプロピル
1.006	2-(3,5-ジクロロ-2-ピリジル)-プロプ-2-イル	1.036	1-フェニルエチル
1.007	(3,5-ジフルオロフェニル)メチル	1.037	3,4,5-トリメトキシフェニル
1.008	(3-ピリジル)エチル	1.038	3,4-ジメトキシフェニル
1.009	(3-ピリジル)メチル	1.039	3-メトキシ-5-オキソシクロヘキセン-3-イル
1.010	(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)メチル	1.040	3-メチルオキセタン-3-イル
1.011	(4-メトキシフェニル)メチル	1.041	3-オキソ-シクロブチル
1.012	(4-ピリジル)エチル	1.042	シクロブチル
1.013	(5-メチルピラゾール-1-イル)メチル	1.043	シクロペンテン-3-イル
1.014	(ピラゾール-1-イル)メチル	1.044	シクロペンテン-1-イル
1.015	[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル	1.045	シクロペンチル
1.016	[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]メチル	1.046	シクロプロピル
1.017	[6-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]メチル	1.047	シクロプロピルメチル
1.018	[6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]メチル	1.048	フェニル
1.019	1,3-ジオキサラン-2-イル	1.049	(4-フルオロフェニル)メチル
1.020	1-シアノシクロプロピル	1.050	フェニルスルファニルメチル
1.021	1-フルオロシクロプロピル	1.051	テトラヒドロフラン-2-イル
1.022	1H-ピラゾール-4-イル	1.052	テトラヒドロフラン-3-イル
1.023	1-メチルシクロプロピル	1.053	テトラヒドロピラン-2-イル
1.024	1-フェノキシエチル	1.054	テトラヒドロチオピラン-4-イル
1.025	2-(1-ピペリジル)エチル	1.055	2,3-ジフルオロシクロプロピル

10

20

30

40

1.026	2-(メトキシメチル)-4-メチル- チアゾール-5-イル	1.056	4-メトキシ-N-ピペラジン-1-イ ル
1.027	2-(トリフルオロメチル)フェニ ル	1.057	N-オキサジナン-2-イル
1.028	2,2-ジフルオロシクロプロピル	1.058	N-ピペラジン-1-イル
1.029	2,2-ジクロロシクロプロピル	1.059	N-モルホリン-1-イル
1.030	2,2-ジブromoシクロプロピル	1.060	N-ピロリジン-1-イル

【0149】

10

表1.2: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²およびR⁴は水素であり、R³はフッ素であり、R⁵はメチルであり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0150】

表1.3: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²およびR⁴は水素であり、R³はフッ素であり、R⁵はエチルであり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0151】

20

表1.4: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²およびR⁴は水素であり、R³はフッ素であり、R⁵はメトキシであり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0152】

表1.5: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R²、R⁴およびR⁵は水素であり、R¹およびR³およびフッ素であり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0153】

30

表1.6: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R²およびR⁴は水素であり、R¹およびR³およびフッ素であり、R⁵はメチルであり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0154】

表1.7: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R²、R³、R⁴およびR⁵は水素であり、R¹はフッ素であり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0155】

40

表1.8: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R²、R³、R⁴およびR⁵は水素であり、R¹は塩素であり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0156】

表1.9: この表は式(T-1)の60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-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、R²、R³、R⁴およびR⁵は水素であり、R¹はメチルであり、ならびに、R⁶は表1において上記に定義されているとおりである。

【0157】

50

表 1.10 : この表は式 (T - 1) の 60 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 および R^4 は水素であり、 R^1 はフッ素であり、 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 5 8 】

表 1.11 : この表は式 (T - 1) の 60 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^3 、 R^4 および R^5 は水素であり、 R^1 および R^2 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 5 9 】

表 1.12 : この表は式 (T - 1) の 60 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^3 および R^4 は水素であり、 R^1 および R^2 はフッ素であり、 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。

【 実施例 】

【 0 1 6 0 】

以下の実施例は本発明を例示するものである。

【 0 1 6 1 】

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。

【 0 1 6 2 】

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。

【 0 1 6 3 】

本明細書を通して、温度は摂氏度 () で記載されており、「m.p.」は融点を意味する。LC/MS は液体クロマトグラフィー質量分光測定を意味し、LC/MS 分析に用いた装置および方法の説明は以下のとおりである。

【 0 1 6 4 】

装置および方法 A の説明は以下のとおり :

Waters 製の SQ Detector 2

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)

【 0 1 6 5 】

10

20

30

40

【表 2】

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

【0166】

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。

【0167】

装置および方法 B の説明は以下のとおり：

Waters 製の SQ Detector 2

イオン化法：エレクトロスプレー

極性：陽イオン

キャピラリ (kV) 3.5、コーン (V) 30.00、抽出器 (V) 3.00、ソース温度 () 150、脱溶剤温度 () 400、コーンガス流 (L/Hr) 60、脱溶剤ガス流 (L/Hr) 700

質量範囲：140 ~ 800 Da

DAD 波長範囲 (nm)：210 ~ 400

以下の HPLC 勾配条件による Waters ACQUITY UPLC 法

(溶剤 A：水/メタノール 9：1 + 0.1% ギ酸および溶剤 B：アセトニトリル + 0.1% ギ酸)

【0168】

【表 3】

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

【0169】

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。

【0170】

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。

【0171】

配合物実施例

【0172】

【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

【0173】

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。

【0174】

【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 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	-
カオリン	65 %	40 %	-
タルカム	-	-	20 %

20

【0175】

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。

【0176】

乳化性濃縮物

有効成分[式(I)の化合物]	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル (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 %

30

【0177】

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

【0178】

【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 %

50

【0179】

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。

【0180】

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 %

10

【0181】

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。

【0182】

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 %

【0183】

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。

20

【0184】

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 (15 mol のエチレンオキシド)	6 %
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 %
シリコーン油 (75 % 水中エマルジョンの形態)	1 %
水	32 %

30

【0185】

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。

【0186】

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 %
シリコーン油 (75 % 水中エマルジョンの形態)	0.2 %
水	45.3 %

40

【0187】

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

50

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。

【0188】

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。

【0189】

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。

【0190】

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。

【0191】

略語リスト:

D I E A = N - エチル - N - イソプロピル - プロパン - 2 - アミン

D I P E A = N , N - ジイソプロピルエチルアミン

D M A = ジメチルアセタミド

D M F = ジメチルホルムアミド

E t O A c = 酢酸エチル

E t O H = エチルアルコール

H C l = 塩酸

m p = 融点

M e O H = メチルアルコール

N a O H = 水酸化ナトリウム

T F A A = トリフルオロ酢酸無水物

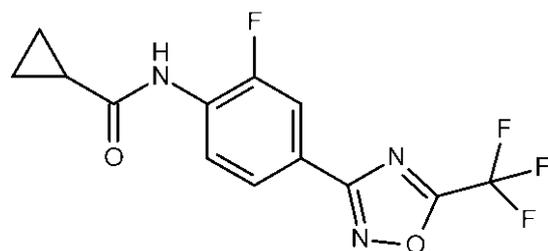
T H F = テトラヒドロフラン

【0192】

調製例

実施例1: この実施例は、N-[2-フルオロ-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]シクロプロパンカルボキサミド(表T1の化合物1.3)の調製を例示する。

【化10】



ステップ1: 4-アミノ-3-フルオロ-N'-ヒドロキシ-ベンズアミジンの調製

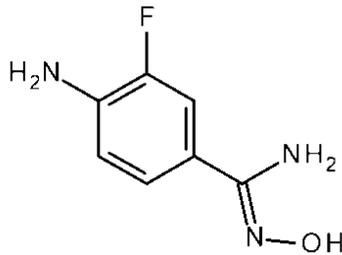
10

20

30

40

【化 1 1】



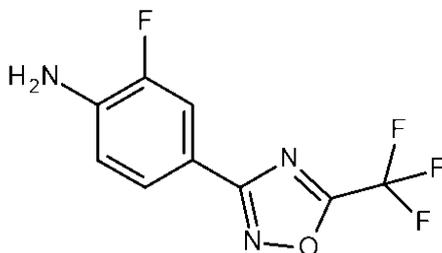
4 - アミノ - 3 - フルオロ - ベンゾニトリル (5 . 0 g、36 . 7 m m o l) のエタノール (61 m L) 中の溶液に、50 m L の水中の塩酸ヒドロキシルアミン溶液 (5 . 16 g、73 . 5 m m o l) を添加し、続いて、75 m L の水中の炭酸カリウム (8 . 12 g、58 . 8 m m o l) を添加した。次いで、濁った溶液に、キノリン - 8 - オール (0 . 07 g、0 . 48 m m o l) を導入した。この反応混合物を 100 で 5 時間攪拌した。次いで、この反応混合物を 25 に冷却し、エタノールを減圧下で除去し、次いで、得られる混合物を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層のすべてを塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、5 . 83 g の 4 - アミノ - 3 - フルオロ - N ' - ヒドロキシ - ベンズアミジン を黄色の固体として得た。粗残渣を、次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 0 . 20 分間 ; 166 [M + H ⁺] 。

¹H NMR (400 MHz , C D C l ₃) ppm : 9 . 30 (s , 1 H) , 7 . 25 (m , 2 H) , 6 . 70 (t , 1 H) , 5 . 60 (b r s , 2 H) , 5 . 30 (b r s , 2 H) .

【 0 1 9 3 】

ステップ 2 : 2 - フルオロ - 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] アニリンの調製

【化 1 2】



4 - アミノ - 3 - フルオロ - N ' - ヒドロキシ - ベンズアミジン (6 . 99 g、41 . 3 m m o l) の 2 - メチルトetraヒドロフラン (124 m L) 中の溶液に、T F A A (8 . 2 m L、57 . 9 m m o l) を滴下により導入した。この反応混合物を 25 で 2 時間分攪拌し、次いで、水および酢酸エチルでゆっくりと失活させた。水性相を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機層のすべてを塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮し、次いで、シリカゲル (シクロヘキサン : E t O A c 溶離液勾配 99 : 1 ~ 80 : 20) によるフラッシュクロマトグラフィに供してトリフルオロメチル化中間体 (7 . 02 g、20 . 5 m m o l) を得、これをメタノール (82 m L) 中に溶解し、35 % 塩酸 (3 . 01 m L、30 . 7 m m o l) で処理し、50 で 24 時間加熱した。混合物を 25 に冷却し、トルエンと共に共沸して、5 . 83 g の 2 - フルオロ - 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] アニリンを得た。

【 0 1 9 4 】

ステップ 3 : N - [2 - フルオロ - 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] プロパンアミドの調製

30

40

50

2 - フルオロ - 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] アニリン (0 . 1 0 g 、 0 . 3 6 m m o l) のジクロロメタン (6 m L) 中の溶液に、トリエチルアミン (0 . 1 5 m L 、 1 . 0 7 m m o l) および塩化シクロプロパンカルボニル (0 . 0 3 8 m L 、 0 . 4 2 m m o l) を導入し、反応混合物を 2 5 ° で 2 時間攪拌し、次いで、水およびジクロロメタンを添加した。水性層をジクロロメタンで抽出し、組み合わせた有機層のすべてを塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、揮発性物質を減圧下で濃縮した。得られた粗残渣をシリカゲル (ヘプタン : E t O A c 溶離液勾配 9 9 : 1 ~ 8 0 : 2 0) によるフラッシュクロマトグラフィによって精製して、0 . 0 7 7 g の N - [2 - フルオロ - 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] シクロプロパンカルボキサミドを得た。mp : 1 6 0 ~ 1 6 2 ° 。 LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1 . 0 3 分間、3 0 4 (M + H)

10

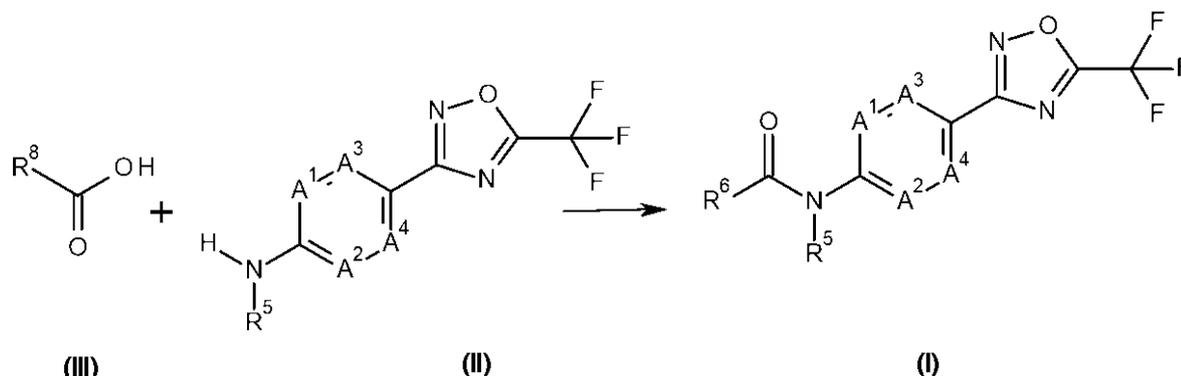
$^1\text{H NMR}$ (4 0 0 M H z , C D C l ₃) ppm : 8 . 5 2 (t , 1 H) , 7 . 8 5 (d , 1 H) , 7 . 7 6 (d , 1 H) , 7 . 4 5 (b r s , 1 H) , 2 . 4 1 (q , 2 H) , 1 . 2 6 (t , 3 H) .

【 0 1 9 5 】

適切な構築ブロック (化合物 (I I) および (I I I)) を用い、以下の基本手順を組み合わせて用いて式 (I) の化合物を得た。以下の組み合わせプロトコルを介して調製した化合物は LC / MS 方法 B を用いて分析した。

【 化 1 3 】

20



30

【 0 1 9 6 】

例示として、式 (I I I) の酸誘導体 (3 7 5 μ L の DMA 中の 0 . 0 3 7 5 m m o l) を、式 (I I) の [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] アリール] メタンアミン誘導体 (0 . 0 3 m m o l) および 2 5 0 μ L DMA 中の DIPEA (0 . 0 9 m m o l) を含有する 9 6 スロットディープウェルプレート (DWP 9 6) に移し、続いて、DMA (2 5 0 μ L) 中に溶解した BOP - Cl (0 . 0 6 m m o l) を添加した。DWP 9 6 をシールし、5 0 ° で 1 8 時間攪拌した。溶剤を窒素流下で除去した。得られた粗残渣を Me OH (2 5 0 μ L) と DMA (5 0 0 μ L) との混合物中に可溶化し、そのまま分取 LC / MS 精製に供し、これにより、式 (I) の化合物を 1 0 ~ 8 5 % の収率で得た。

40

【 0 1 9 7 】

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。

【 0 1 9 8 】

【表 7 - 1】

表 T1:式(I)に係る化合物の融点(mp)データおよび/または保持時間(RT) :

項目	化合物名	構造	RT (分)	[M+H] (計測値)	方法	mp (°C)
1.1	N-[2-メチル-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]シクロプロパンカルボキサミド					185 - 196
1.2	N-[2-メチル-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]ベンズアミド					173 - 176
1.3	N-[2-フルオロ-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]シクロプロパンカルボキサミド					160 - 162
1.4	N-[2-フルオロ-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]ベンズアミド					166 - 175

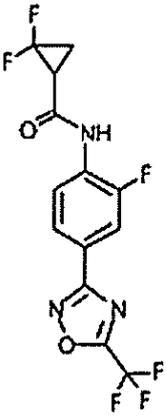
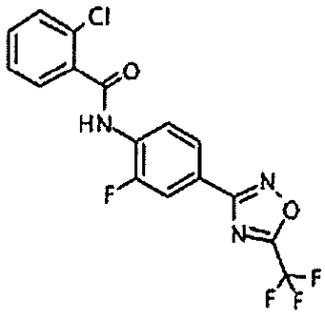
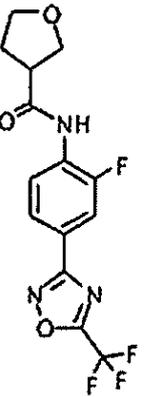
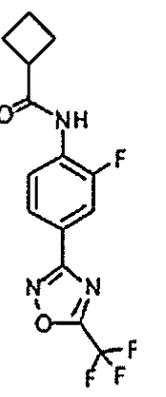
10

20

30

40

【表 7 - 2】

1.5	2,2-ジフルオロ-N-[2-フルオロ-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]シクロプロパンカルボキサミド		1.66	352.1	B	
1.6	2-クロロ-N-[2-フルオロ-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]ベンズアミド		1.84	386.1	B	
1.7	N-[2-フルオロ-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]テトラヒドロフラン-3-カルボキサミド		1.48	346.1	B	
1.8	N-[2-フルオロ-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]シクロブタンカルボキサミド		1.75	330.1	B	

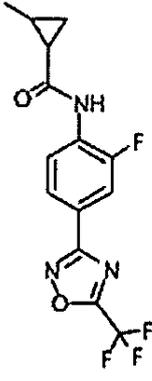
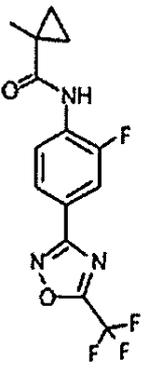
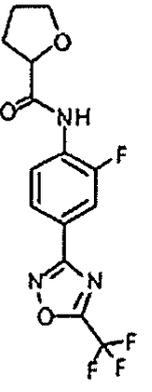
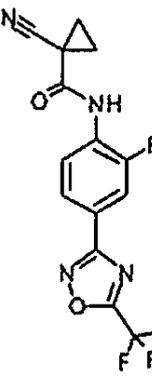
10

20

30

40

【表 7 - 3】

1. 9	N-[2-フルオロ-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]-2-メチルシクロプロパンカルボキサミド		1.75	330.1	B	
1. 10	N-[2-フルオロ-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]-1-メチルシクロプロパンカルボキサミド		1.77	330.1	B	
1. 11	N-[2-フルオロ-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]テトラヒドロフラン-2-カルボキサミド		1.70	346.1	B	
1. 12	1-シアノ-N-[2-フルオロ-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]シクロプロパンカルボキサミド		1.66	341.2	B	

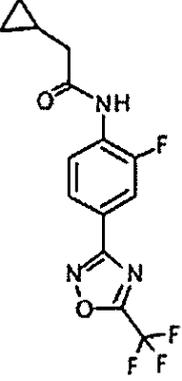
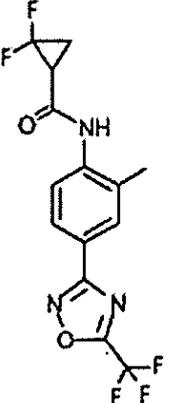
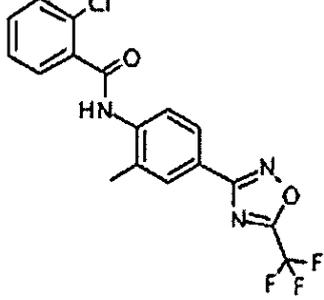
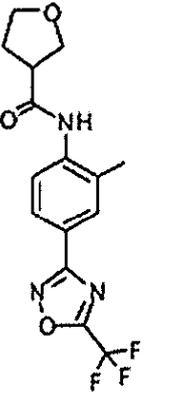
10

20

30

40

【表 7 - 4】

1. 13	2-シクロプロピル-N-[2-フルオロ-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		1.70	330.1	B	
1. 14	2,2-ジフルオロ-N-[2-メチル-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]シクロプロパンカルボキサミド		1.64	348.1	B	
1. 15	2-クロロ-N-[2-メチル-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]ベンズアミド		1.80	382.1	B	
1. 16	N-[2-メチル-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]テトラヒドロフラン-3-カルボキサミド		1.44	342.1	B	

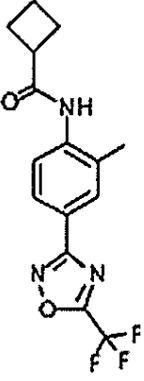
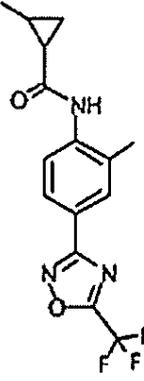
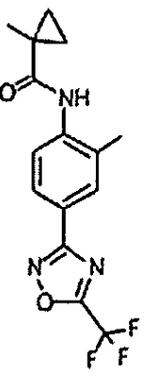
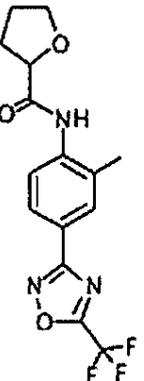
10

20

30

40

【表 7 - 5】

1.17	N-[2-メチル-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]シクロブタンカルボキサミド		1.69	326.2	B	
1.18	2-メチル-N-[2-メチル-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]シクロプロパンカルボキサミド		1.70	326.2	B	
1.19	1-メチル-N-[2-メチル-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]シクロプロパンカルボキサミド		1.70	326.2	B	
1.20	N-[2-メチル-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]テトラヒドロフラン-2-カルボキサミド		1.64	342.1	B	

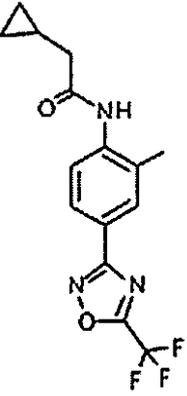
10

20

30

40

【表 7 - 6】

1. 21	2-シクロプロピル-N-[2-メチル-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. 65	326. 2	B	
-------	---	---	-------	--------	---	--

10

【0199】

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。

20

【0200】

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：

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。

30

【0201】

実施例1：プッシニアレコンディタ *f. sp. tritici* (Puccinia recondita *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）

40

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日後に真菌の孢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。

【0202】

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

50

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。

【0203】

化合物(表T1より): 1.5、1.7、1.10、1.12、1.13、1.19および1.20。

【0204】

実施例2: プッシニアレコンディタ *f. sp. tritici* (*Puccinia recondita 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、真菌の孢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、未処理の検査用葉片に現われた時点で(適用から6~8日後)、未処理のものとした病害防除割合として評価した。

10

【0205】

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。

20

【0206】

化合物(表T1より): 1.3、1.5、1.7、1.10、1.12、1.13、1.19および1.20。

【0207】

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)、未処理のものとした病害防除割合として評価する。

30

【0208】

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。

【0209】

化合物(表T1より): 1.1、1.2、1.3、および1.4。

【0210】

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、真菌胞子を含む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。

40

【0211】

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

50

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。

【0212】

化合物(表T1より): 1.3、1.5、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.12、1.13、1.16、1.19、および1.20。

【0213】

実施例5: ウロマイセスヴィシアエ-ファバエ (*Uromyces viciae-fabae*) に対する殺菌・殺カビ活性/ソラマメ/葉片予防(ソラマメさび病)

ソラマメ葉片をマルチウェルプレート(96ウェル型)中の素寒天培地上に載せ、アセトンで希釈された配合されたテスト化合物10 μ lを、散布用ピペットで葉片に塗布する。適用から2時間後、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。葉片を、気候キャビネット中において、18時間日および70%の相対湿度で、22でインキュベートする。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日後)、未処理のものとは比した病害防除割合として評価する。

10

【0214】

以下の化合物は、適用される配合物中100ppm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。

【0215】

化合物(表T1より):

20

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2017/068277

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D413/12 C07D271/06 A01P3/00 A01N43/836 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) C07D A01N		
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.
X	US 4 871 753 A (ROHR OTTO [CH]) 3 October 1989 (1989-10-03) column 1, paragraph 1 claims 1,18 -----	1-13
<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
7 September 2017		25/09/2017
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
		Fanni, Stefano

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2017/068277

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 4871753	A	03-10-1989	
		AU 8246587 A	16-06-1988
		BR 8706756 A	19-07-1988
		DK 650787 A	13-06-1988
		EP 0276432 A2	03-08-1988
		NZ 222868 A	26-09-1990
		PT 86329 A	01-01-1988
		US 4871753 A	03-10-1989

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 53/14 (2006.01) A 0 1 N 53/14
A 0 1 N 43/80 (2006.01) A 0 1 N 43/80 1 0 2

(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 100119013

弁理士 山崎 一夫

(74) 代理人 100123777

弁理士 市川 さつき

(74) 代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74) 代理人 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
 テクシオン 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
 テクシオン 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
 テクシオン 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
 テクシオン 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 AF05 FA07 FB01

4C063 AA01 BB09 CC73 DD58 EE03

4H011 AA01 AA03 BB10 BB15 BC03 BC07 BC08 BC16 BC18 BC19

BC20 BC22 DA02 DA05 DA13 DA15 DA16 DD03 DE15 DH03

DH05 DH10