

(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2019-514845

(P2019-514845A)

(43) 公表日 令和1年6月6日(2019.6.6)

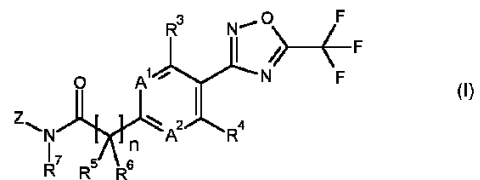
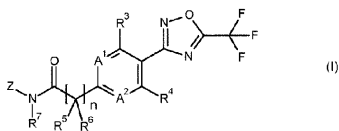
(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 271/06 (2006.01)	C O 7 D 271/06 C S P	4 C O 5 6
A61P 31/04 (2006.01)	A 6 1 P 31/04	4 C O 6 3
A61P 31/10 (2006.01)	A 6 1 P 31/10	4 C O 8 6
C07D 413/12 (2006.01)	C O 7 D 413/12	4 H O 1 1
A61K 31/4245 (2006.01)	A 6 1 K 31/4245	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 97 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2018-548804 (P2018-548804)	(71) 出願人	300091441 シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー スイス国4058 バーゼル、シュバルツ バルトアレー 215
(86) (22) 出願日	平成29年3月14日 (2017. 3. 14)	(74) 代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(85) 翻訳文提出日	平成30年11月1日 (2018. 11. 1)	(74) 代理人	100088694 弁理士 弟子丸 健
(86) 国際出願番号	PCT/EP2017/056032	(74) 代理人	100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(87) 国際公開番号	W02017/157962	(74) 代理人	100084663 弁理士 箱田 篤
(87) 国際公開日	平成29年9月21日 (2017. 9. 21)	(74) 代理人	100093300 弁理士 浅井 賢治
(31) 優先権主張番号	16160437.6		
(32) 優先日	平成28年3月15日 (2016. 3. 15)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		
(31) 優先権主張番号	16167139.1		
(32) 優先日	平成28年4月26日 (2016. 4. 26)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		
最終頁に続く			

(54) 【発明の名称】 殺微生物オキサジアゾール誘導体

(57) 【要約】

有害生物防除剤、特に殺菌・殺カビ剤として有用である、式(I)



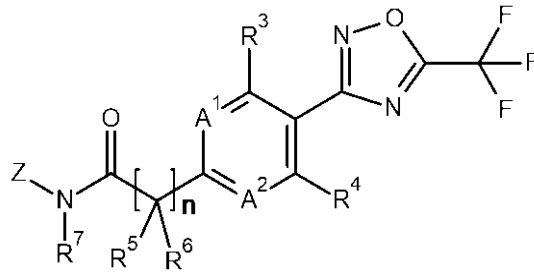
(式中、置換基は、請求項1に定義されているとおりである)の化合物。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

10

(式中、

 n は、0 または 1 を表し； A^1 は、 N または 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、またはジフルオロメトキシであり； A^2 は、 N または 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、またはジフルオロメトキシであり； R^3 および R^4 は、独立して、水素またはハロゲンを表し； R^5 および R^6 は、独立して、水素またはメチルを表し；

20

 R^7 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、 C_{1-4} アルキル、ジ- C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、フェニルカルボニル、または C_{3-6} シクロアルキルであり； Z は、 $\text{-NR}^8\text{R}^9$ を表し、ここで、 R^8 は、水素または C_{1-4} アルキルを表し；

R^9 は、水素、 C_{1-6} 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、シアノ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} フルオロアルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキルカルボニル、 C_{1-4} ハロアルキルアミノカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、ジ- C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノチオカルボニル、ジ- C_{1-4} アルキルアミノチオカルボニル、 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、フェニルカルボニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール C_{1-3} アルキル、ヘテロアリールカルボニル（ここで、前記ヘテロアリール部分は、 N 、 O および S から個別に選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を含む 5 員または 6 員芳香環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-3} アルキル（ここで、前記ヘテロシクリル部分は、 N 、 O および S から個別に選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む 4 員 ~ 6 員非芳香環である）、またはヘテロビスシクリル（ここで、前記ヘテロビスシクリル部分は、 N 、 O および S から選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む 7 員 ~ 11 員芳香族飽和または部分的飽和縮合環系である）を表し、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、またはヘテロビスシクリル部分のいずれかは、 R^{10} から選択される、同じかまたは異なり得る 1、2、3 または 4 つの置換基で任意選択により置換され；

30

40

R^{10} は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、メトキシ、エトキシ、アリル、プロパルギル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメトキシを表し；または

R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、 N 、 O および S から個別に選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を任意選択によりさらに含む 5 員または 6 員非芳香族複素環を形成し、ここで、前記複素環は、 R^{11} から選択される、同じかまたは異なり得る 1、2、3 または 4 つの置換基で任意選択により置換され；または

50

R⁸およびR⁹は、それらが結合される窒素原子と一緒に、N、OおよびSから個別に選択される1、2または3個のヘテロ原子を任意選択によりさらに含む7員～11員複素環式芳香族または非芳香族複素環式縮合環系を形成し、ここで、前記複素環式芳香族または複素環式縮合環系は、R¹¹から選択される、同じかまたは異なり得る1、2、3または4つの置換基で任意選択により置換され；および

R¹¹は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₂フルオロアルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₂アルコキシC₁₋₄アルキル、アリル、またはプロパルギルを表し、かつR¹¹は、非芳香族複素環式部分におけるオキシも表し得る)

の化合物またはその塩もしくはN-オキシドであって、ただし、式(I)の前記化合物は、

N'-ベンゾイル-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]ベンゾヒドラジド；

1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-3-[[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]ベンゾイル]アミノ]尿素；

N-モルホリン-4-イル-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]ベンズアミド；

N'-(3-メチルフェニル)-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]ベンゾヒドラジド；

4-メチル-N'-[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]ベンゾイル]-1,3-チアゾール-5-カルボヒドラジド；

3-メチル-N'-[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]ベンゾイル]チオフェン-2-カルボヒドラジド；

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]ベンゾヒドラジド；または

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]ベンゾヒドラジド塩酸塩ではない、式(I)の化合物またはその塩もしくはN-オキシド。

【請求項2】

A¹は、NまたはCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、またはメチルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

A²は、NまたはCR²を表し、ここで、R²は、水素、ハロゲン、またはメチルから選択される、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

A¹およびA²は、両方ともC-Hを表し、かつR³およびR⁴は、両方とも水素を表す、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

R⁵およびR⁶は、両方とも水素を表す、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R⁷は、水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アルキルアミノカルボニルC₁₋₄アルキル、またはフェニルカルボニルから選択される、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R⁸は、水素またはメチルを表す、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

R⁹は、水素、C₁₋₆アルキル、ヒドロキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルコキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₂フルオロアルコキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、C₃₋₈シクロアルキル、またはC₃₋₈シクロアルキルC₁₋₃アルキルから選択される、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

R⁸およびR⁹は、それらが結合される窒素原子と一緒に、シアノ、アミノ、ハロゲン、

10

20

30

40

50

ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される、同じかまたは異なり得る 1 つまたは 2 つの置換基で任意選択により置換される - ラクタム、イミダゾリノン、イミダゾリン - ジオン、オキサゾリジノン、またはモルホリン基を形成する、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される、同じかまたは異なり得る 1 つまたは 2 つの置換基で任意選択により置換されるインドールまたはインドレン基を形成する、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

n は、0 である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

殺菌・殺力比的に有効な量の請求項 1 ~ 11 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。

【請求項 13】

少なくとも 1 種の追加の活性処方成分および / 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 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

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請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物、または活性処方成分としてこの化合物を含む組成物は、前記植物、その一部またはその生息地に適用される、方法。

【請求項 15】

殺菌・殺力比剤としての、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、例えば、特に殺菌・殺力比活性といった殺微生物活性を有する活性処方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。

【背景技術】

【0002】

フェニルオキサジアゾール誘導体は、例えば、国際公開第 2013/066835 号および国際公開第 2013/008162 号から医薬活性剤として知られている。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。いくつかのフェニルオキサジアゾール誘導体はまた、化学ライブラリーから知られている。

【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) :

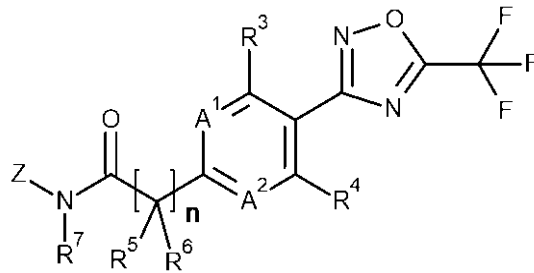
10

20

30

40

【化 1】



(I)

(式中、

n は、0 または 1 を表し；

A¹ は、N または C R¹ 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、またはジフルオロメトキシであり；A² は、N または C R² 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、またはジフルオロメトキシであり；R³ および R⁴ は、独立して、水素またはハロゲンを表し；R⁵ および R⁶ は、独立して、水素またはメチルを表し；R⁷ は、水素、C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルキルカルボニル、C₁₋₄ アルキルアミノカルボニル C₁₋₄ アルキル、ジ - C₁₋₄ アルキルアミノカルボニル C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルキルアミノカルボニル、フェニルカルボニル、または C₃₋₆ シクロアルキルを表し；Z は、- N R⁸ R⁹ を表し、ここで、R⁸ は、水素または C₁₋₄ アルキルを表し；

R⁹ は、水素、C₁₋₆ 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、シアノ C₁₋₆ アルキル、ヒドロキシ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₂ フルオロアルコキシ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ アルキルカルボニル、C₁₋₄ アルキルカルボニル C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ ハロアルキルカルボニル、C₁₋₄ ハロアルキルアミノカルボニル、C₁₋₄ アルコキシカルボニル、C₁₋₄ アルコキシカルボニル C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ アルキルアミノカルボニル、ジ - C₁₋₄ アルキルアミノカルボニル、C₁₋₄ アルキルアミノチオカルボニル、ジ - C₁₋₄ アルキルアミノチオカルボニル、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、フェニルカルボニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール C₁₋₃ アルキル、ヘテロアリールカルボニル（ここで、ヘテロアリール部分は、N、O および S から個別に選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を含む 5 員または 6 員芳香環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル 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 から個別に選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む 4 員 ~ 6 員非芳香環である）、またはヘテロビシクリル（ここで、ヘテロビシクリル部分は、N、O および S から選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む 7 員 ~ 11 員芳香族飽和または部分的飽和縮合環系である）を表し、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、またはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R¹⁰ から選択される、同じかまたは異なり得る 1、2、3 または 4 つの置換基で任意選択により置換され；

R¹⁰ は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁₋₄ アルキル、メトキシ、エトキシ、アリル、プロパルギル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメトキシを表し；または

R⁸ および R⁹ は、それらが結合される窒素原子と一緒に、N、O および S から個別に選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を任意選択によりさらに含む 5 員または 6 員非芳香族複素環を形成し、ここで、複素環は、R¹¹ から選択される、同じかまたは異なり得る 1、2、3 または 4 つの置換基で任意選択により置換され；または

R⁸ および R⁹ は、それらが結合される窒素原子と一緒に、N、O および S から個別に選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を任意選択によりさらに含む 7 員 ~ 11 員複素環式芳香族または非芳香族複素環式縮合環系を形成し、ここで、前記複素環式芳香族または

10

20

30

40

50

複素環式縮合環系は、 R^{11} から選択される、同じかまたは異なり得る1、2、3または4つの置換基で任意選択により置換され；および

R^{11} は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} フルオロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、アリル、またはプロパルギルを表し、かつ R^{11} は、非芳香族複素環式部分におけるオキシも表し得る)

の化合物またはその塩もしくはN-オキシドであって、ただし、式(I)の化合物は、

N'-ベンゾイル-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]ベンゾヒドラジド；

1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-3-[[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]ベンゾイル]アミノ]尿素；

N-モルホリン-4-イル-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]ベンズアミド；

N'-(3-メチルフェニル)-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]ベンゾヒドラジド；

4-メチル-N'-[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]ベンゾイル]-1,3-チアゾール-5-カルボヒドラジド；

3-メチル-N'-[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]ベンゾイル]チオフェン-2-カルボヒドラジド；

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]ベンゾヒドラジド；または

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]ベンゾヒドラジド塩酸塩ではない、式(I)の化合物またはその塩もしくはN-オキシドが提供される。

【発明を実施するための形態】

【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。

【0005】

本発明の第2の態様によれば、殺菌・殺力ピ的に有効な量の式(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つのさらなる活性成分および/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・殺力ピ的に有効な量の式(I)の化合物、または活性処方成分としてこの化合物を含む組成物が、植物、その一部またはその生息地に適用される方法が提供される。

【0007】

本発明の第4の態様によれば、殺菌・殺力ピ剤としての式(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、手術または治療によるヒトまたは動物の身体の処置のための方法を除外し得る。

【0008】

本明細書において用いられるとき、「ハロゲン」または「ハロ」という用語は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素、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き、「 C_{1-6} アルキル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、不飽和を含まず、1~6個の炭素原子を有し、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を指す。 C_{1-4} アルキルおよび C_{1-3} アルキルは、相応に解釈されるべきである。 C_{1-6} アルキルの例としては、これらに限定されないが、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル(イソ-ブ

10

20

30

40

50

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。「 $C_1 \sim C_6$ アルキレン」基は、このようなラジカルが2つの単結合によって分子の残りの部分に結合されることを除いて、 $C_1 \sim C_6$ アルキル(および C_{1-4} アルキル)の対応する定義を指す。 $C_1 \sim C_6$ アルキレンの例としては、これらに限定されないが、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ および $-(CH_2)_3-$ が挙げられる。

【0010】

本明細書において用いられるとき、シアノは、 $-CN$ 基を意味する。

【0011】

本明細書において用いられるとき、ヒドロキシは、 $-OH$ 基を意味する。

【0012】

本明細書において用いられるとき、アミノは、 $-NH_2$ 基を意味する。

10

【0013】

本明細書において用いられるとき、「ホルミル」は、 $-C(O)H$ 基を意味し、「アシル」は、 $-C(O)CH_3$ 基を意味する。

【0014】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} アルコキシ」という用語は、式 $-OR_a$ のラジカルを指し、式中、 R_a は、一般に上記に定義されている $C_1 \sim C_4$ アルキルラジカルである。 C_{1-2} アルコキシは、相応に解釈されるべきである。 C_{1-4} 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。

20

【0015】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} ハロアルキル」という用語は、同じかまたは異なるハロゲン原子の1つ以上で置換された一般に上記に定義されている 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。

【0016】

本明細書において用いられるとき、「 C_{3-6} 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。 C_{3-4} アルケニルは、相応に解釈されるべきである。 $C_3 \sim C_6$ 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、アリル(プロパ-2-エニル)、ブタ-1-エニルが挙げられる。

30

【0017】

本明細書において用いられるとき、「 C_{3-6} 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。「 C_{3-4} アルキニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。 C_{3-6} 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

【0018】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} ハロアルコキシ」という用語は、同じかまたは異なるハロゲン原子の1つ以上で置換された上記に定義されている C_{1-4} アルコキシ基を指す。 C_{1-2} ハロアルコキシ(C_{1-2} フルオロアルコキシを含む)は、相応に解釈されるべきである。 C_{1-4} ハロアルコキシの例としては、これらに限定されないが、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシが挙げられる。

【0019】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキル」という用語は、式 R_b-O-R_a- のラジカルを指し、式中、 R_b は、一般に上記に定義されている C_{1-4} ア

50

ルキルラジカルであり、かつ R_a は、一般に上記に定義されている C_{1-6} アルキレンラジカルである。 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アルキルおよび C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキルは、相応に解釈されるべきである。

【0020】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} ハロアルコキシ C_{1-6} アルキル」という用語は、式 $R_b - O - R_a -$ のラジカルを指し、式中、 R_b は、一般に上記に定義されている C_{1-4} ハロアルキルラジカルであり、かつ R_a は、一般に上記に定義されている C_{1-6} アルキレンラジカルである。 C_{1-2} ハロアルコキシ C_{1-4} アルキルは、相応に解釈されるべきである。 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキルの例としては、これらに限定されないが、ジフルオロメトキシエチルが挙げられる。

10

【0021】

本明細書において用いられるとき、「ヒドロキシ C_{1-6} アルキル」という用語は、1つ以上のヒドロキシ基で置換された一般に上記に定義されている C_{1-6} アルキルラジカルを指す。ヒドロキシ C_{1-4} アルキルは、相応に解釈されるべきである。

【0022】

本明細書において用いられるとき、「シアノ C_{1-6} アルキル」という用語は、1つ以上のシアノ基で置換された一般に上記に定義されている C_{1-6} アルキルラジカルを指す。シアノ C_{1-4} アルキルは、相応に解釈されるべきである。

【0023】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} アルキルカルボニル」という用語は、式 $-C(O)R_a$ のラジカルを指し、式中、 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。

20

【0024】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル」という用語は、式 $-R_b C(O)R_a$ のラジカルを指し、式中、 R_a は、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルであり、かつ R_b は、一般に上記に定義されている C_{1-6} アルキレンラジカルである。

【0025】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} ハロアルキルカルボニル」という用語は、式 $-C(O)R_a$ のラジカルを指し、式中、 R_a は、一般に上記に定義されている C_{1-4} ハロアルキルである。

30

【0026】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} ハロ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、式中、 R_a は、一般に上記に定義されている C_{1-4} ハロアルキルである。

【0027】

本明細書において用いられるとき、「 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、式中、 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。

【0028】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-4} アルキル」という用語は、式 $-R_b C(O)OR_a$ のラジカルを指し、式中、 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り、かつ R_b 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。

40

【0029】

本明細書において用いられるとき、「 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、式中、 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。

【0030】

本明細書において用いられるとき、「ジ C_{1-4} アルキルアミノカルボニル」という用語

50

は、式 - $C(O)NR_a(R_a)$ のラジカルを指し、式中、各 R_a は、独立して、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。

【0031】

本明細書において用いられるとき、「 C_{1-4} アルキルアミノチオカルボニル」という用語は、式 - $C(S)NHR_a$ のラジカルを指し、式中、 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。

【0032】

本明細書において用いられるとき、「ジ C_{1-4} アルキルアミノチオカルボニル」という用語は、式 - $C(S)NR_a(R_a)$ のラジカルを指し、式中、各 R_a は、独立して、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

【0033】

本明細書において用いられるとき、「 C_{3-8} シクロアルキル」という用語は、飽和または部分的不飽和であり、3 ~ 8 個の炭素原子を含有する安定した単環ラジカルを指す。 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。

【0034】

本明細書において用いられるとき、「 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} アルキルラジカルによって分子の残りの部分に結合された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。

20

【0035】

本明細書において用いられるとき、「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りの部分に結合されたフェニル環を指す。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。

【0036】

本明細書において用いられるとき、「フェニルカルボニル」という用語は、 $C(O)$ ラジカルによって分子の残りの部分に結合されたフェニル環を指す。

30

【0037】

本明細書において用いられるとき、「ヘテロアリール」という用語は、窒素、酸素および硫黄から個別に選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を含む 5 員もしくは 6 員単環式芳香環または 7 員 ~ 11 員芳香族縮合環ラジカルを指す。ヘテロアリールラジカルは、炭素原子またはヘテロ原子を介して分子の残りの部分に結合され得る。ヘテロアリールの例としては、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、ピリミジル、ピリジル、またはインドリルが挙げられる。

40

【0038】

本明細書において用いられるとき、「ヘテロアリール 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りの部分に結合された上記に定義されているヘテロアリール環を指す。

【0039】

本明細書において用いられるとき、「ヘテロアリールカルボニル」という用語は、 $C(O)$ ラジカルによって分子の残りの部分に結合された上記に定義されているヘテロアリール環を指す。

【0040】

本明細書において用いられるとき、「ヘテロシクリル」または「複素環式」という用語

50

は、窒素、酸素および硫黄から個別に選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む安定した 4 員 ~ 6 員、好ましくは 5 員もしくは 6 員非芳香族単環または 7 員 ~ 11 員非芳香族縮合環ラジカルを指す。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りの部分に結合され得る。ヘテロシクリルの例としては、これらに限定されないが、ピロリニル、ピロリジル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル、ペペリジル、ペペラジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサソラニル、モルホリニル、 β -ラクタミル、ペルヒドロアゼピニル (perhydroazepinyl)、インドリニル、またはベンズイミダゾールが挙げられる。

【0041】

本明細書において用いられるとき、「ヘテロシクリル 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りの部分に結合された上記に定義されている複素環を指す。

10

【0042】

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。

20

【0043】

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。

【0044】

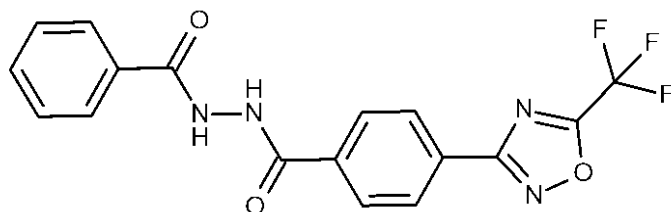
N - オキシドは、第三級アミンの酸化型、または窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍 "Heterocyclic N - oxides", A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991 に記載されている。

30

【0045】

本発明に係らない式 (I) の化合物は、

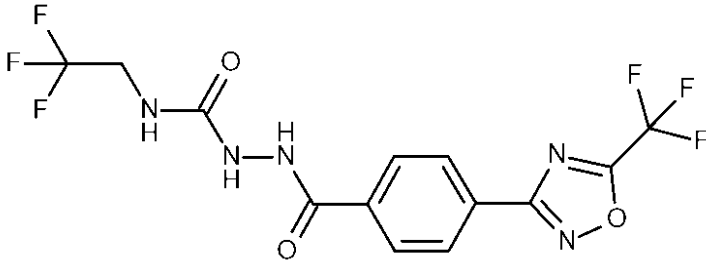
【化 2】



40

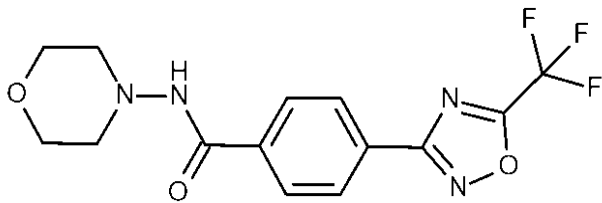
N' - ベンゾイル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゾヒドラジド ;

【化 3】



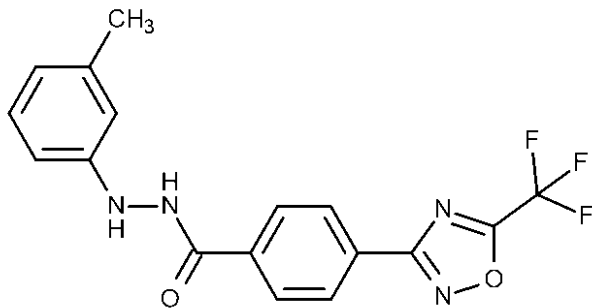
1 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) - 3 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル)
- 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゾイル] アミノ] 尿素 ; 10

【化 4】



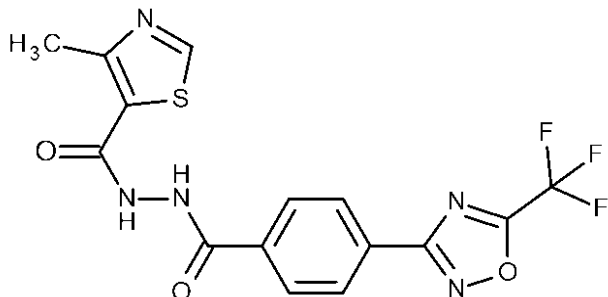
N - モルホリン - 4 - イル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジ
アゾール - 3 - イル] ベンズアミド ; 20

【化 5】



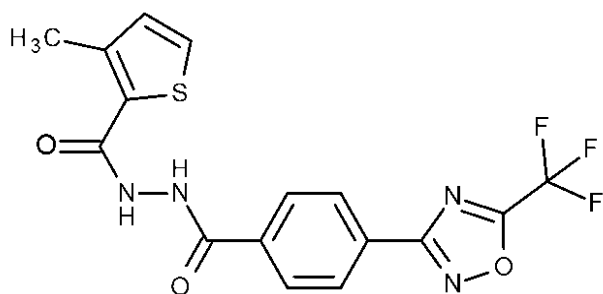
N' - (3 - メチルフェニル) - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキ
サジアゾール - 3 - イル] ベンゾヒドラジド ; 30

【化 6】



4 - メチル - N' - [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] ベンゾイル] - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボヒドラジド ; 40

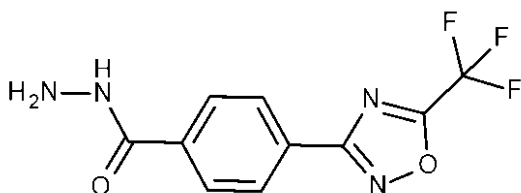
【化 7】



10

3 - メチル - N' - [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] ベンゾイル] チオフェン - 2 - カルボヒドラジド ;

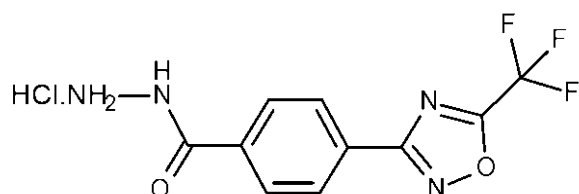
【化 8】



20

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] ベンゾヒドラジド ; および

【化 9】



30

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] ベンゾヒドラジド塩酸塩である。

【0046】

本発明に係らないこれらの上記の化合物の各々は、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に使用され得、ここで、殺菌・殺力比的に有効な量の化合物または化合物を含む組成物が、活性成分として植物、植物の一部またはその生息地に適用される。同様に、本発明に係らない上記の化合物は、殺菌・殺力剤として有用であり得る。

【0047】

本発明に係らない上記の化合物は、PubChem Compound Database (CID86777455、CID86777507、CID86777680、CID86812992、CID86814280、CID99805418) またはChemical Abstracts (ACS) から知られている。

40

【0048】

以下のリストは、本発明に係る式 (I) の化合物に関して、置換基 n 、 A^1 、 A^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Z 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} についての、好ましい定義を含む定義を提供する。これらの置換基のいずれか 1 つについて、以下に示される定義のいずれかが、以下または本明細書の他の箇所に示されるいずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わせられ得る。

【0049】

n は、0 または 1 を表す。本発明のいくつかの実施形態において、 n は、0 である。本発明の他の実施形態において、 n は、1 である。

50

【 0 0 5 0 】

A¹は、Nまたは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、またはジフルオロメトキシである。好ましくは、A¹は、NまたはCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、またはメチルから選択される。より好ましくは、A¹は、CR¹であり、かつR¹は、水素、フルオロ、またはメチルである。

【 0 0 5 1 】

A²は、Nまたは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、またはジフルオロメトキシを表す。好ましくは、A²は、NまたはCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、またはメチルから選択される。より好ましくは、A²は、CR²であり、かつR²は、水素、フルオロ、またはメチル、最も好ましくは水素である。

10

【 0 0 5 2 】

R³は、水素またはハロゲンを表す。好ましくは、R³は、水素またはフルオロである。

【 0 0 5 3 】

R⁴は、水素またはハロゲンを表す。好ましくは、R⁴は、水素またはフルオロである。

【 0 0 5 4 】

さらなる実施形態において、R³およびR⁴は、両方とも水素である。

【 0 0 5 5 】

本発明の一実施形態において、A¹は、NまたはCR¹を表し、A²は、CR²を表し、かつR¹、R²、R³およびR⁴の0、1または2つがフッ素であり、ここで、R¹、R²、R³およびR⁴のいずれかがフッ素でない場合、それは水素である。

20

【 0 0 5 6 】

R⁵およびR⁶は、独立して、水素またはメチルを表す。好ましくは、R⁵およびR⁶は、両方とも水素である。

【 0 0 5 7 】

R⁷は、水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アルキルアミノカルボニルC₁₋₄アルキル、ジ-C₁₋₄アルキルアミノカルボニルC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルアミノカルボニル、フェニルカルボニル、またはC₃₋₆シクロアルキルである。好ましくは、R⁷は、水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルアミノカルボニルC₁₋₄アルキル、またはフェニルカルボニルである。より好ましくは、R⁷は、水素、メチル、N-tert-ブチルアセトアミド、またはフェニルカルボニルである。最も好ましくは、R⁷は、水素である。

30

【 0 0 5 8 】

Zは、-NR⁸R⁹を表す。

【 0 0 5 9 】

R⁸は、水素またはC₁₋₄アルキルを表す。好ましくは、R⁸は、水素またはメチル、特に水素である。

【 0 0 6 0 】

R⁹は、水素、C₁₋₆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、シアノC₁₋₆アルキル、ヒドロキシルC₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルコキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₂フルオロアルコキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アルキルカルボニルC₁₋₆アルキル、C₁₋₄ハロアルキルカルボニル、C₁₋₄ハロアルキルアミノカルボニル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、C₁₋₄アルコキシカルボニルC₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルキルアミノカルボニル、ジ-C₁₋₄アルキルアミノカルボニル、C₁₋₄アルキルアミノチオカルボニル、ジ-C₁₋₄アルキルアミノチオカルボニル、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、フェニルカルボニル、ヘテロアリアル、ヘテロアリアルC₁₋₃アルキル、ヘテロアリアルカルボニル（ここで、ヘテロアリアル部分は、N、OおよびSから個別に選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む5員または6員芳香環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル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から個別に選択される1

40

50

、2または3個のヘテロ原子を含む4員～6員非芳香環である)、またはヘテロビシクリル(ここで、ヘテロビシクリル部分は、N、OおよびSから選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む7員～11員芳香族飽和または部分的飽和縮合環系である)を表し、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、またはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 R^{10} から選択される、同じかまたは異なり得る1、2、3または4つの置換基で任意選択により置換される。

【0061】

好ましくは、 R^9 は、 C_{1-6} 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、シアノ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} フルオロアルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルキルカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキルカルボニル、 C_1 ハロアルキルアミノカルボニル、 C_{3-4} ハロアルキルアミノカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、ジ- C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノチオカルボニル、ジ- C_{1-4} アルキルアミノチオカルボニル、 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 C_{1-3} アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール C_{1-3} アルキル、ヘテロアリールカルボニル(ここで、ヘテロアリール部分は、NおよびOから個別に選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む5員芳香環、またはN、OおよびSから個別に選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む6員芳香環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C_{1-3} アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから個別に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む4員～6員非芳香環である)、またはヘテロビシクリル(ここで、ヘテロビシクリル部分は、N、OおよびSから選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む7員～11員芳香族飽和または部分的飽和縮合環系である)を表し、ここで、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、またはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 R^{10} から選択される、同じかまたは異なり得る1、2、3または4つの置換基で任意選択により置換される。

【0062】

より好ましくは、 R^9 は、水素、 C_{1-6} アルキル、ヒドロキシル C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-2} フルオロアルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{3-8} シクロアルキル、および C_{3-8} シクロアルキル C_{1-3} アルキルを表す。さらにより好ましくは、 R^9 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、ヒドロキシル C_{1-6} アルキル、または C_{1-2} フルオロアルコキシ C_{1-6} アルキルである。さらにより好ましくは、 R^9 は、水素、メチル、アシル、メトキシカルボニル、2-ヒドロキシエチル、またはジフルオロメトキシエチルである。

【0063】

R^9 のいくつかの実施形態において、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリル部分のいずれかは、 R^{10} から選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは2つの置換基で任意選択により置換され得る。

【0064】

あるいは、 R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、N、OおよびSから個別に選択される1、2または3個のヘテロ原子を任意選択によりさらに含む5員または6員非芳香族複素環を形成し、ここで、複素環は、 R^{11} から選択される、同じかまたは異なり得る1、2、3または4つの置換基で任意選択により置換され、または

R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、N、OおよびSから個別に選択される1、2または3個のヘテロ原子を任意選択によりさらに含む7員～11員複素環式芳香族または非芳香族複素環式縮合環系を形成し、ここで、前記複素環式芳香族または複素環式縮合環系は、 R^{11} から選択される、同じかまたは異なり得る1、2、3または4つの置換基で任意選択により置換される。

【0065】

10

20

30

40

50

好ましくは、 R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、同じかまたは異なり得る、 R^{11} から選択される1つまたは2つの置換基で任意選択により置換されるオキサゾリジン、イミダゾリン、ピペリジン、モルホリン、インドール、インドリン、またはベンズイミダゾール基を形成する。より好ましくは、 R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、同じかまたは異なり得る、 R^{11} から選択される1つまたは2つの置換基で任意選択により置換される -ラクタム、イミダゾリノン、イミダゾリン-ジオン、オキサゾリジノン、またはモルホリンを形成し、ここで、 R^{11} は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される。さらにより好ましくは、 R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、同じかまたは異なり得る、 R^{11} から選択される1つまたは2つの置換基で任意選択により置換される -ラクタム、イミダゾリノン、イミダゾリン-ジオン、オキサゾリジノン、またはモルホリン基を形成し、ここで、 R^{11} は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される。さらにより好ましくは、 R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、
-ラクタム、オキサゾリジノン、またはモルホリン基を形成する。

【0066】

本発明のいくつかの実施形態において、 R^8 および R^9 が、それらが結合される窒素原子と一緒に、N、OおよびSから個別に選択される1、2または3個のヘテロ原子（またはN、OおよびSから個別に選択される1個または2個のヘテロ原子、またはN、OおよびSから選択される単一のヘテロ原子）を任意選択によりさらに含む5員または6員非芳香族複素環を形成する場合、複素環は、 R^{11} から選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは2つの置換基で任意選択により置換され得る。

【0067】

本発明のいくつかの実施形態において、 R^8 および R^9 が、それらが結合される窒素原子と一緒に、N、OおよびSから個別に選択される1、2または3個のヘテロ原子を任意選択によりさらに含む7員~11員複素環式芳香族または非芳香族複素環式縮合環系を形成する場合、複素環式芳香族または複素環式縮合環系は、 R^{11} から選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは2つの置換基で任意選択により置換され得る。

【0068】

本発明のいくつかの実施形態において、 n が0である場合、 R^9 は、水素または C_2 -フルオロアルキルアミノカルボニルでなく； R^9 は、モノメチル置換されたフェニルまたはフェニルカルボニルでなく、または硫黄原子を含む5員複素芳香環を含むモノメチル置換されたヘテロアリアルカルボニル部分でなく；または R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、非置換モルホリニルを形成しない。

【0069】

R^{10} は、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、メトキシ、エトキシ、アリル、プロパルギル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメトキシを表す。好ましくは、 R^{10} は、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、または C_{1-4} アルキルを表す。より好ましくは、 R^{10} は、ハロゲンまたは C_{1-4} アルキルを表す。さらにより好ましくは、 R^{10} は、フルオロまたはメチルを表す。

【0070】

R^{11} は、水素、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-2} フルオロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-4} アルキル、アリル、またはプロパルギルを表す。 R^{11} はまた、複素環式部分におけるオキシ（例えば、単一のオキシ）を表し得る。好ましくは、 R^{11} は、水素、シアノ、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシであり、または R^{11} は、複素環式部分上に存在する場合、オキシであり得る。より好ましくは、 R^{11} は、メチルであり、または R^{11} は、複素環式部分上に存在する場合、オキシであり得る。

【0071】

好ましくは、式(I)で表される化合物は、表T1中(以下)に列挙される化合物1.1~1.32から選択される。

10

20

30

40

50

【0072】

好ましくは、本発明の式(I)で表される化合物において、nは、0または1であり；
A¹は、NまたはCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、またはメチルから選
択され；

A²は、CR²を表し、ここで、R²は、水素、ハロゲン、またはメチルであり；

R³およびR⁴は、両方とも水素を表し；

R⁵およびR⁶は、両方とも水素を表し；

R⁷は、水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アルキルアミノカルボ
ニルC₁₋₄アルキル、またはフェニルカルボニルから選択され；

Zは、-NR⁸R⁹であり、ここで、

R⁸は、水素またはメチルを表し；

R⁹は、水素、C₁₋₄アルキル、ヒドロキシルC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄ア
ルキル、C₁₋₂フルオロアルコキシC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アル
コキシカルボニル、C₃₋₆シクロアルキル、またはC₃₋₆シクロアルキルC₁₋₃アルキルか
ら選択される。

10

【0073】

より好ましくは、nは、0であり；

A¹は、CR¹を表し、ここで、R¹は、水素であり；

A²は、CR²を表し、ここで、R²は、水素であり；

R³およびR⁴は、両方とも水素を表し；

R⁷は、水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アルキルアミノカルボ
ニルC₁₋₄アルキル、またはフェニルカルボニルから選択され；

Zは、-NR⁸R⁹であり、ここで、

R⁸は、水素またはメチルを表し；

R⁹は、水素、C₁₋₄アルキル、ヒドロキシルC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄ア
ルキル、C₁₋₂フルオロアルコキシC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₁₋₄アル
コキシカルボニル、C₃₋₆シクロアルキル、またはC₃₋₆シクロアルキルC₁₋₃アルキルか
ら選択される。

20

【0074】

好ましくは、本発明の式(I)で表される化合物において、nは、0または1であり；
A¹は、NまたはCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、またはメチルから選
択され；

A²は、CR²を表し、ここで、R²は、水素、ハロゲン、またはメチルであり；

R³およびR⁴は、両方とも水素を表し；

R⁵およびR⁶は、両方とも水素を表し；

R⁷は、水素、C₁₋₄アルキルアミノカルボニルC₁₋₄アルキル、またはフェニルカルボ
ニルから選択され；

Zは、-NR⁸R⁹であり、ここで、

R⁸およびR⁹は、それらが結合される窒素原子と一緒に、シアノ、アミノ、ハロゲン、
ヒドロキシ、およびC₁₋₄アルキルから選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは
2つの置換基で任意選択により置換される -ラクタム、イミダゾリノン、イミダゾリン
-ジオン、オキサゾリジノン、またはモルホリンを形成する。

30

40

【0075】

より好ましくは、本発明の式(I)で表される化合物において、nは、0または1であ
り；

A¹は、NまたはCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、フルオロ、またはメチルから選
択され；

A²は、CR²を表し、ここで、R²は、水素、フルオロまたはメチルであり；

R³およびR⁴は、両方とも水素を表し；

R⁵およびR⁶は、両方とも水素を表し；

50

R^7 は、水素から選択され；

Zは、 $-NR^8R^9$ であり、ここで、

R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは2つの置換基で任意選択により置換される - ラクタム、イミダゾリノン、イミダゾリン - ジオン、オキサゾリジノン、またはモルホリンを形成する。

【0076】

好ましくは、本発明の式(I)で表される化合物において、nは、0または1であり；

A^1 は、Nまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲン、またはメチルから選択され；

A^2 は、 CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲン、またはメチルであり；

R^3 および R^4 は、両方とも水素を表し；

R^5 および R^6 は、両方とも水素を表し；

R^7 は、水素、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル C_{1-4} アルキル、またはフェニルカルボニルから選択され；

Zは、 $-NR^8R^9$ であり、ここで、

R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは2つの置換基で任意選択により置換されるインドールまたはインドレンを形成する。

【0077】

より好ましくは、本発明の式(I)で表される化合物において、nは、0であり；

A^1 は、Nまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲン、またはメチルから選択され；

A^2 は、 CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素であり；

R^3 および R^4 は、両方とも水素を表し；

R^7 は、水素であり；

Zは、 $-NR^8R^9$ であり、ここで、

R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは2つの置換基で任意選択により置換されるインドールまたはインドレンを形成する。

【0078】

本発明の化合物のさらなる実施形態において、nは、0または1であり；

A^1 は、 CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素またはフルオロであり；

A^2 は、 CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素であり；

R^3 および R^4 は、両方とも水素を表し、または R^3 は、フルオロであり、かつ R^4 は、水素であり；

R^5 および R^6 は、両方とも水素を表し、

R^7 は、水素であり；

R^8 は、水素またはメチルを表し；

R^9 は、メチルまたはジフルオロメトキシエチルから選択され、または R^8 および R^9 は、それらが結合される窒素原子と一緒に、シアノ、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、および C_{1-4} アルキルから選択される、同じかまたは異なり得る1つまたは2つの置換基で任意選択により置換される - ラクタム、オキサゾリジノン、またはモルホリン基を形成する。

【0079】

本発明の化合物は、式(Ia)または式(Ib)によって表される式(I)の化合物の鏡像異性体であり得、式中、 R^5 および R^6 は異なる。

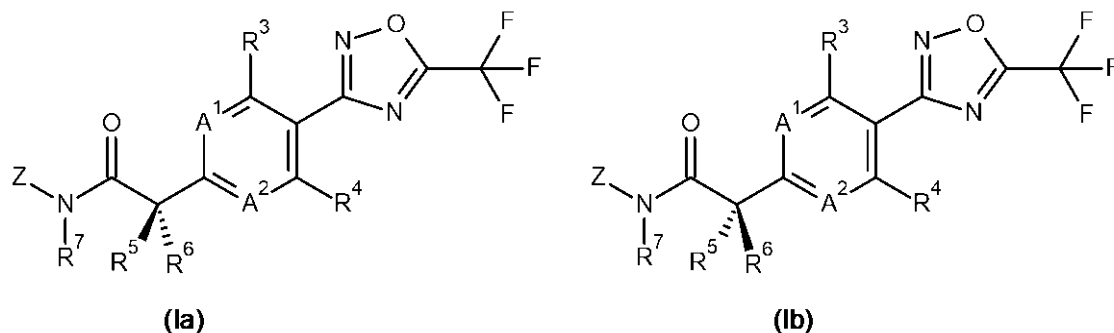
10

20

30

40

【化 1 0】



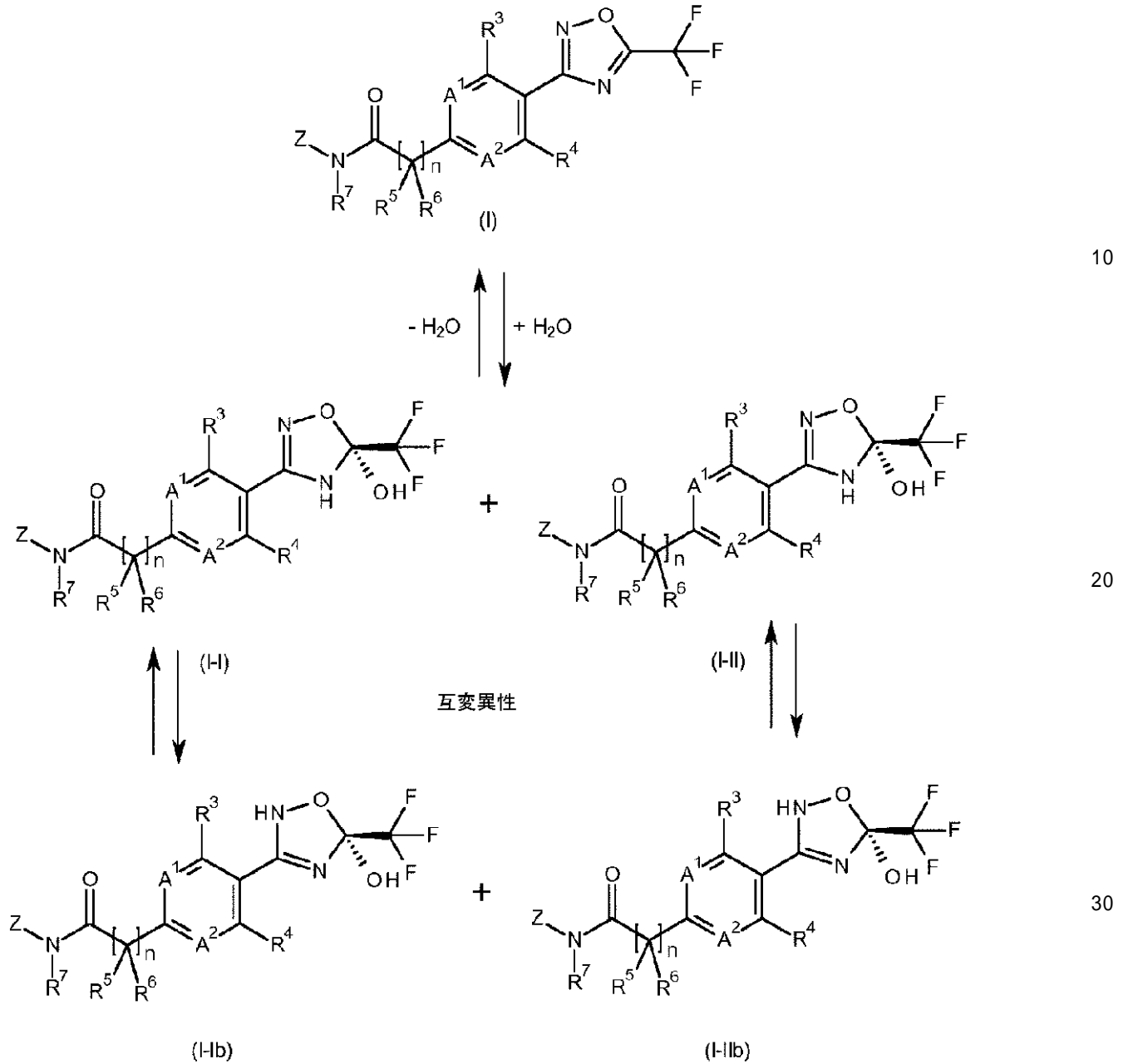
10

【 0 0 8 0】

水性媒体中にある場合、本発明に係る式 (I) の化合物が、 CF_3 -オキサジアゾールモチーフにおいて対応する共有結合的に水和した形態 (すなわち、以下に示される式 (I-I) および式 (I-II) の化合物) と可逆平衡状態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) の化合物に関する n 、 A^1 、 A^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Z 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、および R^{11} の表示は、一般に、式 (I-I) および式 (I-II) の化合物、ならびに下記の表 1.1 ~ 1.19 に表される化合物 n 、 A^1 、 A^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Z 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、および R^{11} 、または表 T1 (下記) に記載される化合物 1.1 ~ 1.32 の組み合わせの特定の開示に適用される。

20

【化 1 1】



10

20

30

40

50

【0081】

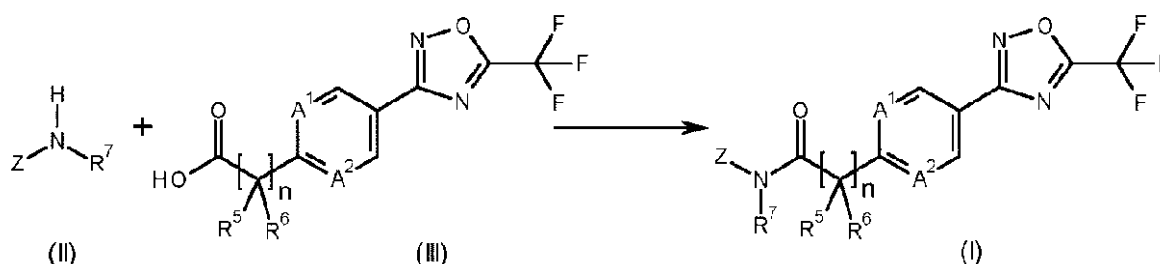
本発明の化合物は、以下のスキームに示されるように作製され得、ここで、特に記載しない限り、各変数の定義は、式 (I) の化合物について上記に定義されるとおりである。

【0082】

式 (I) の化合物は、式 (I I I) の化合物のカルボン酸官能基を活性化することにより式 (I I) の化合物および式 (I I I) の化合物によるアミドカップリング変換により、すなわち、好ましくは 25 ~ 100 の温度および任意選択により、トリエチルアミンまたは 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おいて、またはアミドカップリングについて文献に記載される条件下において、好ましくは好適な溶媒 (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) 中での式 (I I) の化合物による処理前に、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へと変換することによって通常起こるプロセスによって得ることができる。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 を参照されたい。これは、以下のスキーム1に示されている。式(III)の化合物は、公知の化合物から公知の方法によって作製され得るか、または市販されている。例えば、Liu, K. et al. J. Med. Chem. (2008), 51, 7843および国際公開第2013/008162号を参照されたい。式(II)の化合物は、公知の化合物であるかまたは市販されている。

【化12】



スキーム1

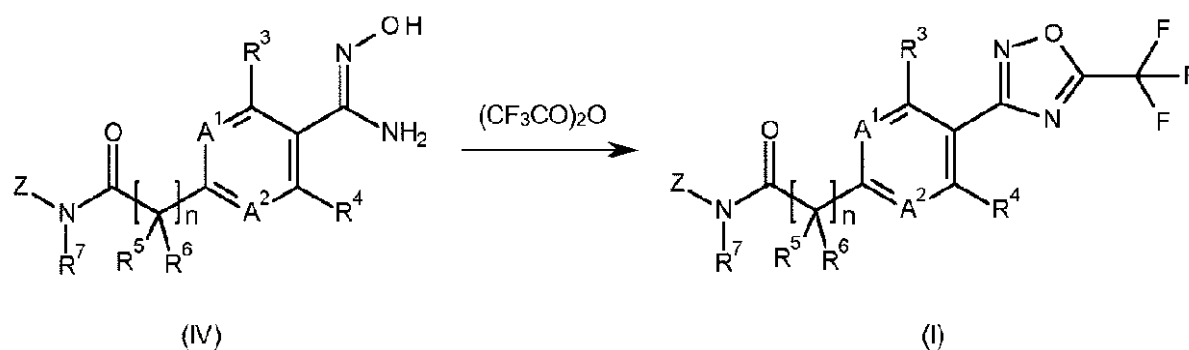
10

【0083】

あるいは、式(I)の化合物は、0 ~ 25 の温度において、テトラヒドロフランなどの好適な溶媒中での無水トリフルオロ酢酸による処理により、式(IV)の化合物から調製され得る。関連する例については、Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268を参照されたい。これは、スキーム2に示されている。

20

【化13】



スキーム2

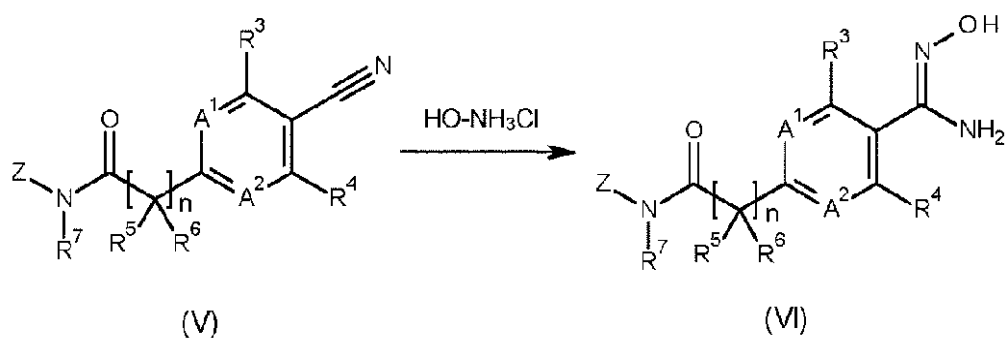
30

【0084】

式(VI)の化合物は、0 ~ 100 の温度において、メタノールなどの好適な溶媒中、炭酸ナトリウムなどの塩基の存在下で式(V)の化合物をヒドロキシルアミン塩酸塩で処理することにより、式(V)の化合物から調製され得る。関連する例については、Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268を参照されたい。これは、スキーム3に示されている。

40

【化14】



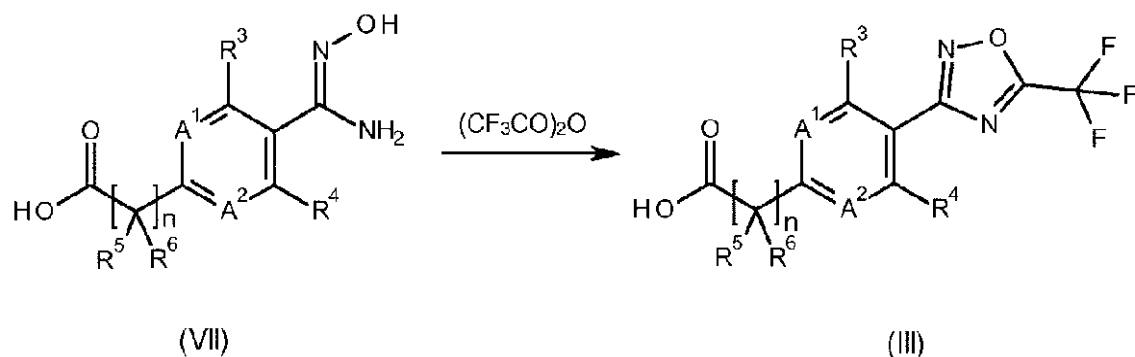
10

スキーム3

【0085】

式(VII)の化合物は、0 ~ 25 の温度において、テトラヒドロフランなどの好適な溶媒中での無水トリフルオロ酢酸による処理により、式(III)の化合物から調製され得る。関連する例については、Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268を参照されたい。これは、スキーム4に示されている。

【化15】



20

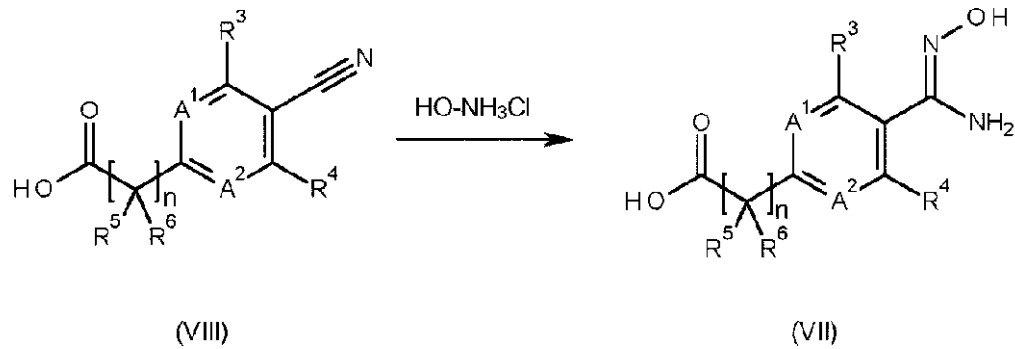
スキーム4

30

【0086】

式(VII)の化合物は、0 ~ 100 の温度において、メタノールなどの好適な溶媒中、炭酸ナトリウムなどの塩基の存在下で式(VII)の化合物をヒドロキシルアミン塩酸塩で処理することにより、式(III)の化合物から調製され得る。式(VII)の化合物は市販されている。関連する例については、Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268を参照されたい。これは、スキーム5に示されている。

【化 1 6】



スキーム5

10

【0087】

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。

【0088】

式(I)の化合物は、農業部門および関連する使用分野において、例えば、植物有害生物または非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物の防除に係る活性処方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、多くの栽培植物の保護に用いられ得る。式(I)の化合物は、有用な植物の異なる作物の植物または植物の一部(果実、花、葉、茎、塊茎、根)に生じる有害生物を阻害または駆除するために、他方では同時に後に成長する植物のこれらの部位も例えば植物病原性微生物から保護するために用いられることが可能である。

20

【0089】

本発明は、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り、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さらに関する。

30

【0090】

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き、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、使用される場合、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。

40

【0091】

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

50

殖体にも関する。

【0092】

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。

【0093】

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。

【0094】

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*)、ブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*)、B.ドチデア (*B. dothidea*)、B.オブツサ (*B. obtusa*) のボトリオスファエリア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、B.シネレア (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、C.アルビカンス (*C. albicans*)、C.グラブラータ (*C. glabrata*)、C.クルセイ (*C. krusei*)、C.ルシタニエ (*C. lusitaniae*)、C.パラプシロシス (*C. parapsilosis*)、C.トロピカリス (*C. tropicalis*) のカンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、セファロアスクスフラグラン (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp)、C.アラキジコラ (*C. arachidicola*) を含むセルコスポラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスפורジウムペルソナム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスפורウム属の一種 (*Cladosporium* spp)、クラビセプスプルブレア (*Claviceps purpurea*)、コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp)、C.ムサエ (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、クリプトコッカスネオフォルマン (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp)、エルウィニアアミロボラ (*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 (*Gaeu*

10

20

30

40

50

mannomyces graminis)、ギベレラフジクロイ (*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムムサルム (*Gloeosporium musarum*)、グロメラシングレート (*Glomerella cingulate*)、ガイグナルディアビドウェリイ (*Guignardia bidwellii*)、ギムノスポランギウムジュニペリ-ヴィルギニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginiana*)、ヘルミントスポリウム属の一種 (*Helminthosporium* spp)、ヘミレイア属の一種 (*Hemileia* spp)、*H. capsulatum*)を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、レプトグラフィウムリンデルギ (*Leptographium lindbergi*)、レベイルラタウリカ (*Leveillula taurica*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seeditiosum*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、ミクロスポルム属の一種 (*Microsporum* spp)、モニリニア属の一種 (*Monilinia* spp)、ムコール属の一種 (*Mucor* spp)、コムギ葉枯病菌 (*M. graminicola*)、*M. 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 theobroma*)、オフィオストマピセエ (*Ophiostoma piceae*)、パラコジディオイデス属の一種 (*Paracoccidioides* spp)、*P. digitatum*)、*P. italicum*)を含むペニシリウム属の一種 (*Penicillium* spp.)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium* spp)、*P. maydis*)、*P. philippinensis*)および *P. sorghi*)を含むペロノスクレロスポラ属の一種 (*Peronosclerospora* spp.)、ペロノスポラ属の一種 (*Peronospora* spp)、コムギふ枯病菌 (*Phaeosphaeria nodorum*)、ファコブソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フェリヌスイグニアルス (*Phellinus igniarius*)、フィアロフォラ属の一種 (*Phialophora* spp)、フォーマ属の一種 (*Phoma* spp)、ホモプシスビティコーラ (*Phomopsis viticola*)、*P. infestans*)を含むフィトフトラ属の一種 (*Phytophthora* spp.)、*P. halstedii*)、*P. viticola*)を含むプラスモパラ属の一種 (*Plasmopara* spp.)、プレオスポラ属の一種 (*Pleospora* spp.)、リンゴうどんこ病菌 (*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ボトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、シュードモナス属の一種 (*Pseudomonas* spp)、*P. cubensis*)、*P. humuli*)を含むシュードペロノスポラ属の一種 (*Pseudoperonospora* spp.)、シュードペジザトラケイフィラ (*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. hordei*)、*P. reconditata*)、*P. striiformis*)、*P. tritricina*)を含むプッシニア属の一種 (*Puccinia* spp.)、ピレノペジザ属の一種 (*Pyrenopeziza* spp)、ピレノフォラ属の一種 (*Pyrenophora* spp)、イネいもち病菌 (*P. oryzae*)を含むピリクラリア属の一種 (*Pyricularia* spp.)、*P. ultimum*)を含むピシウム属の一種 (*Pythium* spp.)、ラムラリア属の一種 (*Ramularia* spp)、リゾクトニア属の一種 (*Rhizocton*

10

20

30

40

50

ia spp)、リゾムコールプシルス (*Rhizomucor pusillus*)、
 リゾプスアリス (*Rhizopus arrhizus*)、リンコスפורウム属の一種
 (*Rhynchosporium* spp)、*S. アピオスペルムム* (*S. apiosper-
 mum*) および *S. プロリフィカンス* (*S. proliferans*) を含むセドス
 ポリウム属の一種 (*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムボミ (*Sc-
 hizothyrium pomi*)、スクレロチニア属の一種 (*Sclerotinia*
a 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 (*Sphaeroth-
 eca macularis*)、スファエロテカフスカ (*Sphaerotheca f-
 usca*) (スファエロテカフリギネア (*Sphaerotheca fuligine-
 a*))、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 (*St-
 emphylium* spp.)、ステレウムヒルスツム (*Stereum hir-
 sutum*)、タナテホルスクケメリス (*Thanatephorus cucumer-
 is*)、チエラビオプシスバシコラ (*Thielaviopsis basicola*)
 、チレチア属の一種 (*Tilletia* spp)、*T. ハルジアヌム* (*T. harzi-
 anum*)、*T. シュードコニングイ* (*T. pseudokoningii*)、*T. ヴイ*
リデ (*T. viride*) を含むトリコデルマ属の一種 (*Trichoderma* sp
 p.)、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*
r)、ウロシスチス (*Urocystis* spp)、ウスチラゴ属の一種 (*Ustil-
 ago* spp)、*V. イナエクアリス* (*V. inaequalis*) を含むベンチュリ
 ア属の一種 (*Venturia* spp.)、ベルチシリウム属の一種 (*Vertici-
 llium* spp) およびキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp
)。

【0095】

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、例えば針葉樹ならびに樹木注入、有害生物管理などに使用され得る。

【0096】

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

【0097】

10

20

30

40

50

「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り、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、H P P D抑制剤、A L S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、E P S P S（5 - エノール - ピロビル - シキメート - 3 - リン酸塩 - シンターゼ）抑制剤、G S（グルタミンシンターゼ）抑制剤またはP P O（プロトボルフィリノーゲン - オキシダーゼ）抑制剤など）に対する耐性がもたらされた有用な植物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）により、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、C l e a r f i e l d（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R o u n d u p R e a d y（登録商標）、H e r c u l e x I（登録商標）およびL i b e r t y L i n k（登録商標）で市販されているグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

10

【0098】

「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（B a c i l l u s）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も含むとも理解されるべきである。

【0099】

このような植物の例は、Y i e l d G a r d（登録商標）（C r y I A（b）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Y i e l d G a r d R o o t w o r m（登録商標）（C r y I I I B（b1）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Y i e l d G a r d P l u s（登録商標）（C r y I A（b）およびC r y I I I B（b1）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；S t a r l i n k（登録商標）（C r y 9（c）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；H e r c u l e x I（登録商標）（C r y I F（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（P A T）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）；N u C O T N 3 3 B（登録商標）（C r y I A（c）トキシンを発現する綿品種）；B o l l g a r d I（登録商標）（C r y I A（c）トキシンを発現する綿品種）；B o l l g a r d I I（登録商標）（C r y I A（c）およびC r y I I A（b）トキシンを発現する綿品種）；V I P C O T（登録商標）（V I Pトキシンを発現する綿品種）；N e w L e a f（登録商標）（C r y I I I Aトキシンを発現するジャガイモ品種）；N a t u r e G a r d（登録商標）A g r i s u r e（登録商標）G T A d v a n t a g e（G A 2 1グリホサート - 耐性形質）、A g r i s u r e（登録商標）C B A d v a n t a g e（B t 1 1コーン穿孔性害虫（C B）形質）、A g r i s u r e（登録商標）R W（コーンルートワーム形質）およびP r o t e c t a（登録商標）である。

20

30

【0100】

「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（B a c i l l u s）のバクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を有するよう、組換えDNA技術を用いることで形質転換された作物植物も含むと理解されるべきである。

40

【0101】

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（B a c i l l u s c e r e u s）またはバチルスポピリエ（B a c i l l u s p o p i l l i a e）由来の殺虫性タンパク質；または例えばC r y 1 A b、C r y 1 A c、C r y 1 F、C r y 1 F a 2、C r y 2 A b、C r y 3 A、C r y 3 B b 1もしくはC r y 9 C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（B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s）由来の殺虫性タンパク質、または例えばV i p 1、V i p 2、V i p 3もしくはV i p 3 Aといった栄養型殺虫性タンパク質（V i p）；またはフォトラブダスルミネセンス（P h o t o r h a b d u s l u m i n e s c e n s）、ゼノラブダスネマトフィルス（X e n o r h a b d u s n e m a t o p

50

hilus)などの例えばフォトラバダス属の一種(Photorhabdus spp.)もしくはゼノラバダス属の一種(Xenorhabdus spp.)といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質;サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ(wasp)トキシンおよび他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン;ストレプトミセス(Streptomyces)トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチンまたはマツユキソウレクチンなどの植物レクチン;アグルチニン;トリプシン抑制剤、セリントキシン分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パピイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤;リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サポ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。

10

20

30

40

50

【0102】

さらに、本発明に関連して、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシン、または例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質(Vip)とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシンおよび修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される(例えば、国際公開第02/15701号を参照されたい)。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号を参照されたい)。

【0103】

このようなトキシン、またはこのようなトキシンを合成可能な形質転換植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

【0104】

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

【0105】

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。

【0106】

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

ry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Starlink (登録商標) (Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Herculex I (登録商標) (Cry1Fa2トキシンおよび酵素ホスフィノトリシンN - アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種) ; NuCOTN 33B (登録商標) (Cry1Actトキシンを発現する綿品種) ; Bollgard I (登録商標) (Cry1Actトキシンを発現する綿品種) ; Bollgard II (登録商標) (Cry1Act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。

【0107】

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) 。 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。

【0108】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 Bt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Abトキシンのトランスジェニック発現により、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) 。 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。

【0109】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 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。

【0110】

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。

【0111】

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。

【0112】

10

20

30

40

50

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

【0113】

7. Monsanto Europe S.A. 270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium 製 NK603 x MON810 トウモロコシ、登録番号 C/GB/02/M3/03。遺伝子操作品種 NK603 および MON810 を交配させることによる従来交配型ハイブリッド トウモロコシ 10
品種からなる。NK603 x MON810 トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種 (Agrobacterium sp.) の菌株 CP4 から得られるタンパク質 CP4 EPSPS をトランスジェニック発現し、これにより、除草剤 Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性が付与され、また、バチルスチューリングエンシス (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) から得られる Cry1Ab トキシンをトランスジェニック発現し、これにより、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

【0114】

本明細書において用いられるとき、「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 20
となる圃場を意味する。これは、土壌、種子および実生、ならびに確立した植生を含む。

【0115】

「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。

【0116】

「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 30
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。

【0117】

式 I の化合物は、そのままの形態で、または好ましくは配合技術分野において簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。この目的のためにこれらは、公知の様式で乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能もしくは希釈可能な溶液または懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物、および例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティングまたは掛け流しなどの適用方法が、意図される目的およびその時点での状況に応じて選択される。組成物はまた、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダまたは粘着剤、ならびに肥料、微量元素の供給源、または特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤を含むしてもよい。 40

【0118】

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。

【0119】

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 50

に消泡剤および結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用では、これらの濃縮物は水中で希釈され、通常、処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性処方成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0120】

水和剤は、水または他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された活性処方成分を含有する。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%の活性処方成分と少量の湿潤剤、分散剤または乳化剤とを含有する。

【0121】

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。使用では、これらの濃縮物は水または他の液体中に分散され、通常、処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性処方成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0122】

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、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウムおよび他の有機もしくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は、通常、5%~25%の活性処方成分を含有し、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。

【0123】

粉剤は、活性処方成分と、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。

【0124】

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

【0125】

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、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における活性処方成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って活性処方成分が微

10

20

30

40

50

細に分離された形態に散布される加圧散布機も用いられ得る。

【0126】

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。

【0127】

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

【0128】

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。

【0129】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体および固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は、通常、使用される際、0.1%~15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性または高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネート塩；ノニルフェノール-C_{sub}.18エトキシレートなどのアルキルフェノール-アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール-C_{sub}.16エトキシレートなどのアルコール-アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレン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

ルオレ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。

【0130】

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

【0131】

さらに加えて、他の殺生性活性処方成分または組成物を本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法において用い、および本発明の組成物と同時にまたは順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる活性処方成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、または例えば、噴霧タンク中で一緒に混合されてもよい。これらのさらなる殺生性活性処方成分は、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。

【0132】

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

【0133】

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。

【0134】

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、必要に応じて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。

【0135】

式(I)の化合物は、活性処方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。

【0136】

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・殺カビ性活性処方成分を含んでいてもよい。

【0137】

式(I)の化合物は、組成物における唯一の活性処方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

10

20

30

40

50

1種以上の追加の活性処方成分と混合されてもよい。追加の活性処方成分は、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。

【0138】

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

10

20

【0139】

好適な追加の活性処方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-ジメチル-5-p-トリルイミダゾール-1-スルホンアミド、N-アリル-4,5-ジメチル-2-トリメチルシリルチオフエン-3-カルボキサミド、N-(1-シアノ-1,2-ジメチルプロピル)-2-(2,4-ジクロロフェノキシ)プロピオンアミド、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

30

40

50

-イル) - シクロヘプタノール、2 - (1 - t - ブチル) - 1 - (2 - クロロフェニル)
 - 3 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール、2', 6' -
 ジブromo - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4' - トリフルオロメチル - 1, 3
 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、1 - イミダゾリル - 1 - (4' - クロロフェノ
 キシ) - 3, 3 - ジメチルブタン - 2 - オン、メチル(E) - 2 - [2 - [6 - (2 - シ
 アノフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル] 3 - メトキシアクリレート、
 メチル(E) - 2 - [2 - [6 - (2 - チオアミドフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオ
 キシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 - [6 - (2 -
 フルオロフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル(E) - 2 - [2 - [6 - (2, 6 - ジフルオロフェノキシ)ピリミジン -
 4 - イルオキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 - [3 - (ピリミジン - 2 - イルオキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル(E) - 2 - [2 - [3 - (5 - メチルピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェ
 ノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 - [3 - (フェ
 ニル - スルホニルオキシ)フェノキシ]フェニル - 3 - メトキシアクリレート、メチル
 (E) - 2 - [2 - [3 - (4 - ニトロフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メト
 キシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 - フェノキシフェニル] - 3 - メトキシアク
 リレート、メチル(E) - 2 - [2 - (3, 5 - ジメチル - ベンゾイル)ピロール - 1 -
 イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 - (3 - メトキシフェノキ
 シ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 [2 - (2 - フェニルエ
 テン - 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 -
 (3, 5 - ジクロロフェノキシ)ピリジン - 3 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メ
 チル(E) - 2 - (2 - (3 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ)フェノキシ
)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - (2 - [3 - (- ヒド
 ロキシベンジル)フェノキシ]フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) -
 2 - (2 - (4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオキシ)フェニル) - 3 - メトキシアク
 リレート、メチル(E) - 2 - [2 - (3 - n - プロピルオキシ - フェノキシ)フェニル
] 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 - (3 - イソプロピルオキシフェ
 ノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [2 - [3 - (2
 - フルオロフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E)
 - 2 - [2 - (3 - エトキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、
 メチル(E) - 2 - [2 - (4 - 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

10

20

30

40

50

ル] - フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2 - [6 - (2 -
 n - プロピルフェノキシ) - 1, 3, 5 - トリアジン - 4 - イルオキシ] フェニル} - 3
 - メトキシアクリレート、メチル (E), (E) - 2 - { 2 - [(3 - ニトロフェニル)
 メチルオキシミノメチル] フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、3 - クロロ - 7 - (2 -
 アザ - 2, 7, 7 - トリメチル - オクタ - 3 - エン - 5 - イン)、2, 6 - ジクロロ
 - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、3 - ヨード - 2 - プロピニ
 ルアルコール、4 - クロロフェニル - 3 - ヨードプロパルギルホルマル、3 - プロモ - 2
 , 3 - ジヨード - 2 - プロペニルエチルカルバメート、2, 3, 3 - トリヨードアリルア
 ルコール、3 - プロモ - 2, 3 - ジヨード - 2 - プロペニルアルコール、3 - ヨード - 2
 - プロピニル n - ブチルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ヘキシルカルバ
 メート、3 - ヨード - 2 - プロピニルシクロヘキシル - カルバメート、3 - ヨード - 2 -
 プロピニルフェニルカルバメート; 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 - チアジア
 ジン - 2 - チオン、N - (2 - p - クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリド
 、アシベンゾラル、アシペタックス、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジモルフ、
 アリシン、アリルアルコール、アメトクトラジン、アミスルブロム、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、ベナラキシル、ベナラ
 キシル - M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントルロン、ベンチアバリカル
 ブ、ベンチアゾール、塩化ベンザルコニウム、ベンザマクリル、ベンザモルフ、ベンゾヒ
 ドロキサム酸、ベンゾビンジフルピル、ベルベリン、ベトキサジン、ピロキサゾール、ピ
 ナパクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、ピキサフェン、プラストサイ
 ジン - S、ボスカリド、プロモタロニル、プロムコナゾール、ピリメート、ブチオベ
 ート、ブチルアミン多硫酸カルシウム、カプタホール、キャプタン、カルバモルフ、カルベ
 ンダジム、カルベンダジムクロリドレート、カルボキシ、カルプロパミド、カルボン、
 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、クロルフエナゾール、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
 ルドール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
 ゴファミド、シクラファミド、シクロヘキシミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シ
 ベンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、デカフェン
 チン、デヒドロ酢酸、ジ - 2 - ピリジルジスルフィド 1, 1' - ジオキシド、ジクロフル
 アニド、ジクロメジン、ジクロン、ジクロラン、ジクロロフェン、ジクロゾリン、ジクロ
 ブトラゾール、ジクロシメット、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾ
 コート、ジフルメトリム、O, O - ジ - イソ - プロピル - S - ベンジルチオホスフェート
 、ジメフルアゾール、ジメタクロン、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモ
 ール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノブトン、ジノカップ、ジノクトン、ジノペ
 ントン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジスルフィラ
 ム、ジタリムホス、ジチアノン、ジチオエーテル、ドデシルジメチル塩化アンモニウム、
 ドデモルフ、ドジチン、ドジン、ドグアジン、ドラゾキソロン、エジフェンホス、エネス
 トロブリン、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモ
 ール、エトキシキン、エチリシン、エチル (Z) - N - ベンジル - N ([メチル (メチル -
 チオエチリデンアミノ - オキシカルボニル) アミノ] チオ) - - アラニナト、エトリジ

10

20

30

40

50

アゾール、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェナ
 リモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェ
 ノキサニル、フェンピクロニル、フェンピコキサミド、フェンプロビジン、フェンプロビ
 モルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキシド、フェ
 ルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキソニル、フルメトベル (flumetover)、フルモルフ、フルピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フルトリマ
 ザール、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミ
 ド、フルタニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルペット、
 ホルムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、フルカル
 バニル、フルコナゾール、ルフラール、フルメシクロックス、フロファネート、グリオジ
 ン、グリセオフラビン、グアザチン、ハラクリネート、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサク
 ロロブタジエン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキシルチオホス、ヒドラル
 ガフェン、ヒドロキシイソキサゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、
 イミベンコナゾール、イミノクタジン、三酢酸イミノクタジン、イネジン、ヨードカルブ
 、イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イプロベンホス、イブロジオン、イ
 プロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、イソピラザム
 、イソチアニル、イソバレジオン、イソパムホス、カスガマイシン、クレソキシム - メチ
 ル、LY186054、LY211795、LY248908、マンコゼブ、マンジプロ
 パミド、マンネブ、メベニル、メカルピンジド、メフェノキサム、メフェントリフルコナ
 ザール、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、塩化第一水銀、メブチルジノカップ
 、メトラキシル、メトラキシル - M、メタム、メタゾキシロン、メトコナゾール、メタス
 ルホカルブ、メタフロキサム、臭化メチル、ヨウ化メチル、メチルイソチオシアネート、
 メチラム、メチラム - 亜鉛、メトミノストロビン、メトラフェノン、メツルホバクス、ミ
 ルネブ、モロキシジン、マイクロブタニル、マイクロゾリン、ナーバム、ナタミシン、ネオア
 ソジン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロスチレン、ニトロタル - イソ - プ
 ロピル、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、有機水銀化合物、オリザストロビン、
 オストール、オキサジキシル、オキサスルフロン、オキシシン銅、オキシリン酸、オクスボ
 コナゾール、オキシカルボキシシン、パリノール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペン
 シクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンチオピラド、フェナマクリル
 、フェナジンオキシド、ホスジフェン、ホセチル - A1、リン酸、フタリド、ピコキシス
 トロビン、ピベラリン、ポリカルバメート、ポリオキシシンD、ポリオキシリム、ポリラム
 、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパミジン、プロパモカルブ、プロ
 ピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコ
 ナゾール、ピジフルメトフェン、ピラカルボリド、ピラクロストロビン、ピラメトロスト
 ロビン、ピラオキシストロビン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリジニトリル、ピリフ
 ェノックス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピロキロン、ピロキシクロール、ピロキシ
 フル、ピロールニトリン、第4級アンモニウム化合物、キナセトール、キナザミド、キン
 コナゾール、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、ラベンザゾール、サント
 ニン、セダキサ、シルチオファミ、シメコナゾール、シブコナゾール、5塩化石炭酸ナ
 トリウム、ソラテノール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、スルトロペン、
 テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テトラコナゾ
 ール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン、チフルザミド、2 - (チオシア
 ノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオフアネート - 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ビン、トリフ
 ルマゾール、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウル
 バシド、パリダマイシン、パリフェナレート、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。

【0140】

10

20

30

40

50

本発明の化合物はまた、駆虫薬薬剤との組み合わせで用いられ得る。このような駆虫薬としては、欧州特許第357460号明細書、欧州特許第444964号明細書および欧州特許第594291号明細書に記載されているとおり、イベルメクチン、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エピリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチンおよびミルベマイシン誘導体などの化合物の大環式ラクトンクラスから選択される化合物が挙げられる。追加の駆虫薬としては、米国特許第5015630号明細書、国際公開第9415944号および国際公開第9522552号に記載されているものなどの半合成および生合成アベルメクチン/ミルベマイシン誘導体が挙げられる。追加の駆虫薬としては、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オキシフェンダゾール、オキシベンダゾール、パルベンダゾール、およびこのクラスの他の構成要素などのベンズイミダゾールが挙げられる。追加の駆虫薬としては、イミダゾチアゾール、およびテトラミソール、レバミソール、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、オキサ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プランテルなどのセストサイド (cestocide) が挙げられる。

10

【0141】

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

20

【0142】

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

30

【0143】

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。

【0144】

本発明の化合物は、例えば国際公開第95/19363号または国際公開第04/72086号に記載のものといったテルペンアルカロイドであって、特にこれらに開示の化合物との組み合わせで用いられ得る。

【0145】

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。

40

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

50

ン - メチル、パラオキソン、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロバホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダペンチオン、キナルホス、スルプロホス、テムホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルピンホス、チメトン (thimeton)、トリアゾホス、トリクロルホン、パミドチオン。

【 0 1 4 6 】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - sec - ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルパリル、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。

10

【 0 1 4 7 】

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

20

【 0 1 4 8 】

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、メトブレン (S - メトブレンを含む)、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成抑制剤：スピロジクロフェン。

30

【 0 1 4 9 】

他の抗寄生虫薬：アセキノシル、アミトラズ、A K D - 1 0 2 2、A N S - 1 1 8、アザジラクチン、バチルスチューリングエンシス (Bacillus thuringiensis)、ベンサルタップ、ピフェナゼート、ピナパクリル、プロモプロピレート、B T G - 5 0 4、B T G - 5 0 5、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、D B I - 3 2 0 4、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、ジノブトン、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、M T I - 8 0 0、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、I K I - 2 2 0、カネマイト、N C - 1 9 6、ニームガード、ニジノルテルフラン、ニテンピラム、S D - 3 5 6 5 1、W L - 1 0 8 4 7 7、ピリダリル、プロパルギット、プロトリフェンブト、ピメトロジン (pymethrozine)、ピリダベン、ピリミジフェン、N C - 1 1 1 1、R -

40

50

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。

【0150】

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

10

【0151】

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。

【0152】

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

【0153】

式(I)の化合物と活性成分との以下の混合物が好ましい。「TX」という略記は、表1.1~1.19(下記)または表T1(下記)に記載の化合物からなる群から選択される1種の化合物を意味する。

20

【0154】

石油(628)+TXからなる物質の群から選択される補助剤、

1,1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール(IUPAC名)(910)+TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1059)+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセドアミド(IUPAC名)(1295)+TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン(IUPAC名)(981)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセキノシル(3)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、-シベルメトリン(202)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドフルメト[CCN]+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミトン(875)+TX、シュウ酸水素アミトン(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アラマイト(881)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、AVI 382(化合物コード)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888)+TX、アゾシクロチン(46)+TX、アゾトエート(889)+TX、ベノミル(62)+TX、ベノキサホス[CCN]+TX、ベンゾキシメート(71)+TX、安息香酸ベンジル(IUPAC名)[CCN]+TX、ピフェナゼート(74)+TX、ピフェントリン(76)+TX、ピナバクリル(907)+TX、プロフェンバレレート+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホス-エチル(921)+TX、プロモプロピレート(94)+TX、ブプロフェジン(99)+TX、プトカルボキシム(103)+TX、プトキシカルボキシム(104)+TX、ブチルピリダベン+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、カルボフェノチオン(947)+TX、CGA 50'439(開発コード)(125)+TX、キノメチオナト(126)+TX、クロルベンシド(959)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルム塩酸塩(964)+TX、クロルフエナピル(130)+TX、クロルフエネトール(968)+TX、クロルフエンソン(970)+TX、クロルフエ

30

40

50

ンスルフィド(971)+TX、クロルフェンビンホス(131)+TX、クロロベンジ
 レート(975)+TX、クロロメブホルム(977)+TX、クロロメチウロン(97
 8)+TX、クロロプロピレート(983)+TX、クロルピリホス(145)+TX、
 クロルピリホス-メチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、シネリン
 I(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリン(696)+TX、クロ
 フェンテジン(158)+TX、クロサンテル[CCN]+TX、クマホス(174)+
 TX、クロタミトン[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クフラネブ
 (1013)+TX、シアントエート(1020)+TX、シフルメトフェン(CAS登
 録番号:400882-07-7)+TX、シハロトリン(196)+TX、シヘキサチ
 ン(199)+TX、シベルメトリン(201)+TX、DCPM(1032)+TX、
 DDT(219)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン-O(103
 7)+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(2
 26)+TX、ジアリホス(1042)+TX、ジアジノン(227)+TX、ジクロフ
 ルアニド(230)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス+TX、ジコホ
 ル(242)+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジエノクロル(1071)+TX
 、ジメホックス(1081)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジナクチン(65
 3)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクス-ジクレキシソ(1089)+TX
 、ジノプトン(269)+TX、ジノカップ(270)+TX、ジノカップ-4[CCN
]+TX、ジノカップ-6[CCN]+TX、ジノクトン(1090)+TX、ジノペン
 トン(1092)+TX、ジノスルホン(1097)+TX、ジノテルボン(1098)
 +TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(1
 103)+TX、ジスルフィラム[CCN]+TX、ジスルホトン(278)+TX、D
 NOC(282)+TX、ドフェナピン(1113)+TX、ドラメクチン[CCN]+
 TX、エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121)+TX、EPN(2
 97)+TX、エプリノメクチン[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(1
 142)+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、フェンブ
 ロパトリン(342)+TX、フェンピラド+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(36
 0)+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、FM
 C 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、ホルムバラネ
 ート(1193)+TX、-HCH(430)+TX、グリオジン(1205)+TX
 、ハルフェンプロックス(424)+TX、ヘプテノホス(432)+TX、ヘキサデシ
 ルシクロプロパンカルボキシレート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(121
 6)+TX、ヘキシチアゾクス(441)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(54
 2)+TX、イソカルボホス(473)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオ
 ホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473)+TX、イベルメクチン[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(5
 02)+TX、メホスホラン(1261)+TX、メスルフェン[CCN]+TX、メタ

10

20

30

40

50

クリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メトミル(531)+TX、臭化メチル(537)+TX、メトルカルブ(550)+TX、メビンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルマイシンオキシム[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[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[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(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(653)+TX、プロクロノール(1350)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロマシル(1354)+TX、プロバルギット(671)+TX、プロベタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロトエート(1362)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、キナルホス(711)+TX、キンチオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、RA-17(開発コード)(1383)+TX、ロテノン(722)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス+TX、セラメクチン[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[CCN]+TX、スルフルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、硫黄(754)+TX、SZI-121(開発コード)(757)+TX、フルバリネート(398)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、TEPP(1417)+TX、テルバム+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(653)+TX、テトラスル(1425)+TX、チアフェノックス+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオフアノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオキノックス(1436)+TX、ツリングエンシン[CCN]+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアラテン(1443)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン+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(653)+TX、バミドチオン(847)+TX、パニリプロール[CCN]およびYI-5302(化合物コード)+TXからなる物質の群から選択される殺ダニ剤、

ベトキサジン[CCN]+TX、ニオクタン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、硫酸銅(172)+TX、シプトリン[CCN]+TX、ジクロン(1052)+TX、ジクロロフェン(232)+TX、エンドタール(295)+TX、フェンチン(347)+TX、消石灰[CCN]+TX、ナーバム(566)+TX、キノクラミン(714)+TX、キノナミド(1379)+TX、シマジン(730)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TXからなる物質の群から選択される殺藻剤、

アバメクチン(1)+TX、クルホメート(1011)+TX、ドラメクチン[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エ

10

20

30

40

50

ブリノメクチン [CCN] + TX、イベルメクチン [CCN] + TX、ミルベマイシンオキシム [CCN] + TX、モキシデクチン [CCN] + TX、ピペラジン [CCN] + TX、セラメクチン [CCN] + TX、スピノサド (737) およびチオファネート (1435) + TX からなる物質の群から選択される駆虫薬、

クロラロース (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 (745) + TX からなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1 - ヒドロキシ - 1H - ピリジン - 2 - チオン (IUPAC 名) (1222) + TX、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC 名) (748) + TX、8 - ヒドロキシキノリン硫酸塩 (446) + TX、プロノポール (97) + TX、ニオクタン酸銅 (IUPAC 名) (170) + TX、水酸化銅 (IUPAC 名) (169) + TX、クレゾール [CCN] + TX、ジクロロフェン (232) + TX、ジピリチオン (1105) + TX、ドジシン (1112) + TX、フェナミノスルフ (1144) + TX、ホルムアルデヒド (404) + TX、ヒドラルガフェン [CCN] + TX、カスガマイシン (483) + TX、カスガマイシン塩酸塩水和物 (483) + TX、ニッケルピス (ジメチルジチオカルバメート) (IUPAC 名) (1308) + TX、ニトラピリン (580) + TX、オクチリノン (590) + TX、オキシリン酸 (606) + TX、オキシテトラサイクリン (611) + TX、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 [CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺バクテリア剤、

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) GV (12) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) (13) + TX、アムプリセイウス属の一種 (*Amblyseius spp.*) (19) + TX、アナグラファファルシフェラ (*Anagrapta falcifera*) NPV (28) + TX、アングルスアトムス (*Anagrus atomus*) (29) + TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) (33) + TX、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*) (34) + TX、シヨクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*) (35) + TX、オートグラファカリホルニカ (*Autographa californica*) NPV (38) + TX、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) (48) + TX、バチルススファエリクスネイデ (*Bacillus sphaericus Neide*) (学名) (49) + TX、バチルスチューリングゲンシスベルリナー (*Bacillus thuringiensis Berliner*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ビューベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) (53) + TX、ビューベリアブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (151) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (178) + TX、コドリング (*Cydia pomonella*) GV (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (2

10

20

30

40

50

12) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (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*) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (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*) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アクリズム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV および N. レコンテイ (*N. lecontei*) NPV (575) + TX、ヒメハナカメムシ属の一種 (*Orius* spp.) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカプシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナーネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (742) + TX、スタイナーネマカルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (742) + TX、スタイナーネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (742) + TX、スタイナーネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (742) + TX、スタイナーネマリオブラベ (*Steinernema riobrave*) (742) + TX、スタイナーネマリオブラビス (*Steinernema riobravensis*) (742) + TX、スタイナーネマスカプテリスキ (*Steinernema scapterisci*) (742) + TX、スタイナーネマ属の一種 (*Steinernema* spp.) (742) + TX、トリコグラマ属の一種 (*Trichogramma* spp.) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (844) およびベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecaniini*) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、

ヨードメタン (IUPAC 名) (542) および臭化メチル (537) + TX からなる物質の群から選択される土壌不毛剤、

アホレート [CCN] + TX、ピサジル [CCN] + TX、ブスルファン [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ [CCN] + TX、ヘルム [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 [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘンパ [CCN] + TX、チオテパ [CCN] + TX、トレタミン [CCN] およびウレデパ [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 - オールを伴う (E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテート (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 - オンを伴う 4 - メチルノナン - 5 - オール (IUPAC名) (544) + TX、 - マルチストリアチン [CCN] + TX、プレビコミン [CCN] + TX、コドレルア [CCN] + TX、コドレモン (167) + TX、キュールア (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 [CCN] + TX、4 - メチルオクタタン酸エチル (IUPAC名) (317) + TX、オイゲノール [CCN] + TX、フロンタリン [CCN] + TX、ゴシッブルア (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (421) + TX、グランドルア II (421) + TX、グランドルア III (421) + TX、グランドルア IV (421) + TX、ヘキササルア [CCN] + TX、イブスジエノール [CCN] + TX、イブセノール [CCN] + TX、ジャボニルア (481) + TX、リネアチン [CCN] + TX、リトルア [CCN] + TX、ルーブルア [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 [CCN] + TX、メチルオイゲノール (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 [CCN] + TX、オリクタールア (317) + TX、オストラモン [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (736) + TX、スルカトール [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 (839) + TX、トリメドルア B₁ (839) + TX、トリメドルア B₂ (839) + TX、トリメドルア C (839) およびトランクコール [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、フタル酸ジメチル [CCN] + TX、エチルヘキサジオール (1137) + TX、ヘキサアミド [CCN] + TX、メトキン - ブチル (1276) + TX、メチルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート [CCN] 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, 3 - ジクロロプロパンを伴う 1, 2 - 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 - ブトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (935) + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチルカルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1084) + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ) エタノール (IUPAC 名) (986) + TX、2 - クロロビニルジエチルホスフェート (IUPAC 名) (984) + TX、2 - イミダゾリドン (IUPAC 名) (1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC 名) (1246) + TX、2 - メチル (プロパ - 2 - イニル) アミノフェニルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1284) + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート (IUPAC 名) (1433) + TX、3 - プロモ - 1 - クロロプロパ - 1 - エン (IUPAC 名) (917) + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート (IUPAC 名) (1283) + TX、4 - メチル (プロパ - 2 - イニル) アミノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1285) + TX、5, 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート (IUPAC 名) (1085) + TX、アパメクチン (1) + TX、アセフェート (2) + TX、アセタミプリド (4) + TX、アセチオン [CCN] + TX、アセトブロール [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 [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、 - シペルメトリン (202) + TX、 - エクジソン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、アミジチオン (870) + TX、アミドチオエート (872) + TX、アミノカルブ (873) + TX、アミトン (875) + TX、シュウ酸水素アミトン (875) + TX、アミトラズ (24) + TX、アナバシン (877) + TX、アチダチオン (883) + TX、AVI 382 (化合物コード) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、アザジラクチン (41) + TX、アザメチホス (42) + TX、アジンホス - エチル (44) + TX、アジンホス - メチル (45) + TX、アゾトエート (889) + TX、パチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシ (52) + TX、バリウムヘキサフルオロシリケート [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、ベンスルタップ (66) + TX、 - シフルトリン (194) + TX、 - シペルメトリン (203) + TX、ピフェントリン (76) + TX、ピオアレトリン (78) + TX、ピオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (79) + TX、ピオエタノメトリン [CCN] + TX、ピオペルメトリン (908) + TX、ピオレスメトリン (80) + TX、ビス (2 - クロロエチル) エーテル (IUPAC 名) (909) + TX、ピストリフルロン (83) + TX、ホウ砂 (86) + TX、プロフェンバレレート + 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 [CCN] + TX、プロモホス (920) + TX、プロモホス - エチル (921) + TX、プフェンカルブ (924) + TX、ププロフェジン (99) + TX、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 + 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

10

20

30

40

50

ップ(123)+TX、カルタップ塩酸塩(123)+TX、セバジン(725)+TX
 、クロルピシクレン(960)+TX、クロルダン(128)+TX、クロルデコン(9
 63)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルム塩酸塩(964)
 +TX、クロルエトキシホス(129)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、ク
 ロルフェンピンホス(131)+TX、クロルフルアズロン(132)+TX、クロルメ
 ホス(136)+TX、クロロホルム[CCN]+TX、クロロピクリン(141)+T
 X、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(9
 94)+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+TX、シ
 スメトリン(80)+TX、クロシトリン+TX、クロエトカルブ(999)+TX、ク
 ロサンテル[CCN]+TX、クロチアニジン(165)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CC
 N]+TX、ヒ酸銅[CCN]+TX、オレイン酸銅[CCN]+TX、クマホス(17
 4)+TX、クミトエート(1006)+TX、クロタミトン[CCN]+TX、クロト
 キシホス(1010)+TX、クルホメート(1011)+TX、氷晶石(177)+T
 X、CS 708(開発コード)(1012)+TX、シアノフェンホス(1019)+
 TX、シアノホス(184)+TX、シアントエート(1020)+TX、シクレトリン
 [CCN]+TX、シクロプロトリン(188)+TX、シフルトリン(193)+TX
 、シハロトリン(196)+TX、シベルメトリン(201)+TX、シフェノトリン(2
 06)+TX、シロマジン(209)+TX、サイチオアート[CCN]+TX、d-
 リモネン[CCN]+TX、d-テトラメトリン(788)+TX、DAEP(1031
)+TX、ダゾメット(216)+TX、DDT(219)+TX、デカルボフラン(1
 034)+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、ジアジノン(227)+TX、ジカプトン(1050)+TX、ジ
 クロフェンチオン(1051)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス+T
 X、ジクレシル[CCN]+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジシクラニル(24
 4)+TX、ジエルドリン(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)+T
 X、ジロール[CCN]+TX、ジメフルトリン[CCN]+TX、ジメホックス(10
 81)+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(110
 2)+TX、ジスルホトン(278)+TX、ジチクロホス(1108)+TX、DNO
 C(282)+TX、ドラメクチン[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、エク
 ジステロン[CCN]+TX、EI 1642(開発コード)(1118)+TX、エマ
 メクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、EMPC(11
 20)+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[CCN]+TX、エスフェンバレート(302)+TX、エタホス[CCN]+
 TX、エチオフエンカルブ(308)+TX、エチオン(309)+TX、エチプロール
 (310)+TX、エトエート-メチル(1134)+TX、エトプロホス(312)+

10

20

30

40

50

TX、ギ酸エチル (IUPAC名) [CCN] + TX、エチル - DDD (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 + TX、フ
 ェンスルホチオン (1158) + TX、フェンチオン (346) + TX、フェンチオン -
 エチル [CCN] + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィプロニル (354)
 + TX、フロニカミド (358) + TX、フルベンジアミド (CAS . 登録番号: 272
 451 - 65 - 7) + TX、フルコフロン (1168) + TX、フルシクロクスロン (3
 66) + 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 (118
 4) + TX、FMC 1137 (開発コード) (1185) + TX、ホノホス (1191)
 + TX、ホルメタネート (405) + TX、ホルメタネート塩酸塩 (405) + TX、
 ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート (1193) + TX、ホスメチラン
 (1194) + TX、ホスピレート (1195) + TX、ホスチアゼート (408) + TX
 X、ホスチエタン (1196) + TX、フラチオカルブ (412) + TX、フレトリン (1
 200) + 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 (4
 25) + TX、HCH (430) + TX、HEOD (1070) + TX、ヘプタクロル (1
 211) + 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、ハイドロブレン (445) + TX、ヒキンカ
 ルブ (1223) + TX、イミダクロプリド (458) + TX、イミプロトリン (460)
 + TX、インドキサカルブ (465) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542)
 + TX、IPSP (1229) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イソベンザン
 (1232) + TX、イソカルボホス (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 (4
 72) + 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 (I
 UPAC名) (473) + TX、イソプロチオラン (474) + TX、イソチオエート (1
 244) + TX、イソキサチオン (480) + TX、イベルメクチン [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、幼虫ホルモンI [CCN] + TX、幼虫ホルモンII [CCN
] + TX、幼虫ホルモンIII [CCN] + TX、ケレバン (1249) + TX、キノブ
 レン (484) + TX、 - シハロトリン (198) + TX、ヒ酸鉛 [CCN] + TX、
 レピメクチン (CCN) + TX、レプトホス (1250) + TX、リンダン (430) +
 TX、リリムホス (1251) + TX、ルフエヌロン (490) + TX、リチダチオン (1
 253) + TX、m - クメニルメチルカルバメート (IUPAC名) (1014) + T
 X、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) + TX、マラチオン (492) + T
 X、マロノベン (1254) + TX、マジドックス (1255) + TX、メカルバム (5
 02) + 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、メスルフエンホス (126
 3) + TX、メタフルミゾン (CCN) + TX、メタム (519) + TX、メタム - カリ
 ウム (519) + TX、メタム - ナトリウム (519) + TX、メタクリホス (1266
) + TX、メタミドホス (527) + TX、メタンスルホニルフルオリド (IUPAC /

10

20

30

40

50

ケミカルアブストラクツ名) (1268) + TX、メチダチオン(529) + TX、メチ
 オカルブ(530) + TX、メトクロトホス(1273) + TX、メトミル(531) +
 TX、メトプレ(532) + TX、メトキン - ブチル(1276) + TX、メトリン
 (533) + TX、メトキシクロル(534) + TX、メトキシフェノジド(535) +
 TX、臭化メチル(537) + TX、メチルイソチオシアネート(543) + TX、メチ
 ルクロホルム [CCN] + TX、塩化メチレン [CCN] + TX、メトフルトリン [C
 CN] + TX、メトルカルブ(550) + TX、メトキサジアゾン(1288) + TX、
 メビンホス(556) + TX、メキサカルベート(1290) + TX、ミルベメクチン(5
 57) + TX、ミルマイシンオキシム [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 [CCN] + TX、ナフトロホス [CCN] + T
 X、ナレド(567) + TX、ナフトレン (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1
 303) + TX、NC - 170 (開発コード) (1306) + TX、NC - 184 (化
 合物コード) + TX、ニコチン(578) + TX、硫酸ニコチン(578) + TX、ニフ
 ルリジド(1309) + TX、ニテンピラム(579) + TX、ニチアジン(1311)
 + TX、ニトリラカルブ(1313) + TX、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体(13
 13) + TX、NNI - 0101 (化合物コード) + TX、NNI - 0250 (化合物コ
 ード) + TX、ノルニコチン (慣用名) (1319) + TX、ノバルロン(585) + T
 X、ノピフルムロン(586) + TX、O - 5 - ジクロロ - 4 - ヨードフェニルO - エチ
 ルエチルホスホノチオエート (IUPAC名) (1057) + TX、O , O - ジエチルO
 - 4 - メチル - 2 - オキソ - 2H - クロメン - 7 - イルホスホロチオエート (IUPAC
 名) (1074) + TX、O , O - ジエチルO - 6 - メチル - 2 - プロピルピリミジン -
 4 - イルホスホロチオエート (IUPAC名) (1075) + TX、O , O , O' , O'
 - テトラプロピルジチオピロホスフェート (IUPAC名) (1424) + TX、オレイ
 ン酸 (IUPAC名) (593) + TX、オメトエート(594) + TX、オキサミル(6
 02) + TX、オキシデメトン - メチル(609) + TX、オキシデプロホス(132
 4) + TX、オキシジスルホトン(1325) + TX、pp' - DDT(219) + TX
 、パラ - ジクロロベンゼン [CCN] + TX、パラチオン(615) + TX、パラチオン
 - メチル(616) + TX、ペンフルロン [CCN] + TX、ペンタクロロフェノール(6
 23) + TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル (IUPAC名) (623) + TX、
 ベルメトリン(626) + TX、石油(628) + TX、PH 60 - 38 (開発コード
) (1328) + TX、フェンカプトン(1330) + TX、フェノトリン(630) +
 TX、フェントエート(631) + TX、ホレート(636) + TX、ホサロン(637
) + TX、ホスホラン(1338) + TX、ホスメット(638) + TX、ホスニコロル
 (1339) + TX、ホスファミドン(639) + TX、ホスフィン (IUPAC名) (6
 40) + TX、ホキシム(642) + TX、ホキシム - メチル(1340) + TX、ピ
 リメタホス(1344) + TX、ピリミカルブ(651) + TX、ピリミホス - エチル(1
 345) + 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) (13
 47) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、チオシアン酸カリウム [CCN] + T
 X、プラレトリン(655) + TX、プレコセンI [CCN] + TX、プレコセンII [C
 CN] + TX、プレコセンIII [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(1
 354) + TX、プロメカルブ(1355) + TX、プロパホス(1356) + TX、プ
 ロベタンホス(673) + TX、プロボクサー(678) + TX、プロチダチオン(13
 60) + 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(6
 89) + TX、ピラゾホス(693) + TX、ピレスメトリン(1367) + TX、ピ
 レトリンI(696) + TX、ピレトリンII(696) + TX、ピレトリン(696)
 + TX、ピリダベン(699) + TX、ピリダリル(700) + TX、ピリダフェンチオ

10

20

30

40

50

ン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、
 ピリプロキシフェン(708)+TX、カッシア[CCN]+TX、キナルホス(7
 11)+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[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(1387)+TX、リアノジン(慣用名)(138
 7)+TX、サバジラ(725)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス+
 TX、セラメクチン[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、SI-
 0205(化合物コード)+TX、SI-0404(化合物コード)+TX、SI-04
 05(化合物コード)+TX、シラフルオフエン(728)+TX、SN 72129(10
 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、ナトリウムヘキサフルオロシリケート(1400)+TX、ナトリウ
 ムペントクロロフェノキシド(623)+TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名)(
 1401)+TX、チオシアン酸ナトリウム[CCN]+TX、ソファミド(1402)
 +TX、スピノサド(737)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、スピロテト
 ラマト(CCN)+TX、スルコフロン(746)+TX、スルコフロン-ナトリウム(
 746)+TX、スルフルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、フ
 ッ化スルフルル(756)+TX、スルプロオス(1408)+TX、タール油(758 20
)+TX、-フルバリネート(398)+TX、タジムカルブ(1412)+TX、T
 DE(1414)+TX、テブフェノジド(762)+TX、テブフェンピラド(763
)+TX、テブピリムホス(764)+TX、テフルベンズロン(768)+TX、テフ
 ルトリン(769)+TX、テメホス(770)+TX、TEPP(1417)+TX、
 テラレトリン(1418)+TX、テルバム+TX、テルブホス(773)+TX、テト
 ラクロロエタン[CCN]+TX、テトラクロルピホス(777)+TX、テトラメト
 リン(787)+TX、-シペルメトリン(204)+TX、チアクロプリド(791
)+TX、チアフエノックス+TX、チアメトキサム(792)+TX、チクロホス(1
 428)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオシクラム(798)+TX
 、シュウ酸水素チオシクラム(798)+TX、チオジカルブ(799)+TX、チオフ 30
 アノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオナジン(1434)+
 TX、チオスルタップ(803)+TX、チオスルタップ-ナトリウム(803)+TX
 、ツリングエンシン[CCN]+TX、トルフェンピラド(809)+TX、トラロメト
 リン(812)+TX、トランスフルトリン(813)+TX、トランスペルメトリン(
 1440)+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアザメート(818)+TX
 、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン+TX、トリクロルホン(824)+T
 X、トリクロルメタホス-3[CCN]+TX、トリクロロナート(1452)+TX、
 トリフェノホス(1455)+TX、トリフルムロン(835)+TX、トリメタカルブ
 (840)+TX、トリブレン(1459)+TX、パミドチオン(847)+TX、パ
 ニリプロール[CCN]+TX、ベラトリジン(725)+TX、ベラトリン(725) 40
 +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+TX、リン
 化亜鉛(640)+TX、ゾラプロホス(1469)およびZXI 8901(開発コー
 ド)(858)+TX、シアントラニリプロール[736994-63-19+TX、ク
 ロラントラニリプロール[500008-45-7]+TX、シエノピラフェン[560
 121-52-0]+TX、シフルメトフェン[400882-07-7]+TX、ピリ
 フルキナゾン[337458-27-2]+TX、スピネトラム[187166-40-
 1+187166-15-0]+TX、スピロテトラマト[203313-25-1]+
 TX、スルホキサフロール[946578-00-3]+TX、フルフィプロール[70
 4886-18-0]+TX、メベルフルトリン[915288-13-0]+TX、テ 50

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、フルキサメタミド (国際公開第 2 0 0 7 / 0 2 6 9 6 5 号) + T X、 - メトフ
 ルトリン [2 4 0 4 9 4 - 7 1 - 7] + T X、 - モンフルオロトリン [1 0 6 5 1 2 4
 - 6 5 - 3] + T X、フルアザインドリジン [1 2 5 4 3 0 4 - 2 2 - 7] + T X、クロ
 ロプラレトリン [3 9 9 5 7 2 - 8 7 - 3] + T X、フルキサメタミド [9 2 8 7 8 3 -
 2 9 - 3] + T X、シハロジアミド [1 2 6 2 6 0 5 - 5 3 - 7] + T X、チオキサザフ
 ェン [3 3 0 4 5 9 - 3 1 - 9] + T X、プロフラニリド [1 2 0 7 7 2 7 - 0 4 - 5]
 + T X、フルフィプロール [7 0 4 8 8 6 - 1 8 - 0] + T X、シクラニリプロール [1
 0 3 1 7 5 6 - 9 8 - 5] + T X、テトラニリプロール [1 2 2 9 6 5 4 - 6 6 - 3] +
 T X、グアジピル (国際公開第 2 0 1 0 / 0 6 0 2 3 1 号に記載される) + T X、シクロ
 キサブリド (国際公開第 2 0 0 5 / 0 7 7 9 3 4 号に記載される) + T X、
 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、ニクロサミド (5 7 6) + T X、ニクロサミド -
 オールアミン (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 - ジブロモ - 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, 3 - ジクロロプロ
 ペンを伴う 1, 2 - ジクロロプロパン (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 (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
 + 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 (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 + T X、ジメトエート (2 6 2) + T X、ドラメクチン [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 [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 + 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 [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 [C C N] + T
 X、キネチン (2 1 0) + T X、メカルフォン (1 2 5 8) + T X、メタム (5 1 9) +

TX、メタム - カリウム (519) + TX、メタム - ナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム [CCN] + TX、モキシデクチン [CCN] + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (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 + TX、セラメクチン [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム + 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 + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン + TX、キシレノール [CCN] + TX、YI - 5302 (化合物コード) およびゼアチン (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 (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) ベンゼンシルホンアミド (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 (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 - ブトキシエトキシ) エチルピペロニレート (IUPAC 名) (934) + TX
 、5 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エノン (IUPAC 名) (903) + TX、
 ネロリドールを伴うファルネソール (324) + TX、MB - 599 (開発コード) (498) + TX、MGK 264 (開発コード) (296) + TX、
 ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタル (1343) + TX、
 プロピル異性体 (1358) + TX、S421 (開発コード) (724) + TX、
 セサメックス (1393) + TX、セサモリン (1394) およびスルホキシド (1406) + TX からなる物質の群から選択される共力剤、
 アントラキノン (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、ジアジノン (227) + TX、ジシクロペンタジエン (化学名) (1069) + TX、
 グアザチン (422) + TX、グアザチン酢酸

10

20

30

40

50

塩(422) + TX、メチオカルブ(530) + TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23) + TX、チラム(804) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、ナフテン酸亜鉛[CCN]およびジラム(856) + TXからなる物質の群から選択される動物忌避剤、

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

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

ならびにアザコナゾール(60207-31-0) + TX、ベンゾピンジフルピル[10

72957-71-1] + TX、ピテルタノール[70585-36-3] + TX、プロ

ムコナゾール[116255-48-2] + TX、シプロコナゾール[94361-06

-5] + TX、ジフェノコナゾール[119446-68-3] + TX、ジニコナゾール

[83657-24-3] + TX、エポキシコナゾール[106325-08-0] + T

X、フェンブコナゾール[114369-43-6] + TX、フルキンコナゾール[13

6426-54-5] + TX、フルシラゾール[85509-19-9] + TX、フルト

リアホール[76674-21-0] + TX、ヘキサコナゾール[79983-71-4

] + TX、イマザリル[35554-44-0] + TX、イミベンコナゾール[8659

8-92-7] + TX、イブコナゾール[125225-28-7] + TX、メトコナゾ

ール[125116-23-6] + TX、マイクロブタニル[88671-89-0] + T

X、ペフラゾエート[101903-30-4] + TX、ペンコナゾール[66246-

88-6] + TX、プロチオコナゾール[178928-70-6] + TX、ピリフェノ

ックス[88283-41-4] + TX、プロクロラズ[67747-09-5] + TX

、プロピコナゾール[60207-90-1] + TX、シメコナゾール[149508-

90-7] + TX、テブコナゾール[107534-96-3] + TX、テトラコナゾ

ール[112281-77-3] + TX、トリアジメホン[43121-43-3] + TX

、トリアジメノール[55219-65-3] + TX、トリフルミゾール[99387-

89-0] + TX、トリチコナゾール[131983-72-7] + TX、アンシミド

ール[12771-68-5] + TX、フェナリモル[60168-88-9] + TX、ヌ

アリモル[63284-71-9] + TX、ブピリメート[41483-43-6] + T

X、ジメチリモール[5221-53-4] + TX、エチリモール[23947-60-

6] + TX、ドデモルフ[1593-77-7] + TX、フェンプロピジン[67306

-00-7] + TX、フェンプロピモルフ[67564-91-4] + TX、スピロキサ

ミン[118134-30-8] + TX、トリデモルフ[81412-43-3] + TX

、シプロジニル[121552-61-2] + TX、メバニピリム[110235-47

-7] + TX、ピリメタニル[53112-28-0] + TX、フェンピクロニル[74

738-17-3] + TX、フルジオキシニル[131341-86-1] + TX、ベナ

ラキシル[71626-11-4] + TX、フララキシル[57646-30-7] + T

X、メタラキシル[57837-19-1] + TX、R-メタラキシル[70630-1

7-0] + TX、オフレース[58810-48-3] + TX、オキサジキシル[777

32-09-3] + TX、ベノミル[17804-35-2] + TX、カルベンダジム[

10605-21-7] + TX、デバカルブ[62732-91-6] + TX、フベリダ

ゾール[3878-19-1] + TX、チアベンダゾール[148-79-8] + TX、

クロゾリネート[84332-86-5] + TX、ジクロゾリン[24201-58-9

] + TX、イブロジオン[36734-19-7] + TX、マイクロゾリン[54864-

61-8] + TX、プロシミドン[32809-16-8] + TX、ピンクロゾリン[5

0471-44-8] + TX、ボスカリド[188425-85-6] + TX、カルボキ

シン[5234-68-4] + TX、フェンフラム[24691-80-3] + TX、フ

ェンピコキサミド[517875-34-2] + TX、フルトラニル[66332-96

-5] + TX、メプロニル[55814-41-0] + TX、オキシカルボキシ

ン[5259-88-1] + TX、ペンチオピラド[183675-82-3] + TX、チフルザ

10

20

30

40

50

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、エネストロプリン { P
 r o c . B C P C , I n t . C o n g r . , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + 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、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
 、カプタン [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、ホルベット [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 [5 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + T X、オキシ銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 -
 6] + T X、ジノカップ [1 3 1 - 7 2 - 6] + T X、ニトロタール - イソプロピル [1
 0 5 5 2 - 7 4 - 6] + T X、エジフェンホス [1 7 1 0 9 - 4 9 - 8] + T X、イプロ
 ベンホス [2 6 0 8 7 - 4 7 - 8] + T X、イソプロチオラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1]
 + T X、ホスジフェン [3 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + T X、ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8
 - 6] + T X、トルクロホス - メチル [5 7 0 1 8 - 0 4 - 9] + T X、アシベンゾラル
 - S - メチル [1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2] + T X、アニラジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + T
 X、ベンチアパリカルブ [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + T X、ブラストサイジン - S [2
 0 7 9 - 0 0 - 7] + T X、キノメチオナト [2 4 3 9 - 0 1 - 2] + T X、クロロネブ
 [2 6 7 5 - 7 7 - 6] + T X、クロロタロニル [1 8 9 7 - 4 5 - 6] + T X、シフル
 フェナミド [1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3] + T X、シモキサニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7]
 + T X、ジクロン [1 1 7 - 8 0 - 6] + T X、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 -
 4] + T X、ジクロメジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + T X、ジクロラン [9 9 - 3 0 -
 9] + T X、ジエトフェンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9] + T X、ジメトモルフ [1 1
 0 4 8 8 - 7 0 - 5] + T X、S Y P - L I 9 0 (フルモルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 -
 9] + T X、ジチアノン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + T X、エタボキサム [1 6 2 6 5 0 -
 7 7 - 3] + T X、エトリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5 - 9] + T X、ファモキサドン [1
 3 1 8 0 7 - 5 7 - 3] + T X、フェナミドン [1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7] + T X、フ
 エノキサニル [1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + T X、フェンチン [6 6 8 - 3 4 - 8] + T
 X、フェリムゾン [8 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + T X、フルアジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 -
 6] + T X、フルオピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7] + T X、フルスルファミド [1
 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6] + T X、フェンヘキサミド [1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + T X、
 ホセチル - アルミニウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] + T X、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4
 - 4 4 - 1] + T X、イプロパリカルブ [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、オキサチアピプロリン [1 0 0 3 3 1 8 - 6 7 -
 9] + 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、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、プロキン
 アジド [1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4] + T X、ピロキロン [5 7 3 6 9 - 3 2 - 1] + T X

10

20

30

40

50

、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、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、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、セダキサン [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6] + 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 - 10
 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
 20
 キサミド [9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8] + T X からなる物質の群から選択される生物学的に有効な化合物 ; ランコトリオン [1 4 8 6 6 1 7 - 2 1 - 3] + T X、フロルピラウキシフェン [9 4 3 8 3 2 - 8 1 - 3]] + T X、イプフェントリフルコナゾール [1 4 1 7 7 8 2 - 0 8 - 1] + 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、キノフメリン [8 6 1 6 4 7 - 8 4 - 9]] + T X、クロロプラレトリン [3 9 9 5 7 2 - 8 7 - 3]] + T X、シハロジアミド [1 2 6 2 6 0 5 - 5 3 - 7]] + T X、フルアザインドリジン [1 2 5 4 3 0 4 - 2 2 - 7] + T X、フルキサメタミド [9 2 8 7 8 3 - 2 9 - 3] + T X、 - メトフルトリン [2 4 0 4 9 4 - 7 1 - 7]] + T X、 - モンフルオロトリン [1 0 6 5 1 2 4 - 6 5 - 3] + T X、ピジフルメトフェン [1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7] + T X、 - ビフェントリン [4 3 9 6 8 0 - 7 6 - 9] +
 30
 T X、プロフラニリド [1 2 0 7 7 2 7 - 0 4 - 5] + T X、ジクロロメゾチアズ [1 2 6 3 6 2 9 - 3 9 - 5] + T X、ジピメチトロン [1 6 1 1 4 - 3 5 - 5] + T X、ピラジフルミド [9 4 2 5 1 5 - 6 3 - 1] および - テフルトリン [3 9 1 6 3 4 - 7 1 - 2] + T X ; および

以下のものを含む微生物 : アシネトバクター・ルオフィイ (*A c i n e t o b a c t e r l w o f f i i*) + T X、アクレモニウム・アルタナツム (*A c r e m o n i u m a l t e r n a t u m*) + T X + T X、アクレモニウム・セファロスפורウム (*A c r e m o n i u m c e p h a l o s p o r i u m*) + T X + T X、アクレモニウム・ディオスピリ (*A c r e m o n i u m d i o s p y r i*) + T X、アクレモニウム・オブクラバツム (*A c r e m o n i u m o b c l a v a t u m*) + T X、リンゴコカクモンハマキ
 40
 顆粒病ウイルス (*A d o x o p h y e s o r a n a g r a n u l o v i r u s*) (*A d o x G V*) (*C a p e x* (登録商標)) + T X、アグロバクテリウム・ラジオバクター (*A g r o b a c t e r i u m r a d i o b a c t e r*) 菌株 K 8 4 (*G a l l t r o l - A* (登録商標)) + T X、アルテルナリア・アルテルナータ (*A l t e r n a r i a a l t e r n a t e*) + T X、アルテルナリア・カシアエ (*A l t e r n a r i a c a s s i a*) + T X、アルテルナリア・デストルエンズ (*A l t e r n a r i a d e s t r u e n s*) (*S m o l d e r* (登録商標)) + T X、アンペロマイセス・キスカリス (*A m p e l o m y c e s q u i s q u a l i s*) (*A Q 1 0* (登録商標)) + T X、アスペルギルス・フラブス (*A s p e r g i l l u s f l a v u s*) A F 3 6 (A F 3
 6 (登録商標)) + T X、アスペルギルス・フラブス (*A s p e r g i l l u s f l a*
 50

vus) NRRL 21882 (Aflaguard (登録商標)) + TX、アスペルギルス属 (Aspergillus spp.) + TX、アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans) + TX、アゾスピリルム属 (Azospirillum) + TX、(MicroAZ (登録商標)) + TX、TAZO B (登録商標)) + TX、アゾトバクター属 (Azotobacter) + TX、アゾトバクター・クロオコッカム (Azotobacter chroococcum) (Azotomeal (登録商標)) + TX、アゾトバクター (Azotobacter) シスト (cyst) (Bionatural Blooming Blossoms (登録商標)) + TX、パチルス・アミロリケファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens) + TX、セレウス菌 (Bacillus cereus) + TX、パチルス・キチノスポルス (Bacillus chitinosporus) 菌株 CM-1 + TX、パチルス・キチノスポルス (Bacillus chitinosporus) 菌株 AQ746 + TX、パチルス・リケニフォルミス (Bacillus licheniiformis) 菌株 HB-2 (Biostart (商標) Rhizoboost (登録商標)) + TX、パチルス・リケニフォルミス (Bacillus licheniiformis) 菌株 3086 (EcoGuard (登録商標)) + TX、Green Releaseaf (登録商標)) + TX、パチルス・サーキュランス (Bacillus circulans) + TX、パチルス・フィルムス (Bacillus firmus) (BioSafe (登録商標)) + TX、BioNem-WP (登録商標)) + TX、VOTiVO (登録商標)) + TX、パチルス・フィルムス (Bacillus firmus) 菌株 I-1582 + TX、パチルス・マセランス (Bacillus macerans) + TX、パチルス・マリスモルトウイ (Bacillus marismortui) + TX、パチルス・メガテリウム (Bacillus megaterium) + TX、パチルス・ミコイデス (Bacillus mycooides) 菌株 AQ726 + TX、パチルス・ポピリエ (Bacillus papillae) (Milky Spore Powder (登録商標)) + TX、パチルス・プミルス種 (Bacillus pumilus spp.) + TX、パチルス・プミルス (Bacillus pumilus) 菌株 GB34 (Yield Shield (登録商標)) + TX、パチルス・プミルス (Bacillus pumilus) 菌株 AQ717 + TX、パチルス・プミルス (Bacillus pumilus) 菌株 QST 2808 (Sonata (登録商標)) + TX、Ballad Plus (登録商標)) + TX、パチルス・スフェリカス (Bacillus spahericus) (VectoLex (登録商標)) + TX、パチルス属 (Bacillus spp.) + TX、パチルス属 (Bacillus spp.) 菌株 AQ175 + TX、パチルス属 (Bacillus spp.) 菌株 AQ177 + TX、パチルス属 (Bacillus spp.) 菌株 AQ178 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST 713 (CEASE (登録商標)) + TX、Serenade (登録商標)) + TX、Rhapsody (登録商標)) + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST 714 (JAZZ (登録商標)) + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 AQ153 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 AQ743 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST3002 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST3004 + TX、枯草菌変種アミロリケファシエンス (Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens) 菌株 FZB24 (Taegro (登録商標)) + TX、Rhizopro (登録商標)) + TX、パチルス・チューリゲンシス (Bacillus thuringiensis) Cry 2Ae + TX、パチルス・チューリゲンシス (Bacillus thuringiensis) Cry 1Ab + TX、パチルス・チューリゲンシス・アイザワイ (Bacillus thuringiensis aizawai) GC 91 (Agree (登録商標)) + TX、パチルス・チューリゲンシス・イスラエレンシス (Bacillus thuringiensis israelensis) (BMP123 (登録商標

10

20

30

40

50

) + TX、Aquabac (登録商標) + TX、VectoBac (登録商標) + TX
 、パチルス・チューリングェンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (Javelin (登録商標) + TX、Deliver
 (登録商標) + TX、CryMax (登録商標) + TX、Bonide (登録商標) + T
 X、Scutella WP (登録商標) + TX、Turilav WP (登録商標) +
 TX、Astuto (登録商標) + TX、Dipel WP (登録商標) + TX、Bio
 bit (登録商標) + TX、Foray (登録商標) + TX、パチルス・チューリンゲ
 ンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kursta*
ki) BMP 123 (Baritone (登録商標) + TX、パチルス・チューリン
 ゲンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurst*
aki) HD-1 (Bioprotect-CAF/3P (登録商標) + TX、パチルス
 ・チューリングェンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株 BD # 3
 2 + TX、パチルス・チューリングェンシス (*Bacillus thuringiens*
is) 菌株 AQ 52 + TX、パチルス・チューリングェンシス変種アイザワイ (*Bacil*
lus thuringiensis var. aizawai) (XenTari (登
 録商標) + TX、DiPel (登録商標) + TX、細菌種 (*bacteria spp*
.) (GROWMEND (登録商標) + TX、GROWSWEET (登録商標) + TX、
 Shootup (登録商標) + TX、クラビバクター・ミシガンシス (*Clavip*
acter michiganensis) のバクテリオファージ (*AgriPhage*
 (登録商標) + TX、Bakflor (登録商標) + TX、ビューベリア・バシアナ (
 20
Beauveria bassiana) (Beaugenic (登録商標) + TX、B
 rocaril WP (登録商標) + TX、ビューベリア・バシアナ (*Beauver*
ia bassiana) GHA (Mycotrol ES (登録商標) + TX、Myc
 otrol O (登録商標) + TX、BotaniGuard (登録商標) + TX、ビ
 ューベリア・ブロングニアルティ (*Beauveria brongniarti*) (
 Engerlingspilz (登録商標) + TX、Schweizer Beauve
 ria (登録商標) + TX、Melocont (登録商標) + TX、ビューベリア属 (
Beauveria spp.) + TX、灰色かび病菌 (*Botrytis ciner*
ia) + TX、ブラディリゾビウム・ジャポニクム (*Bradyrhizobium j*
aponicum) (TerraMax (登録商標) + TX、プレビパチルス・プレビ
 30
 ス (*Brevibacillus brevis*) + TX、パチルス・チューリングェンシ
 ス・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis tenebri*
onis) (Novodor (登録商標) + TX、BtBooster + TX、パーク
 ホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (Deny (登録
 商標) + TX、Intercept (登録商標) + TX、Blue Circle (登録
 商標) + TX、パークホルデリア・グラディ (*Burkholderia gladi*
i) + TX、パークホルデリア・グラディオリ (*Burkholderia gladi*
oli) + TX、パークホルデリア属 (*Burkholderia spp.*) + TX、
 セイヨウトゲアザミの菌 (*Canadian thistle fungus*) (CBH
 Canadian Bioherbicide (登録商標) + TX、カンジダ・ブチ
 40
 リ (*Candida butyri*) + TX、カンジダ・ファーマータ (*Candida*
famata) + TX、カンジダ・フルクタス (*Candida fructus*) + T
 X、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*) + TX、カンジダ・ギ
 リエルモンディ (*Candida guilliermondii*) + TX、カンジダ・
 メリビオシカ (*Candida melibiosica*) + TX、カンジダ・オレオフ
 イラ (*Candida oleophila*) 菌株 O + TX、カンジダ・パラプシロシス
 (*Candida parapsilosis*) + TX、カンジダ・ペリキュローザ (*C*
andida pelliculosa) + TX、カンジダ・プルケリマ (*Candid*
a pulcherima) + TX、カンジダ・レウカウフィ (*Candida re*
ukaufii) + TX、カンジダ・サイトアナ (*Candida saitoana*) 50

(Bio-Coat (登録商標) + TX、Biocure (登録商標)) + TX、カンジダ・サケ (Candida sake) + TX、カンジダ属 (Candida spp.) + TX、カンジダ・テヌイス (Candida tenuis) + TX、セデセア・ダビセ (Cedecea dravisae) + TX、セルロモナス・フラビゲナ (Cellulomonas flavigena) + TX、カエトミウム・コクリオイデス (Chaetomium cochliodes) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、カエトミウム・グロボスム (Chaetomium globosum) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、クロモバクテリウム・スブツガエ (Chromobacterium subtsugae) 菌株 PRAA4-1T (Grandevo (登録商標)) + TX、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (Cladosporium cladosporioides) + TX、クラドスポリウム・オキシスポルム (Cladosporium oxysporum) + TX、クラドスポリウム・クロロセファルム (Cladosporium chlorocephalum) + TX、クラドスポリウム属 (Cladosporium spp.) + TX、クラドスポリウム・テヌイシマム (Cladosporium tenuissimum) + TX、クロノスタキス・ロゼア (Clonostachys rosea) (EndoFine (登録商標)) + TX、コレトトリクム・アクタータム (Colletotrichum acutatum) + TX、コニオチリウム・ミニタンス (Coniothyrium minitans) (Cotans WG (登録商標)) + TX、コニオチリウム属 (Coniothyrium spp.) + TX、クリプトコッカス・アルビダス (Cryptococcus albidus) (YIELDPLUS (登録商標)) + TX、クリプトコッカス・フミコラ (Cryptococcus humicola) + TX、クリプトコッカス・インフィルモ・ミニアツス (Cryptococcus infirmo-miniatuus) + TX、クリプトコッカス・ローレンティ (Cryptococcus laurentii) + TX、クリプトフレビア・レウコトレタ顆粒病ウイルス (Cryptophlebia leucotreta granulovirus) (Cryptex (登録商標)) + TX、カプリアビダス・カンピネンシス (Cupriavidus campinensis) + TX、コドリングア顆粒病ウイルス (Cydia pomonella granulovirus) (CYD-X (登録商標)) + TX、コドリングア顆粒病ウイルス (Cydia pomonella granulovirus) (Madex (登録商標)) + TX、Madex Plus (登録商標) + TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標)) + TX、エピコウヤクタケ (Cylindrobasidium laeve) (Stumpout (登録商標)) + TX、シリンドロクラジウム属 (Cylindrocladium) + TX、デバリオマイセス・ハンセニイ (Debaryomyces hansenii) + TX、ドレクスレラ・ハワイエンシス (Drechslera hawaiiensis) + TX、エンテロバクター・クロアカ (Enterobacter cloacae) + TX、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae) + TX、エントモフトラ・ビルレンタ (Entomophthora virulenta) (Vektor (登録商標)) + TX、エピコッカム・ニグラム (Epicoccum nigrum) + TX、エピコッカム・パーバラセンス (Epicoccum purpurascens) + TX、エピコッカム属 (Epicoccum spp.) + TX、フィロバシディウム・フロリフォルメ (Filobasidium floriforme) + TX、フザリウム・アクミナツム (Fusarium acuminatum) + TX、フザリウム・クラミドスポルム (Fusarium chlamydosporum) + TX、フザリウム・オキシスポルム (Fusarium oxysporum) (Fusaclean (登録商標)) / Biofox C (登録商標)) + TX、フザリウム・プロリフェラツム (Fusarium proliferatum) + TX、フザリウム属 (Fusarium spp.) + TX、ガラクトマイセス・ゲオトリスム (Galactomyces geotrichum) + TX、グリオクラジウム・カテヌラツム (Gliocladium catenulatum

10

20

30

40

50

um) (Primastop (登録商標) + TX、Prestop (登録商標) + TX
 、グリオクラジウム・ロセウム (Gliocladium roseum) + TX、グリ
 オクラジウム属 (Gliocladium spp.) (SoilGard (登録商標)
) + TX、グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) (S
 oilgard (登録商標) + TX、顆粒病ウイルス (Granulovirus) (G
 ranupom (登録商標) + TX、ハロバチルス・ハロフィルス (Halobac
 illus halophilus) + TX、ハロバチルス・リトラリス (Haloba
 cillus litoralis) + TX、ハロバチルス・トルウエペリ (Halob
 acillus trueperi) + TX、ハロモナス属 (Halomonas sp
 p.) + TX、ハロモナス・スブグラシエスコラ (Halomonas subgla
 ciescola) + TX、ハロビブリオ・バリアビリス (Halovibrio va
 riabilis) + TX、ハンセニアスポラ・ウバルム (Hanseniaspora
 uvarum) + TX、オオタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa
 armigera nucleopolyhedrovirus) (Helicovex
 (登録商標) + TX、アメリカタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa
 zea nuclear polyhedrosis virus) (Gemstar
 (登録商標) + TX、イソフラボン - ホルモノネチン (Myconate (登録商標)
) + TX、クロエケラ・アピキュラータ (Kloeckera apiculata) +
 TX、クロエケラ属 (Kloeckera spp.) + TX、ラゲニジウム・ギガンテ
 ウム (Lagenidium giganteum) (Laginex (登録商標) +
 TX、レカニシリウム・ロンギスボルム (Lecanicillium longisp
 orum) (Vertiblast (登録商標) + TX、レカニシリウム・ムスカリウ
 ム (Lecanicillium muscarium) (Vertikil (登録商標
)) + TX、マイマイガ核多角体病ウイルス (Lymantria Dispar nu
 cleopolyhedrosis virus) (Disparvirus (登録商標
)) + TX、マリノコッカス・ハロフィルス (Marinococcus haloph
 ilus) + TX、メイラ・ゲウラコニギイ (Meira geulakonigii)
 + TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhizium anisopliae
) (Met52 (登録商標) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhiz
 ium anisopliae) (Destruxin WP (登録商標) + TX、メ
 チニコピア・フルクチコラ (Metschnikowia fruticola) (Sh
 emer (登録商標) + TX、メチニコピア・プルケリマ (Metschnikowi
 a pulcherima) + TX、ミクロドチウム・ジメルム (Microdoch
 ium dimerum) (Antibot (登録商標) + TX、ミクロモノスポラ・
 ケルレア (Micromonospora coerulea) + TX、ミクロスファエ
 ロプシス・オクラセ (Microsphaeropsis ochracea) + TX、
 ムスコドル・アルプス (Muscodor albus) 620 (Muscudor (登
 録商標) + TX、ムスコドル・ロセウス (Muscodor roseus) 菌株 A3
 - 5 + TX、ミコリザエ属 (Mycorrhizae spp.) (AMykor (登録
 商標) + TX、Root Maximizer (登録商標) + TX、クワ暗斑病菌 (M
 yrothecium verrucaria) 菌株 AARC - 0255 (DiTera
 (登録商標) + TX、BROS PLUS (登録商標) + TX、オフィオストマ・ピリ
 フェルム (Ophiostoma piliiferum) 菌株 D97 (Sylvanex
 (登録商標) + TX、ペシロマイセス・ファリノス (Paecilomyces f
 arinosus) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (Paecilomyce
 s fumosoroseus) (PFR - 97 (登録商標) + TX、PreFeRal
 (登録商標) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (Paecilomyces li
 nacinus) (Biostat WP (登録商標) + TX、ペシロマイセス・リラ
 シヌス (Paecilomyces lilacinus) 菌株 251 (MeloCon
 WG (登録商標) + TX、パエニバチルス・ポリミキサ (Paenibacillu

10

20

30

40

50

s polomyxa) + TX、パントエア・アグロメランス (*Pantoea agglomerans*) (BlightBan C9-1 (登録商標)) + TX、パントエア属 (*Pantoea spp.*) + TX、パスツールシア属 (*Pasteuria spp.*) (Econem (登録商標)) + TX、パスツールシア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウム・オーランティオグリセウム (*Penicillium aurantiogriseum*) + TX、ペニシリウム・ビライ (*Penicillium bilgai*) (Jumpstart (登録商標)) + TX、TagTeam (登録商標) + TX、ペニシリウム・ブレビコンパクトム (*Penicillium brevicompactum*) + TX、ペニシリウム・フレクエンタス (*Penicillium frequentans*) + TX、ペニシリウム・グリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) + TX、ペニシリウム・ブルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) + TX、ペニシリウム属 (*Penicillium spp.*) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオブシス・ギガンテア (*Phlebiopsis gigantea*) (Rotstop (登録商標)) + TX、リン酸塩溶解細菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) + TX、フィトファトラ・クリプトゲア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フィトファトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Devine (登録商標)) + TX、ピヒア・アノマラ (*Pichia anomala*) + TX、ピヒア・ギリエルモンディ (*Pichia guilermundii*) + TX、ピヒア・メンブラネファシエンス (*Pichia membranaefaciens*) + TX、ピヒア・オニキス (*Pichia onychis*) + TX、ピヒア・スチピチス (*Pichia stipites*) + TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) + TX、シュードモナス・オーレオファシエンス (*Pseudomonas aureofaciens*) (Spot-Less Biofungicide (登録商標)) + TX、シュードモナス・セバシア (*Pseudomonas cepacia*) + TX、シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) (AtEze (登録商標)) + TX、シュードモナス・コルガータ (*Pseudomonas corrugate*) + TX、蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標)) + TX、シュードモナス・プチダ (*Pseudomonas putida*) + TX、シュードモナス・リアクタンス (*Pseudomonas reactans*) + TX、シュードモナス属 (*Pseudomonas spp.*) + TX、シュードモナス・シリングア (*Pseudomonas syringae*) (Bio-Save (登録商標)) + TX、シュードモナス・ビリジフラバ (*Pseudomonas viridiflava*) + TX、蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) (Zequanox (登録商標)) + TX、シュードジマ・フロクロサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標)) + TX、プッシニア・カナリクラタ (*Puccinia canaliculata*) + TX、プッシニア・テラスペオス (*Puccinia thlaspeos*) (Wood Warrior (登録商標)) + TX、ピシウム・パレカンドルム (*Pythium paroecandrum*) + TX、ピシウム・オリガンドルム (*Pythium oligandrum*) (Polygandron (登録商標)) + TX、Polyversum (登録商標) + TX、ピシウム病菌 (*Pythium periplocum*) + TX、ラーネラ・アクアティリス (*Rhanelia aquatilis*) + TX、ラーネラ属 (*Rhanelia spp.*) + TX、リゾビウム属 (*Rhizobia*) (Dormal (登録商標)) + TX、Vault (登録商標) + TX、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) 菌株 AQ719 + TX、ロドスポリジウム・ディオボバタム (*Rhodospiridium diobovatum*) + TX、ロドスポリジウム・トル

10

20

30

40

50

ロイデス (*Rhodosporiidium toruloides*) + TX、ロドトルラ
 属 (*Rhodotorula spp.*) + TX、ロドトルラ・グルチニス (*Rhodo
 torula glutinis*) + TX、ロドトルラ・グラミニス (*Rhodotoru
 ula graminis*) + TX、ロドトルラ・ムチラギノーザ (*Rhodotoru
 la mucilagnosa*) + TX、ロドトルラ・ルブラ (*Rhodotorula
 rubra*) + TX、サッカロマイセス・セレビスエ (*Saccharomyces
 cerevisiae*) + TX、サリニコッカス・ロセウス (*Salinococcus
 roseus*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia mino
 r*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia minor*) (SAR
 RITOR (登録商標)) + TX、スキタリジウム属 (*Scytalidium spp
 .*) + TX、スキタリジウム・ウレジニコラ (*Scytalidium uredini
 cola*) + TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera e
 xigua nuclear polyhedrosis virus*) (Spod-X
 (登録商標)) + TX、Spexit (登録商標)) + TX、セラチア・マルセッセンス (*Serratia marcescens*) + TX、セラチア・プリムシカ (*Serra
 tia plymuthica*) + TX、セラチア属 (*Serratia spp.*) +
 TX、ソルダリア・フィミコーラ (*Sordaria fimicola*) + TX、エジ
 プトヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera littoralis nuc
 leopolyhedrovirus*) (Littovir (登録商標)) + TX、スポ
 ロボロマイセス・ロセウス (*Sporobolomyces roseus*) + TX、ス
 テノトロホモナス・マルトフィリア (*Stenotrophomonas maltop
 hilia*) + TX、ストレプトマイセス・ヒグロスコピクス (*Streptomyce
 s ahgrosopicus*) + TX、ストレプトマイセス・アルバドゥンカス (*Streptomyces albaduncus*) + TX、ストレプトマイセス・エク
 スフォリエーテス (*Streptomyces exfoliates*) + TX、ストレ
 プトマイセス・ガルバス (*Streptomyces galbus*) + TX、ストレブ
 トマイセス・グリセオプラヌス (*Streptomyces griseoplanus*
) + TX、ストレプトマイセス・グリセオビリデイス (*Streptomyces gr
 iseoviridis*) (Mycostop (登録商標)) + TX、ストレプトマイセ
 ス・リディカス (*Streptomyces lydicus*) (Actinovate
 (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (*Streptomyces
 lydicus*) WYEC-108 (Actinogrow (登録商標)) + TX、スト
 レプトマイセス・ビオラセウス (*Streptomyces violaceus*) + T
 X、チレチオブシス・ミノル (*Tilletiopsis minor*) + TX、チレチ
 オブシス属 (*Tilletiopsis spp.*) + TX、トリコデルマ・アスペレル
 ム (*Trichoderma asperellum*) (T34 Biocontrol
 (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ガムシイ (*Trichoderma gamsi
 i*) (Tenet (登録商標)) + TX、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichod
 erma atroviride*) (Plantmate (登録商標)) + TX、トリコ
 デルマ・ハマツム (*Trichoderma hamatum*) TH 382 + TX、ト
 リコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*Trichoderma harzianum
 rifai*) (Mycostar (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) T-22 (Trianium-P (登録商
 標)) + TX、PlantShield HC (登録商標) + TX、RootShield
 (登録商標) + TX、Trianium-G (登録商標) + TX、トリコデルマ・ハルジ
 アヌム (*Trichoderma harzianum*) T-39 (Trichodex
 (登録商標)) + TX、トリコデルマ・インハマタム (*Trichoderma inh
 amatum*) + TX、トリコデルマ・コニンギ (*Trichoderma konin
 gi*) + TX、トリコデルマ属 (*Trichoderma spp.*) LC 52 (S
 entinel (登録商標)) + TX、トリコデルマ・リゲノルム (*Trichoder*

ma lignorum) + TX、トリコデルマ・ロンギブラキアタム (*Trichoderma longibrachiatum*) + TX、トリコデルマ・ポリスポラム (*Trichoderma polysporum*) (Binab T (登録商標)) + TX、トリコデルマ・タキシ (*Trichoderma taxi*) + TX、トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*) + TX、トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*) (旧グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) GL-21) (Soil Guard (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*) + TX、トリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標)) + TX、トリコスポロン・ブルランス (*Trichosporon pullulans*) + TX、トリコスポロン属 (*Trichosporon spp.*) + TX、トリコセシウム属 (*Trichothecium spp.*) + TX、トリコセシウム・ロセウム (*Trichothecium roseum*) + TX、アカエガマノホタケ (*Typhula phacorrhiza*) 菌株 94670 + TX、アカエガマノホタケ (*Typhula phacorrhiza*) 菌株 94671 + TX、ウロクラジウム・アトラム (*Ulocladium atrum*) + TX、ウロクラジウム・オウデマンシイ (*Ulocladium oudemansii*) (Botry-Zen (登録商標)) + TX、トウモロコシ黒穂病菌 (*Ustilago maydis*) + TX、様々な細菌および補助微量栄養素 (Natural II (登録商標)) + TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標)) + TX、パーチシリウム・クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*) + TX、パーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) (Mycotal (登録商標)) + TX、Vertalec (登録商標) + TX、Vip 3Aa20 (VIPter (登録商標)) + TX、ビルジバチルス・マリスモルトイ (*Virgibacillus marismortui*) + TX、キサントモナス・カムペストリス病原型ポアエ (*Xanthomonas campestris pv. Poae*) (Camperico (登録商標)) + TX、ゼノラブダス・ボヴィエニイ (*Xenorhabdus bovienii*) + TX、ゼノラブダス・ネマトフィラ (*Xenorhabdus nematophilus*); および

以下のものを含む植物抽出物: 松油 (Retenol (登録商標)) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標)) + TX、AzaGuard (登録商標) + TX、MeemAzal (登録商標) + TX、Molt-X (登録商標) + TX、植物性の昆虫成長制御剤 (Botanical IGR) (Neemazad (登録商標)) + TX、Neemix (登録商標) + TX、ナタネ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標)) + TX、アメリカアリタソウ (*Chenopodium ambrosioides near ambrosioides*) (Requiem (登録商標)) + TX、キク属 (*Chrysanthemum*) 抽出物 (Crisant (登録商標)) + TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標)) + TX、シソ科植物 (Labiatae) の精油 (Botania (登録商標)) + TX、クローブローズマリーペパーミントおよびタイム油の抽出物 (Garden insect killer (登録商標)) + TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標)) + TX、ニンク + TX、レモングラス油 (GreenMatch (登録商標)) + TX、ニーム油 + TX、イヌハッカ (*Nepeta cataria*) (キャットニップ油) + TX、イヌハッカ (*Nepeta catarina*) + TX、ニコチン + TX、オレガノ油 (MossBuster (登録商標)) + TX、ゴマ科植物 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標)) + TX、除虫菊 + TX、シャボンノキ (*Quillaja saponaria*) (NemaQ (登録商標)) + TX、オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) (Regalia (登録商標)) + TX、Sakalia (登録商標) + TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標)) + TX、ミカン科植物 (Rutaceae) 抽出物 (Soleo (登録商標)) + TX、大豆

油 (Ortho ecosense (登録商標)) + TX、ティーツリー油 (Timorex Gold (登録商標)) + TX、タイム油 + TX、AGNIQUE (登録商標) MMF + TX、Bug Oil (登録商標) + TX、ローズマリーゴマペパーミントタイムおよびシナモン抽出物の混合物 (EF 300 (登録商標)) + TX、クローブローズマリーおよびペパーミント抽出物の混合物 (EF 400 (登録商標)) + TX、クローブペパーミントニンク油およびミントの混合物 (Soil Shot (登録商標)) + TX、カオリン (Screen (登録商標)) + TX、褐藻類の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標)) ; および

以下のものを含むフェロモン : クロネハイイロヒメハマキ (blackheaded fireworm) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標)) + TX、コドリング (Codling Moth) フェロモン (Paramount dispenser - (CM) / Isomate C-Plus (登録商標)) + TX、グレーブベリーモス (Grape Berry Moth) フェロモン (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、ハマキガ科のガ (Leafroller) フェロモン (3M MEC-LR Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、ムスカモン (Snip7 Fly Bait (登録商標)) + TX、Starbar Premium Fly Bait (登録商標)) + TX、ナシヒメシンクイ (Oriental Fruit Moth) フェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標)) + TX、スカシバガ科のガ (Peachtree Borer) フェロモン (Isomate - P (登録商標)) + TX、トマトピンワーム (Tomato Pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標)) + TX、Entostat 粉末 (ヤシの木からの抽出物) (Exosex CM (登録商標)) + TX、(E+TX, Z+TX, Z) - 3+TX, 8+TX, 11 テトラデカトリエニルアセテート + TX、(Z+TX, Z+TX, E) - 7+TX, 11+TX, 13 - ヘキサデカトリエナル + TX、(E+TX, Z) - 7+TX, 9 - ドデカジエンジエン - 1 - イルアセテート + TX、2 - メチル - 1 - ブタノール + TX、酢酸カルシウム + TX、Scenturion (登録商標) + TX、Biolure (登録商標) + TX、Check-Mate (登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオアート (Lavandulyl senecioate) ; および

以下のものを含む生物 (Macrobials) : アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Aphelinus - System (登録商標)) + TX、アセロファガス・パパイヤ (Acerophagus papaya) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia - System (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標)) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ (Ageniaspis citricola) + TX、アゲニアスピス・フシコリス (Ageniaspis fuscicollis) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標)) + TX、Andersoni - System (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標)) + TX、Spical (登録商標) + TX、アンブリセイウス・ククメリス (Amblyseius cucumeris) (Thripex (登録商標)) + TX、Bugline cucumeris (登録商標) + TX、アンブリセイウス・ファラキス (Amblyseius fallacis) (Fallacis (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・スウィルスキイ (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標)) + TX、Swirskii - Mite (登録商

標) + TX、アンブリセイウス・ウォマースレイ (Amblyseius womersleyi) (WomerMite (登録商標)) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (Amitus hesperidum) + TX、アナグルス・アトムス (Anagrus atomus) + TX、アナギルス・フスシベントリス (Anagrus fusciventris) + TX、アナギルス・カマリ (Anagrus kamali) + TX、アナギルス・ロエッキ (Anagrus loeckii) + TX、アナギルス・シユードコッカス (Anagrus pseudococci) (Citripar (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus benefices) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) + TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris - System (登録商標)) + TX、アフエリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標)) + TX、Aphiline (登録商標) + TX、アフエリヌス・アシキス (Aphelinus asychis) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (Ahipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Ervipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・ギフエンシス (Aphidius gifuensis) + TX、アフィジウス・マトリカリアエ (Aphidius matricariae) (Ahipar - M (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標)) + TX、アフィチス・リングナネンシス (Aphytis lingnanensis) + TX、アフィチス・メリヌス (Aphytis melinus) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウイイ (Aprostocetus hagenowii) + TX、アセタ・コリアリア (Atheta coriaria) (Staphyline (登録商標)) + TX、マルハナバチ属 (Bombus spp.) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Natupol Beehive (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeline (登録商標)) + TX、Tripol (登録商標) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (Cephalonomia stephanoderis) + TX、チノコルス・ニグリツス (Chilocorus nigritus) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysoline (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysopa (登録商標)) + TX、クリソペルラ・ルフイラブリス (Chrysoperla rufilabris) + TX、シロスピルス・インゲヌウス (Cirrospilus ingenuus) + TX、シロスピルス・クアドリストラアツス (Cirrospilus quadristriatus) + TX、シトロスチクス・フィロクニストイデス (Citrostichus phyllocnistoides) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (Closterocerus chamaeleon) + TX、クロステロセルス属 (Closterocerus spp.) + TX、コシドキシノイデス・ペルミヌツス (Coccidoxenoides permirutus) (Planopar (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウペリ (Coccophagus cowperi) + TX、コッコファグス・リシムニア (Coccophagus lycimnia) + TX、キアシサムライコマユバチ (Cotesia flavipes) + TX、コナガサムライコマユバチ (Cotesia plutellae) + TX、ツマアカオオテントウムシ (Cryptolaemus montrouzieri) (Cryptobug (登録商標)) + TX、Cryptoline (登録商標) + TX、キムネタマキスイ (Cybocephalus nipponicus) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) (Minusa (登録商標))

10

20

30

40

50

+TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Diminex* (登録商標)) +TX、デルファスツス・カタリナエ (*Delphastus catalinae*) (*Delphastus* (登録商標)) +TX、デルファスツス・プシルス (*Delphastus pusillus*) +TX、ディアカスミモルファ・クラウシイ (*Diachasmimorpha krausii*) +TX、ディアカスミモルファ・ロングカウダ (*Diachasmimorpha longicaudata*) +TX、ディアパルシス・ジュクンダ (*Diaparsis jucunda*) +TX、ディアホレンシルツス・アリガレンシス (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) +TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) +TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Miglyphus* (登録商標)) +TX、*Digline* (登録商標) +TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*DacDigline* (登録商標)) +TX、*Minex* (登録商標) +TX、ディベルシネルプス属 (*Diversinervus spp.*) +TX、エンカルシア・シトリナ (*Encarsia citrina*) +TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max* (登録商標)) +TX、*Encarline* (登録商標) +TX、*En-Strip* (登録商標) +TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Enermix* (登録商標)) +TX、エンカルシア・グアデロウパエ (*Encarsia guadeloupae*) +TX、エンカルシア・ハンティエンシス (*Encarsia haitiensis*) +TX、ホソヒラタアブ (*Episyrphus balteatus*) (*Syrphidend* (登録商標)) +TX、エルトモセリス・シフォニニ (*Eretmoceris siphonini*) +TX、エルトモセルス・カリフォルニクス (*Eretmocerus californicus*) +TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Ercal* (登録商標)) +TX、*Eretline e* (登録商標) +TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Bemimix* (登録商標)) +TX、エルトモセルス・ハヤチ (*Eretmocerus hayati*) +TX、エルトモセルス・ムンツス (*Eretmocerus mundus*) (*Bemipar* (登録商標)) +TX、*Eretline m* (登録商標) +TX、エルトモセルス・シフォニニ (*Eretmocerus siphonini*) +TX、エキソコムス・クアドリプスツラツス (*Exochomus quadripustulatus*) +TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Spidend* (登録商標)) +TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Feltiline* (登録商標)) +TX、フォピウス・アリサヌス (*Fopius arisanus*) +TX、フォピウス・セラチチボルス (*Fopius ceratitivorus*) +TX、ホルモノネチン (*Wireless Beehome* (登録商標)) +TX、アリガタシマアザミウマ (*Franklinothrips vespiiformis*) (*Vespop* (登録商標)) +TX、ガレンドロムス・オシデンタリス (*Galendromus occidentalis*) +TX、ゴニオズス・レグネリ (*Goniozus legneri*) +TX、シマメイガコマユバチ (*Habrobracon hebetor*) +TX、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*) (*HarmoBeetle* (登録商標)) +TX、ヘテロラブディティス属 (*Heterorhabditis spp.*) (*Lawn Patrol* (登録商標)) +TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) (*NemaShield HB* (登録商標)) +TX、*Nemaseek* (登録商標) +TX、*Terranem-Nam* (登録商標) +TX、*Terranem* (登録商標) +TX、*Larvanem* (登録商標) +TX、*B-Green* (登録商標) +TX、*NemAttack* (登録商標) +TX、*Nematop* (登録商標) +TX、ヘテロラブディティス・メジデイス (*Heterorhabditis megidis*) (*Nemasys H* (登録商標)) +TX、*BioNem H* (登録商標) +TX、*Exhibitline hm*

10

20

30

40

50

(登録商標) + TX、Larvanem - M (登録商標)) + TX、サカハチテントウ (Hippodamia convergens) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (Hypoaspis aculeifer) (Aculeifer - System (登録商標) + TX、Entomite - A (登録商標)) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspis miles) (Hypoline m (登録商標) + TX、Entomite - M (登録商標)) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Lbalia leucospoides) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (Lecanoideus floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンツス (Lemophagus errabundus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Leptomastidea abnormis) + TX、レプトマスチクス・ダクチロピィ (Leptomastix dactylopii) (Leptopar (登録商標)) + TX、レプトマスチクス・エポナ (Leptomastix epona) + TX、リンドルス・ロファンタエ (Lindorus lophanthae) + TX、リボレクシス・オレグマエ (Lipolexis oregmae) + TX、ルシリア・カエサル (Lucilia caesar) (Natufly (登録商標)) + TX、リシフレブス・テストケイペス (Lysiphlebus testaceipes) + TX、マクロロフス・カリギノス (Macrolophus caliginosus) (Mirical - N (登録商標) + TX、Macroline c (登録商標) + TX、Mirical (登録商標)) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (Mesoseiulus longipes) + TX、メタフィクス・フラプス (Metaphycus flavus) + TX、メタフィクス・ロウンズブリー (Metaphycus lounsburyi) + TX、ミクロムス・アングラツス (Micromus angulatus) (Milacewing (登録商標)) + TX、ミクロテリス・フラプス (Microterys flavus) + TX、ムスシディフラクス・ラボトレルス (Muscidifurax raptorellus) およびスパランギア・カメロニ (Spalangia cameroni) (Biopar (登録商標)) + TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (Neodryinus typhlocybae) + TX、ミヤコカブリダニ (Neoseiulus californicus) + TX、ネオセイウルス・クメリス (Neoseiulus cucumeris) (THRYPEX (登録商標)) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neoseiulus fallacis) + TX、ネシディオコリス・テヌイス (Nesideocoris tenuis) (NesidioBug (登録商標) + TX、Nesibug (登録商標)) + TX、オフィラ・アエネセンス (Ophyra aenescens) (Biofly (登録商標)) + TX、シノビハナカメムシ (Orius insidiosus) (Thripor - I (登録商標) + TX、Oriline i (登録商標)) + TX、エルヒメハナカメムシ (Orius laevigatus) (Thripor - L (登録商標) + TX、Oriline l (登録商標)) + TX、オリウス・マジュスクルス (Orius majusculus) (Oriline m (登録商標)) + TX、タイリクヒメハナカメムシ (Orius strigicollis) (Thripor - S (登録商標)) + TX、パウエシア・ジュニペロルム (Pauesia juniperorum) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pediobius foveolatus) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (Phasmarhabditis hermaphrodita) (Nemaslug (登録商標)) + TX、フィマスチクス・コフエア (Phymastichus coffea) + TX、フィトセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulus macropilus) + TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (Spidex (登録商標) + TX、Phytoline p (登録商標)) + TX、ポディスス・マクリベントリス (Podisus maculiventris) (Podisus (登録商標)) + TX、シューダクテオン・クルバツス (Pseudacteon curvatus) + TX、シューダクテオン・オブツス (Pseudacteon obtusus) + TX、シュ

10

20

30

40

50

ーダクテオン・トリクスピス (*Pseudacteon tricuspis*) + TX、
 シューダフィクス・マクリペンニス (*Pseudaphycus maculipennis*) + TX、
 シュードレプトマスティクス・メキシカーナ (*Pseudleptomastix mexicana*) + TX、
 サイラエファグス・ピロス (*Psyllaephagus pilosus*) + TX、
 サイタリア・コンコロール (*Psytalia concolor*) (複合体) + TX、
 クアドラスティクス属 (*Quadrastichus spp.*) + TX、
 リゾビウス・ロファンタエ (*Rhyzobius lophanthae*) + TX、
 ベダリアテントウ (*Rodolia cardinalis*) + TX、
 オオクビキレガイ (*Rumina decollate*) + TX、
 セミアラケア・ペティオラツス (*Semielacher petiolatus*) + TX、
 シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) (Ervibank (登録商標)) + TX、
 スタイナーネマ・カルボカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (Nematac C (登録商標)) + TX、
 Millemium (登録商標) + TX、
 BioNem C (登録商標) + TX、
 NemAttack (登録商標) + TX、
 Nemastar (登録商標) + TX、
 Capsanem (登録商標) + TX、
 スタイナーネマ・フェルティアエ (*Steinernema feltiae*) (NemaShield (登録商標)) + TX、
 Nemasys F (登録商標) + TX、
 BioNem F (登録商標) + TX、
 Steinernema-System (登録商標) + TX、
 NemAttack (登録商標) + TX、
 Nemaplus (登録商標) + TX、
 Exhibitline sf (登録商標) + TX、
 Scia-rid (登録商標) + TX、
 Entonem (登録商標) + TX、
 スタイナーネマ・クラッセイ (*Steinernema krausseii*) (Nemasys L (登録商標)) + TX、
 BioNem L (登録商標) + TX、
 Exhibitline srb (登録商標) + TX、
 スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (BioVector (登録商標)) + TX、
 BioVektor (登録商標) + TX、
 スタイナーネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (Nematac S (登録商標)) + TX、
 スタイナーネマ属 (*Steinernema spp.*) + TX、
 スタイナーネマチド属 (*Steinernematid spp.*) (Guardian Nematodes (登録商標)) + TX、
 ステトルス・punkチルム (*Stethorus punctillum*) (Stethorus (登録商標)) + TX、
 タマリキシア・ラジアタ (*Tamarixia radiate*) + TX、
 テトラスティクス・セティファー (*Tetrastichus setifer*) + TX、
 トリポビウス・セミルテウス (*Thripobius semiluteus*) + TX、
 トリムス・シネンシス (*Torymus sinensis*) + TX、
 タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (Tricholine b (登録商標)) + TX、
 タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (Tricho-Strip (登録商標)) + TX、
 ヨトウタマゴバチ (*Trichogramma evanescens*) + TX、
 トリコグラムマ・ミヌツム (*Trichogramma minutum*) + TX、
 アワノメイガタマゴバチ (*Trichogramma ostrinia*) + TX、
 トリコグラムマ・プラトネリ (*Trichogramma platneri*) + TX、
 トリコグラムマ・プレチオスム (*Trichogramma pretiosum*) + TX、
 キアシキイロヒラタヒメバチ (*Xanthopimpla stemmator*) ; および
 以下のものを含む他の生物学的製剤 : アブシジン酸 + TX、
 bioSea (登録商標) + TX、
 コンドロステレウム・ブルプレウム (*Chondrostereum purpureum*) (Chontrol Paste (登録商標)) + TX、
 コレトトリクム・グレオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*) (Collego (登録商標)) + TX、
 オクタン酸銅 (Cueva (登録商標)) + TX、
 デルタトラップ (Trapline d (登録商標)) + TX、
 エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) (ハーピン) (ProAct (登録商標))

10

20

30

40

50

標) + TX、Ni - H I B I T Gold CST (登録商標) + TX、リン酸第二鉄 (Ferr i - phosphat e) (Ferramol (登録商標) + TX、ファネルトラップ (Trapline y (登録商標) + TX、Gallex (登録商標) + TX、Grower ' s Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (Hom o - brassonolide) + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Wor ry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標)) + TX、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (Microctonus hyperodae) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (Mycoleptodiscus terrestr is) (Des - X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Ami 10 nomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (Thripline ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (MilStop p (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (Sil - Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil - X (登録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (Nosema locustae) (Semaspore Organic Grasshopper Control (登録商標)) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標) + TX、Rebell Amarillo (登録商標)) + TXおよびトラップ (Takitrapline y + b (登録商標)) + TX。 20

【0155】

例えば、[3878 - 19 - 1]といった活性成分の後ろの括弧中の参照番号は、ケミカルアブストラクツ登録番号を指す。上記の混合相手は公知である。活性成分が "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council] に含まれている場合、それらは、特定の化合物について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；例えば、化合物「アバメクチン」は、項目番号(1)に記載されている。「[CCN]」が、上記の特定の化合物に付けられている場合、対象の化合物は "Compendium of Pesticide 30 Common Names" に含まれており、インターネット [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright (著作権) 1995 - 2004] においてアクセス可能であり；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。

【0156】

上記の活性成分の大部分は、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上記において言及されている。呼称が「一般名」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 40 弧中に示され；その場合、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」が使用され、またはこれらの呼称もしくは「一般名」のいずれも使用されない場合、「代替名」が用いられている。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。

【0157】

表1 ~ 1.19 (以下) または表T1 (以下) の1つに記載される化合物から選択される式(I)の化合物と、上記の活性成分との活性成分混合物は、好ましくは、100 : 1 ~ 1 : 6000、特に50 : 1 ~ 1 : 50の混合比、より特に20 : 1 ~ 1 : 20、さらにより特に10 : 1 ~ 1 : 10、非常に特に5 : 1 ~ 1 : 5の比率であり(2 : 1 ~ 1 : 2の比率が特に好ましく、4 : 1 ~ 2 : 1の比率が同様に好ましい)、とりわけ1 : 1、 50

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 の比率である。それらの混合比は重量基準である。

【 0 1 5 8 】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物またはその環境に適用するステップを含む有害生物を防除するための方法に使用され得るが、手術または治療によるヒトまたは動物の身体の処置のための方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方法は除外される。

【 0 1 5 9 】

表 1 . 1 ~ 1 . 1 9 (下記) または表 T 1 (下記) の 1 つから選択される式 (I) の化合物および上記の 1 種以上の活性成分を含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の活性成分の個々の配合物から構成される「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、および逐次的に、すなわち数時間または数日間などの適度に短時間のうちに次々と適用される場合には単一の活性成分を併用して適用され得る。表 1 . 1 ~ 1 . 1 9 (下記) または表 T 1 (下記) から選択される式 (I) の化合物および上記の活性成分を適用する順序は、本発明を作用させるのに重要ではない。

【 0 1 6 0 】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば非エポキシ化またはエポキシ化植物油 (例えばエポキシ化ヤシ油、ナタネ油または大豆油)、消泡剤、例えばシリコン油、防腐剤、粘性調節剤、バインダおよび / または粘着付与剤、肥料または特定の効果を達成するための他の活性成分、例えば殺バクテリア剤、殺菌・殺カビ剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤または除草剤などのさらなる固体助剤もしくは液体助剤も含み得る。

【 0 1 6 1 】

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、助剤の非存在下で、例えば、固体活性成分を粉末化し、スクリーニングし、および / または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、活性成分を助剤と共に均質混合し、および / または粉末化することにより調製される。組成物のこれらの調製プロセス、およびこれらの組成物の調製のための化合物 (I) の使用も本発明の主題である。

【 0 1 6 2 】

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

【 0 1 6 3 】

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

10

20

30

40

50

を活性処方成分として植物、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。

【0164】

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。

【0165】

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

10

【0166】

例えば、式(I)の化合物と、必要に応じて式(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、公知の様式において、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および/または粉碎することにより調製され得る。

20

【0167】

有利な適用量は、通常、1ヘクタール(ha)当たり、5g~2kgの活性処方成分(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。

【0168】

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。

30

【0169】

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

【0170】

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。

40

【0171】

このような組成物は、従来様式において、例えば活性処方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

50

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

【0172】

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

10

【0173】

概して、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。

20

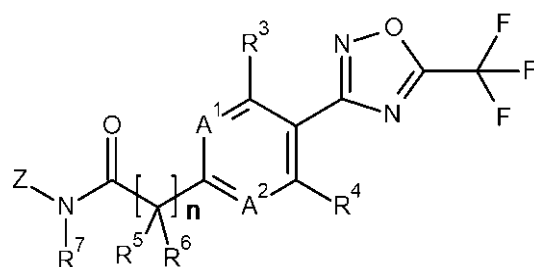
【0174】

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。

【0175】

表1.1：この表は、式(T-1)：

【化17】



(T-1)

30

の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R²、R³、R⁴、およびR⁷は、水素であり、R¹は、フッ素であり、かつZは、以下の表1に定義されているとおりである。

40

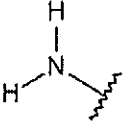
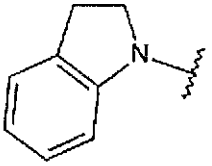
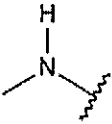
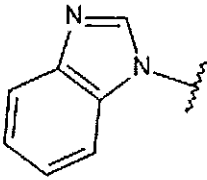
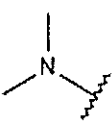
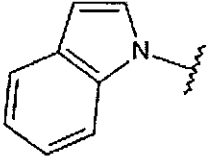
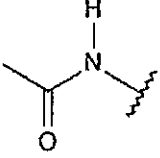
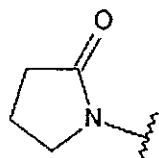
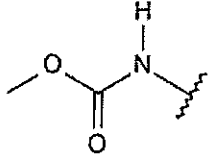
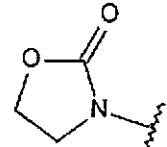
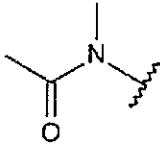
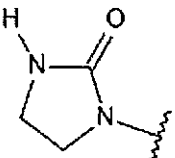
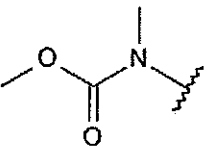
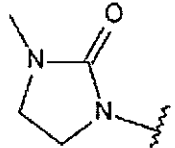

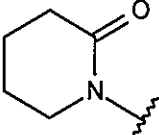
【0176】

(表1に続く)表1.2～1.19の各々は、式(T-1)の24種の個々の化合物を利用可能にし、式中、n、A¹、A²、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、およびR⁷は、表1.2～1.19に具体的に定義されているとおりであり、これらの表は、Zが具体的に定義されている表1を意味する。

【0177】

【表 1 - 1】

表 1

化合物 番号	Z	化合物 番号	Z
1.001		1.013	
1.002		1.014	
1.003		1.015	
1.004		1.016	
1.005		1.017	
1.006		1.018	
1.007		1.019	
1.008		1.020	

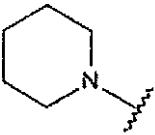
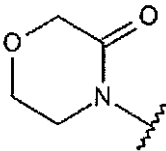
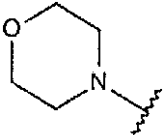
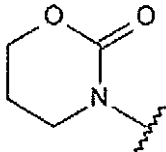
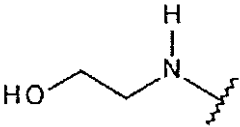
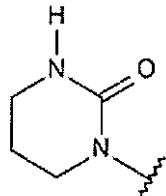
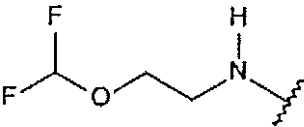
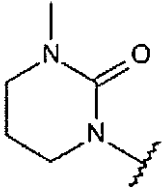
10

20

30

40

【表 1 - 2】

1.009		1.021	
1.010		1.022	
1.011		1.023	
1.012		1.024	

10

20

【0178】

表 1.2 : この表は、式 (T-1) の 22 種の特定の化合物 (すなわち化合物 2.002 ~ 2.009 および 2.011 ~ 2.024) を開示しており、式中、 n は、0 であり、 A^1 は、 $C-R^1$ であり、 A^2 は、 $C-R^2$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、および R^7 は、水素であり、かつ Z は、上記の表 1 に定義されているとおりである。

30

【0179】

表 1.3 : この表は、式 (T-1) の 24 種の特定の化合物を開示しており、式中、 n は、0 であり、 A^1 は、 $C-R^1$ であり、 A^2 は、 $C-R^2$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 、および R^7 は、水素であり、 R^1 は、塩素であり、かつ Z は、上記の表 1 に定義されているとおりである。

【0180】

表 1.4 : この表は、式 (T-1) の 24 種の特定の化合物を開示しており、式中、 n は、0 であり、 A^1 は、 $C-R^1$ であり、 A^2 は、 $C-R^2$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 、および R^7 は、水素であり、 R^1 は、メトキシであり、かつ Z は、上記の表 1 に定義されているとおりである。

40

【0181】

表 1.5 : この表は、式 (T-1) の 24 種の特定の化合物を開示しており、式中、 n は、0 であり、 A^1 は、 $C-R^1$ であり、 A^2 は、 $C-R^2$ であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 、および R^7 は、水素であり、 R^1 は、メチルであり、かつ Z は、上記の表 1 に定義されているとおりである。

【0182】

表 1.6 : この表は、式 (T-1) の 24 種の特定の化合物を開示しており、式中、 n は、0 であり、 A^1 は、 $C-R^1$ であり、 A^2 は、 $C-R^2$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^4 、および R^7 は、水素であり、 R^3 は、フッ素であり、かつ Z は、上記の表 1 に定義されているとお

50

りである。

【0183】

表1.7: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R³、R⁴、およびR⁷は、水素であり、R¹およびR²は、フッ素であり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

【0184】

表1.8: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R²、R⁴、およびR⁷は、水素であり、R¹およびR³は、フッ素であり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

10

【0185】

表1.9: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、Nであり、A²は、C-R²であり、R²、R³、R⁴、およびR⁷は、水素であり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

【0186】

表1.10: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、Nであり、A²は、C-R²であり、R³、R⁴、およびR⁷は、水素であり、R²は、メチルであり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

20

【0187】

表1.11: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、Nであり、A²は、Nであり、R³、R⁴、およびR⁷は、水素であり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

【0188】

表1.12: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R¹、R²、R³、およびR⁴は、水素であり、R⁷は、メチルであり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

30

【0189】

表1.13: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R¹、R²、R³、およびR⁴は、水素であり、R⁷は、フェニルカルボニルであり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

【0190】

表1.14: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、0であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R¹、R²、R³、およびR⁴は、水素であり、R⁷は、N-tert-ブチルアセトアミドであり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

【0191】

表1.15: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、1であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、およびR⁷は、水素であり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

40

【0192】

表1.16: この表は、式(T-1)の24種の特定の化合物を開示しており、式中、nは、1であり、A¹は、C-R¹であり、A²は、C-R²であり、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、およびR⁷は、水素であり、R¹は、フッ素であり、かつZは、上記の表1に定義されているとおりである。

【0193】

50

表 1.17 : この表は、式 (T - 1) の 2 4 種 の 特 定 の 化 合 物 を 開 示 し て お り 、 式 中 、
n は、1 であり、A¹ は、C - R¹ であり、A² は、C - R² であり、R¹、R²、R⁴、R⁵、
R⁶、および R⁷ は、水素であり、R³ は、フッ素であり、かつ Z は、上記の表 1 に定義さ
れているとおりである。

【 0 1 9 4 】

表 1.18 : この表は、式 (T - 1) の 2 4 種 の 特 定 の 化 合 物 を 開 示 し て お り 、 式 中 、
n は、1 であり、A¹ は、N であり、A² は、C - R² であり、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、
および R⁷ は、水素であり、かつ Z は、上記の表 1 に定義されているとおりである。

【 0 1 9 5 】

表 1.19 : この表は、式 (T - 1) の 2 4 種 の 特 定 の 化 合 物 を 開 示 し て お り 、 式 中 、
n は、1 であり、A¹ は、C - R¹ であり、A² は、C - R² であり、R¹、R²、R³、R⁴、
R⁵、および R⁷ は、水素であり、R⁶ は、メチルであり、かつ Z は、上記の表 1 に定義さ
れているとおりである。

10

【 実 施 例 】

【 0 1 9 6 】

以下の実施例は、本発明を例示するものである。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 5 0 p p m、1 2 . 5 p p m、6 p p m、3 p
p m、1 . 5 p p m、0 . 8 p p m または 0 . 2 p p m と いったより少ない施用量を用い
て当業者により検証可能である。

20

【 0 1 9 7 】

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、または農芸化学活性処方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 9 8 】

本記載を通じて、L C / M S は、液体クロマトグラフィー質量分析法を意味し、装置お
よび方法 (方法 A および B) の説明は、以下のとおりである。

【 0 1 9 9 】

L C / M S 装置および方法 A の説明は以下のとおりである。

30

W a t e r s 製 S Q D e t e c t o r 2

イオン化方法 : 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 (k V) 3 . 0、コーン (V) 3 0 . 0 0、抽出器 (V) 2 . 0 0、ソース温
度 () 1 5 0、脱溶媒温度 () 3 5 0、コーンガス流 (L / H r) 0、脱溶媒ガス流
(L / H r) 6 5 0

質量範囲 : 1 0 0 ~ 9 0 0 D a

D A D 波長範囲 (n m) : 2 1 0 ~ 5 0 0

以下の H P L C 勾配条件を用いた W a t e r s 製 A C Q U I T Y U P L C による方法 :
(溶媒 A : 水 / メタノール 2 0 : 1 + 0 . 0 5 % のギ酸および溶媒 B : アセトニトリル +
0 . 0 5 % のギ酸)

40

【 0 2 0 0 】

【 表 2 】

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

【 0 2 0 1 】

50

カラムのタイプ：Waters製ACQUITY UPLC HSS T3；カラム長さ：30 mm；カラムの内径：2.1 mm；粒径：1.8 μm；温度：60。

【0202】

LC/MS装置および方法Bの説明は以下のとおりである。

Waters製SQ Detector 2

イオン化方法：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、脱溶媒温度 () 400、コーンガス流 (L/Hr) 60、脱溶媒ガス流 (L/Hr) 700

10

質量範囲：140～800 Da

DAD波長範囲 (nm)：210～400

以下のHPLC勾配条件を用いたWaters製ACQUITY UPLCによる方法（溶媒A：水/メタノール9：1+0.1%のギ酸および溶媒B：アセトニトリル+0.1%のギ酸）

【0203】

【表3】

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

20

【0204】

カラムのタイプ：Waters製ACQUITY UPLC HSS T3；カラム長さ：30 mm；カラムの内径：2.1 mm；粒径：1.8 μm；温度：60。

【0205】

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り、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りラセミ材料から得られる。

30

【0206】

配合物実施例

【0207】

【表4】

水和剤	a)	b)	c)
活性処方成分 [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%	-

40

【0208】

活性処方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。

【0209】

50

【表 5】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
活性処方成分 [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 %

【0210】

10

活性処方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。

【0211】

乳化性濃縮物

活性処方成分 [式(I)の化合物] 10 %

オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル 3 %

(4 ~ 5 molのエチレンオキシド)

ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 3 %

ヒマシ油ポリグリコールエーテル (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 %

20

【0212】

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。

【0213】

【表 6】

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

30

【0214】

直ちに使用可能な粉剤は、活性処方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。

【0215】

押し出し顆粒

活性処方成分 [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 %

40

【0216】

活性処方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。

【0217】

コーティングされた顆粒

活性処方成分 [式(I)の化合物] 8 %

ポリエチレングリコール (mol . wt . 200) 3 %

50

カオリン 89%

【0218】

細かく粉砕した活性処方成分を、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。

【0219】

懸濁液濃縮物

活性処方成分 [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%

【0220】

細かく粉砕した活性処方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り、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。

【0221】

種子処理に係る流動性濃縮物

活性処方成分 [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%

【0222】

細かく粉砕した活性処方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り、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。

【0223】

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。

【0224】

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%の活性処方成分を含有する。中程度のカプセル径は8~15ミクロンである。

【0225】

得られた製剤を、該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に適用する。

【0226】

カオリン 89%	
【0218】	
細かく粉砕した活性処方成分を、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。	
【0219】	
懸濁液濃縮物	
活性処方成分 [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)	10
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%	
【0220】	
細かく粉砕した活性処方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り、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。	20
【0221】	
種子処理に係る流動性濃縮物	
活性処方成分 [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%	30
【0222】	
細かく粉砕した活性処方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り、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。	
【0223】	
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。	40
【0224】	
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%の活性処方成分を含有する。中程度のカプセル径は8~15ミクロンである。	
【0225】	
得られた製剤を、該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に適用する。	
【0226】	50

略語のリスト：

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 = ジメチルアセトアミド

D M F = ジメチルホルムアミド

D M S O = ジメチルスルホキシド

E D C I = 1 - エチル - 3 - (3 - ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド

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

H O B t = ヒドロキシベンゾトリアゾール

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 = 無水トリフルオロ酢酸

T H F = テトラヒドロフラン

【 0 2 2 7 】

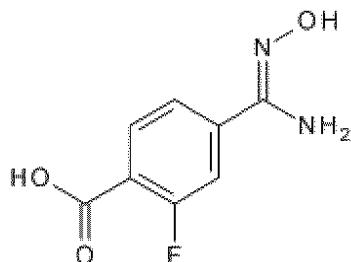
調製例

実施例 1：この実施例は、2 - フルオロ - N - (2 - メチル - 3 - オキサオキサゾリジン - 3 - イル) - 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] ベンズアミド (表 T 1 の化合物 1 . 3) の調製を例示する。

【 0 2 2 8 】

ステップ 1：2 - フルオロ - 4 - (N - ヒドロキシカルバムイミドイル) - 安息香酸の調製

【 化 1 8 】

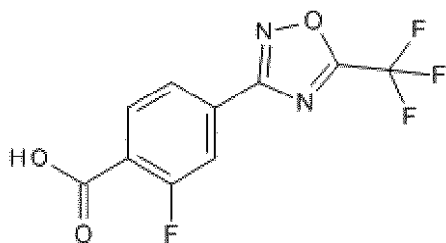


水 (2 0 m L) 中の塩酸ヒドロキシルアミン (3 . 0 g) の溶液をエタノール (3 5 m L) 中の 4 - シアノ - 2 - フルオロ安息香酸 (3 . 5 2 g 、 2 1 . 3 m m o l) の攪拌溶液に室温で加えた後、炭酸カリウム (1 . 6 0 g) を滴下して加えた。次いで、8 - ヒドロキシキノリン (0 . 0 4 1 g 、 0 . 2 8 m m o l) を加えた。得られた高粘度の懸濁液を 3 時間にわたって加熱還流させて、黄色の溶液を得た。減圧下でエタノールを除去した後、残渣を 2 N の H C l で p H 3 になるまで酸性化した。白色の沈殿物をろ過し、水で洗浄し、5 0 において減圧下で乾燥させて、2 - フルオロ - 4 - (N - ヒドロキシカルバムイミドイル) - 安息香酸をベージュ色の固体として得た。融点：> 2 5 0 。¹H N M R (4 0 0 M H z 、 D M S O - d 6) p p m : 1 3 . 2 2 (s , 1 H) 、 1 0 . 0 0 (s , 1 H) 、 7 . 8 5 (t , 1 H) 、 7 . 6 3 (m , 1 H) 、 7 . 5 4 - 7 . 6 1 (m , 1 H) .

【 0 2 2 9 】

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) - 安息香酸の調製

【化19】



無水トリフルオロ酢酸 (4.1 mL) を THF (77 mL) 中の 2-フルオロ-4-(
 N-ヒドロキシカルバミドイル)-安息香酸 (3.80 g、19.0 mmol) の攪
 拌懸濁液に 10 ~ 15 滴で滴下して加えた。ベージュ色の懸濁液を室温に温め、一晚攪拌
 した。蒸発させた後、粗生成物をヘプタン/酢酸エチル (95 : 5) と共に攪拌し、ろ過
 し、50 において減圧下で乾燥させて、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)-安息香酸を黄色の固体として得た。
 融点: 175 ~ 177。¹H NMR (400 MHz、DMSO-d₆) ppm: 1
 3.55 (s, 1H)、8.12 (t, 1H)、8.00 (d, 1H)、7.94 (d,
 1H)。

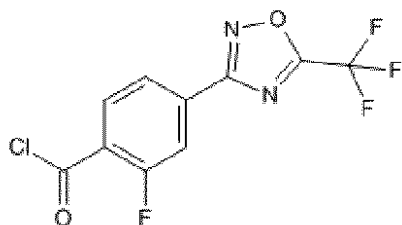
10

【0230】

ステップ3: 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)-ベンゾイルクロリドの調製

20

【化20】



室温において、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)安息香酸 (3.6 g、13.0 mmol) および CH₂Cl₂ (
 130 mL) からなる白色の懸濁液に塩化チオニル (1.51 mL) を滴下して加えた。
 得られた懸濁液を加熱還流させ、3時間攪拌して、黄色の溶液を得た。溶媒を30 にお
 いて減圧下で蒸発させて、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)-ベンゾイルクロリドを黄色がかった固体として得
 て、それを精製せずに直接使用した。¹H NMR (400 MHz、CDCl₃) ppm:
 8.26 (t, 1H)、8.07 (m, 1H)、7.99 (m, 1H)。

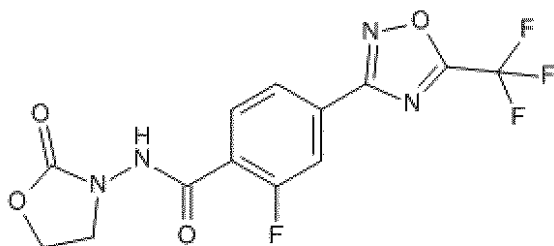
30

【0231】

ステップ4: 2-フルオロ-N-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)-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]ベンズアミドの調
 製

40

【化21】



50

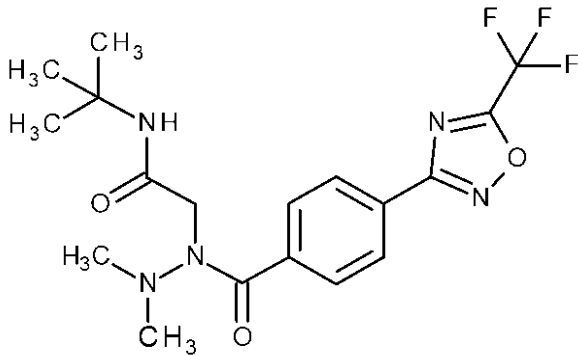
0 に冷却された CH_2Cl_2 (12 mL) 中で懸濁された 3 - アミノオキサゾリジン - 2 - オン (0.05 g) を含むねじ口バイアルに。次いで、トリエチルアミン (0.14 mL) を導入した後、2 - フルオロ - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゾイルクロリド (0.15 g) を一度に導入した。次いで、反応内容物を分液漏斗に注ぎ、 CH_2Cl_2 および水で希釈した。有機層を分離し、次いで 1 N の HCl 、1 N の NaOH 、および塩水で洗浄した。溶媒を減圧下で除去し、粗残渣をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー (ヘプタン : 酢酸エチル勾配) によって精製して、表題化合物を白色の固体 (融点 : 186 ~ 189) として得た。 ^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) : 8.60 (d, 1H)、8.32 (d, 1H)、8.10 (d, 1H)、7.97 (d, 1H)、4.55 (t, 2H)、4.00 (t, 2H) . LC / MS 保持時間 = 0.85 分、361 (M + H)

10

【0232】

実施例 2 : この実施例は、N - tert - ブチル - 2 - [ジメチルアミノ - [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] ベンゾイル] アミノ] アセトアミド (表 T 1 の化合物 1.1) の調製を例示する。

【化 2 2】



20

メタノール (10 mL) 中で懸濁された 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] 安息香酸 (0.20 g) を含むねじ口バイアルに 1, 1 - ジメチルヒドラジン (0.07 mL)、続いてホルムアルデヒド (0.08 mL) の水溶液 (35%) を加えた。30 分間攪拌した後、tert - ブチルイソシアニド (0.10 mL) を導入し、反応物を 20 時間攪拌した。完了後、揮発性物質を減圧下で除去し、粗製の内容物を、EtOAc および水を含む分液漏斗に注いだ。有機層を分離し、次いで塩水および Na_2SO_4 上で洗浄した。溶媒を減圧下で除去し、粗残渣をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー (ジクロロメタン : 酢酸エチル勾配) によって精製して、表題化合物を退色した (off - color) 樹脂として得た。 ^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) : 8.13 (d, 2H)、7.68 (d, 1H)、6.66 (brs, 1H)、4.05 (s, 2H)、2.51 (s, 6H)、1.35 (s, 9H) . LC / MS 保持時間 = 1.64 分、414 (M + H) .

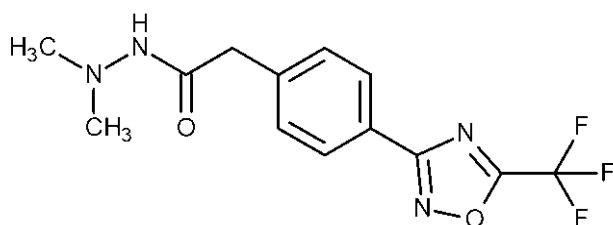
30

【0233】

実施例 3 : この実施例は、N', N' - ジメチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトヒドラジド (表 T 1 の化合物 1.27) の調製を例示する。

40

【化 2 3】

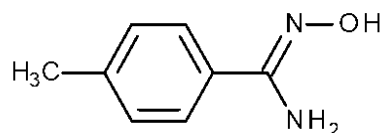


50

【0234】

ステップ1：N'-ヒドロキシ-4-メチル-ベンズアミジンの調製

【化24】



エタノール(220 mL)および水(440 mL)中の4-メチルベンゾニトリル(35 g、0.29 mol)の攪拌懸濁液に室温でヒドロキシルアミン塩酸塩(41.1 g、0.58 mol)、炭酸カリウム(65.4 g、0.47 mol)および8-ヒドロキシキノリン(0.22 g、1.5 mmol)を加えた。反応混合物を80℃で4時間加熱した。混合物を室温に冷まし、pH 8になるまで2 NのHClで希釈した。エタノールを減圧下で蒸発させ、次いで混合物をろ過し、水で洗浄し、減圧下で乾燥させて、39.1 gのN'-ヒドロキシ-4-メチル-ベンズアミジンを得て、それをさらに精製せずに使用した。

10

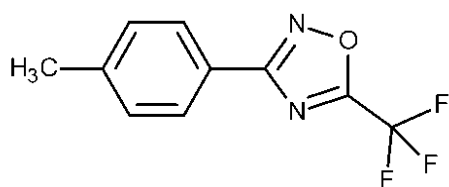
LC/MS(方法A)保持時間=0.23分、151.0(M+H)。

【0235】

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

20

【化25】



2-メチルテトラヒドロフラン(750 mL)中のN'-ヒドロキシ-4-メチル-ベンズアミジン(38.7 g、0.25 mol)の攪拌溶液に0℃でTFAAを加えた。反応混合物を15℃で2時間攪拌し、次いで水で希釈した。有機層を分離し、炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化アンモニウム水溶液、および水で連続して洗浄した。次いで、有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、蒸発乾固させた。粗生成物をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー(750 gの予め充填されたカラム; 溶離剤ヘプタン/EtOAc 99:1~90:10)に供して、54.1 gの3-(p-トリル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールを透明の油として得て、それは貯蔵後に固化した。

30

LC/MS(方法A)保持時間=1.15分、質量非検出。

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

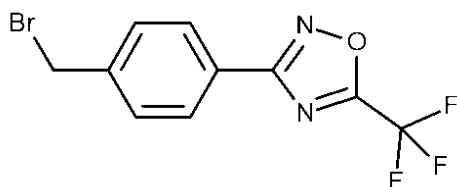
^{19}F NMR(400 MHz、 CDCl_3) ppm: -65.41(s)。

40

【0236】

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

【化26】



50

アルゴン下でテトラクロロメタン (480 mL) 中の 3 - (p - トリル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (56.0 g、0.24 mol) と、NBS (45.4 g、0.25 mol) との攪拌混合物を 70 に加熱した。AIBN (4.03 g、24 mmol) を加え、反応混合物を 65 で 18 時間攪拌した。混合物を 25 に冷却し、ジクロロメタンおよび水で希釈した。有機層を炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、蒸発乾固させた。粗生成物をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー (750 g の予め充填されたカラム; 溶離剤シクロヘキサン / EtOAc 100 : 0 ~ 95 : 5) に供して、44.7 g の 3 - [4 - (ブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールを白色の固体 (融点: 58 ~ 63) として得た。

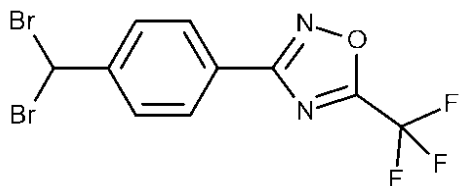
^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: 8.11 (d, 2H)、7.55 (d, 2H)、4.53 (s, 2H) .

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

【0237】

3 - [4 - (ジブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (以下を参照されたい) を白色の固体 (融点 61 ~ 66) として副生成物として単離した。

【化27】



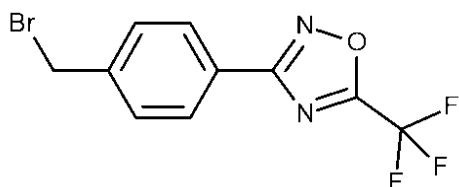
^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: 8.15 (d, 2H)、7.73 (d, 2H)、6.68 (s, 1H) .

^{19}F NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: -65.34 (s) .

【0238】

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

【化28】



アセトニトリル (95 mL)、水 (1.9 mL) および DIPEA (6.20 mL、35.7 mmol) 中の 3 - [4 - (ブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールおよび 3 - [4 - (ジブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (10.2 g) の 1 : 9 の比率の攪拌混合物に亜リン酸ジエチル (4.7 mL、35.7 mmol) を 5 で加えた。混合物を 5 ~ 10 で 2 時間攪拌し、水および 1 M の HCl を加え、アセトニトリルを減圧下で蒸発させた。白色のスラリーをジクロロメタンで抽出し、組み合わせられた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過した。溶媒を減圧下で除去し、得られた粗生成物をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー (40 g の予め充填されたカラム; 溶離剤シクロヘキサン / EtOAc 99 : 1 ~ 9 : 1) に供して、7.10 g の 3 - [4 - (ブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールを得た。

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

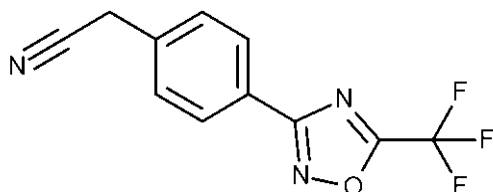
(d, 2H)、4.53 (s, 2H) .

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

【0239】

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

【化29】



10

0 でアセトニトリル(400 mL)中の3-[4-(ブロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(10.0 g、32.6 mmol)およびトリメチルシリルホルモニトリル(4.2 g、43.9 mmol)の溶液にテトラブチルアンモニウムヒドロフルオリド(42.3 mL、42.3 mmol)の1 MのTHF溶液を加えた。反応物を室温に到達させたまま3時間攪拌し、次いで反応内容を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層を水、塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー(溶離剤シクロヘキサン/EtOAc 8:2)に供して、2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリル(7.0 g、82%の収率)を得た。

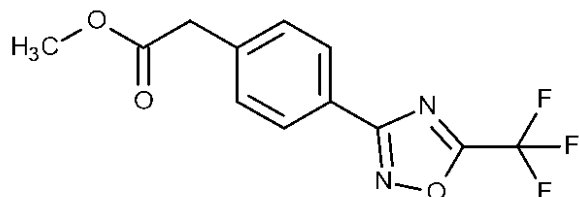
20

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.15 (m, 2H)、7.55 (m, 2H)、3.88 (m, 2H) .

【0240】

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

【化30】



30

メタノール(70 mL)中の2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトニトリル(7.0 g、27.6 mmol)の溶液にクロロ(トリメチル)シラン(18.0 g、165.9 mmol)を室温に加え、次いで反応物を65 で12時間加熱した。内容を室温に冷ました後、メタノールを減圧下で除去し、得られた残渣を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和 NaHCO_3 水溶液、塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた粗残渣をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー(溶離剤シクロヘキサン/EtOAc 99:1~9:1)に供して、メチル2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセテート(6.5 g、23 mmol、71%の収率)を得た。

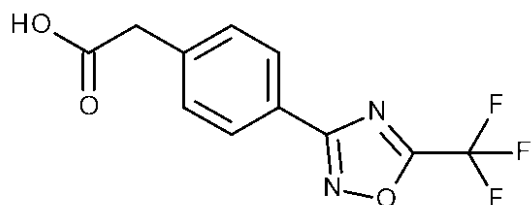
40

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.11 (d, 2H)、7.48 (d, 2H)、3.75 (s, 2H)、3.74 (s, 3H) .

【0241】

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

【化 3 1】



メタノール (1 1 6 m L) 中のメチル 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセテート (2 . 9 0 g 、 1 0 . 1 m m o l) の溶液にジヒドロキシバリウム八水和物 (6 . 3 9 g 、 2 0 . 3 m m o l) を 0
 で加え、反応物を室温に到達させたまま 1 時間攪拌した。次いで、反応内容物を水で希
 釈し、酢酸エチルで洗浄した。水層を、1 M の H C l 水溶液を用いて p H 2 になるまで酸
 性化し、酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層を水、塩水で洗浄し、N a ₂ S O ₄
 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた粗残渣をシリカゲルにおけるフラッシュクロ
 マトグラフィー (溶離剤シクロヘキサン / E t O A c 8 : 2) に供して、2 - [4 - [5
 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] 酢酸
 (2 . 6 g 、 9 4 % の収率) を得た。

¹H NMR (4 0 0 M H z 、 C D C l ₃) p p m : 1 2 . 4 9 (b r s , 1 H) 、 8
 . 0 2 (d , 2 H) 、 7 . 5 3 (d , 2 H) 、 3 . 7 2 (s , 2 H) .

【 0 2 4 2】

ステップ 7 : N ' , N ' - ジメチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 ,
 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトヒドラジドの調製

ジクロロメタン (1 0 m L) 中の 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 ,
 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] 酢酸 (0 . 2 0 g 、 0 . 7 m m o l) の溶
 液に E D C l (0 . 2 g 、 1 m m o l) および H O B t (0 . 0 6 g 、 0 . 4 m m o l)
 を加え、次いで 1 0 分間攪拌した。反応内容物に 1 , 1 - ジメチルヒドラジン (0 . 5 g
 、 0 . 9 m m o l) およびトリメチルアミン (0 . 3 m L 、 2 m m o l) を導入した。一
 晩攪拌した後、得られた残渣を水で希釈し、1 0 分間攪拌し、ジクロロメタンで抽出した
 。有機層を飽和 N a H C O ₃ 水溶液、塩水で洗浄し、N a ₂ S O ₄ 上で乾燥させ、減圧下で
 濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィー (溶離
 剤シクロヘキサン / E t O A c 9 9 : 1 ~ 9 : 1) に供して、N ' , N ' - ジメチル - 2
 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェ
 ニル] アセトヒドラジド (0 . 1 1 g 、 5 0 % の収率) を得た。

¹H NMR (4 0 0 M H z 、 D M S O - d 6) p p m : 8 . 4 7 (m , 1 H) 、 8
 . 0 1 (m , 2 H) 、 7 . 4 7 (m , 2 H) 、 3 . 3 9 (m , 2 H) 、 2 . 4 6 (m , 6
 H) .

【 0 2 4 3】

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ー
 などの標準的な物理的分離技術により、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りラセミ材料から得られる。

【 0 2 4 4】

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ー
 などの標準的な物理的分離技術により、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りラセミ材料から得られる。

【表 7 - 1】

表 T1: 式(I)で表される化合物についての融点(mp)データおよび/または保持時間(RT):

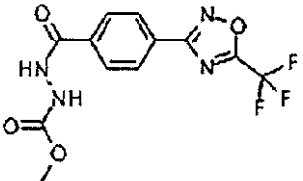
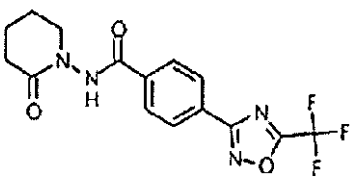
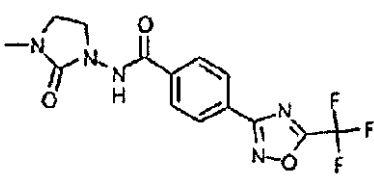
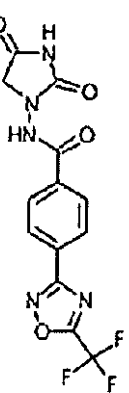
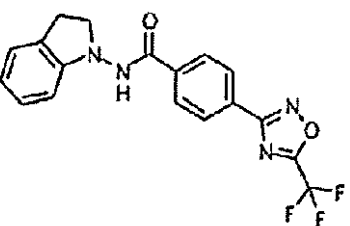
項目	IUPAC 名	構造	保持時間 (分)	[M+H] (実測値)	方法	融点 (°C)
1.1	N-tert-ブチル-2-[ジメチルアミノ]-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンゾイル]アミノ]アセトアミド		1.64	413	B	
1.2	N-[2-(tert-ブチルアミノ)-2-オキシ-エチル]-N-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド		1.54	456	B	
1.3	2-フルオロ-N-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド					186.8 - 188.8
1.4	N'-アセチル-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]ベンゾヒドラジド		0.78	333	A	
1.5	N-ベンゾイル-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]ベンゾヒドラジド					115.3 - 118.6

10

20

30

【表 7 - 2】

項目	IUPAC 名	構造	保持時間 (分)	[M+H] (実測値)	方法	融点 (°C)
1.6	メチル N-[[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]ベンゾイル]アミノ]カルバメート					165.2 - 169.9
1.7	N-(2-オキソ-1-ピペリジル)-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]ベンズアミド					192 - 216
1.8	N-(3-メチル-2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)-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]ベンズアミド					238 - 245
1.9	N-(2,4-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-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]ベンズアミド					192 - 196
1.10	N-インドリン-1-イル-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]ベンズアミド					167 - 170

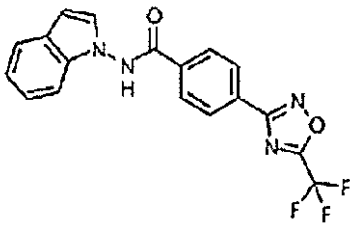
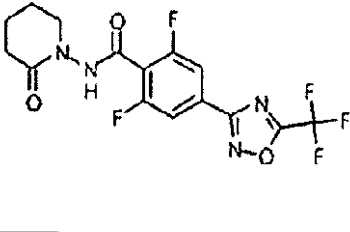
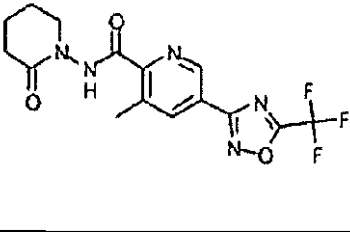
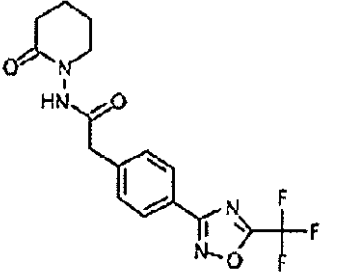
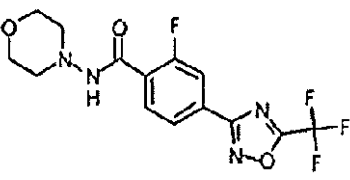
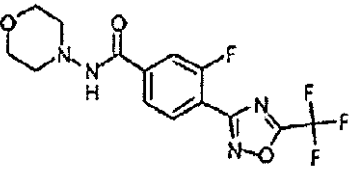
10

20

30

40

【表 7 - 3】

項目	IUPAC名	構造	保持時間 (分)	[M+H] (実測値)	方法	融点 (°C)
1.11	N-インドール-1-イル-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]ベンズアミド					188 - 190
1.12	2,6-ジフルオロ-N-(2-オキソ-1-ピペリジル)-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]ベンズアミド					205 - 209
1.13	3-メチル-N-(2-オキソ-1-ピペリジル)-5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ピリジン-2-カルボキサミド					159 - 162
1.14	N-(2-オキソ-1-ピペリジル)-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド					165 - 170
1.15	2-フルオロ-N-モルホリノ-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]ベンズアミド					140 - 160
1.16	3-フルオロ-N-モルホリノ-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]ベンズアミド					140 - 160

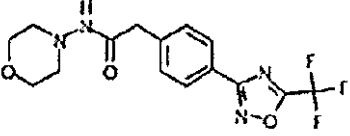
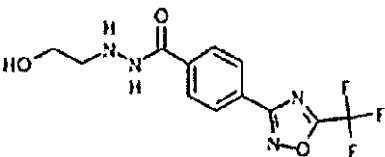
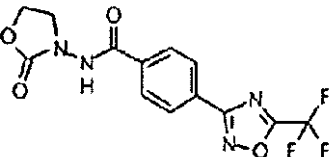
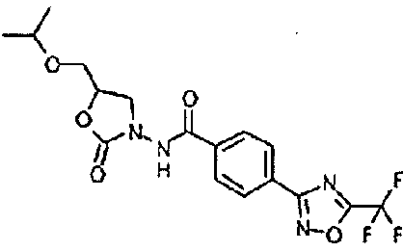
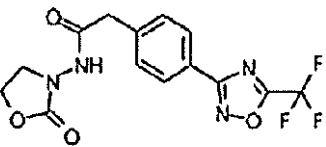
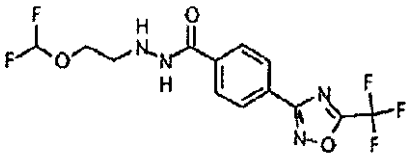
10

20

30

40

【表 7 - 4】

項目	IUPAC 名	構造	保持時間 (分)	[M+H] (実測値)	方法	融点 (°C)
1.17	N-モルホリノ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド					182 - 188
1.18	N'-(2-ヒドロキシエチル)-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]ベンゾヒドラジド					140 - 149
1.19	N-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)-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]ベンズアミド					196 - 200
1.20	N-[5-(イソプロポキシメチル)-2-オキソオキサゾリジン-3-イル]-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]ベンズアミド					192 - 197
1.21	N-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド					184 - 187
1.22	N'-[2-(ジフルオロメトキシ)エチル]-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]ベンゾヒドラジド		0.97	367	A	

10

20

30

40

【表 7 - 5】

項目	IUPAC名	構造	保持時間 (分)	[M+H] (実測値)	方法	融点 (°C)
1.23	2-フルオロ-N-(2-オキソ-1-ピペリジル)-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]ベンズアミド					120 - 136
1.24	3-フルオロ-N-(2-オキソ-1-ピペリジル)-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]ベンズアミド					180 - 200
1.25	3-フルオロ-N-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)-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]ベンズアミド					146 - 166
1.26	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]フェニル]-N,N'-ジメチル-アセトヒドラジド					156 - 158
1.27	N',N'-ジメチル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトヒドラジド					180 - 182
1.28	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]フェニル]-N-モルホリノ-アセトアミド					201 - 203

10

20

30

40

【表 7 - 6】

項目	IUPAC 名	構造	保持時間 (分)	[M+H] (実測値)	方法	融点 (°C)
1.29	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]フェニル]-N-(2-オキシ-1-ピペリジル)アセトアミド					154 - 156
1.30	2-[3-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]-N',N'-ジメチル-アセトヒドラジド					163 - 165
1.31	2-[3-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]-N-モルホリノアセトアミド					207 - 209
1.32	2-[3-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]-N-(2-オキシ-1-ピペリジル)アセトアミド					161 - 163

10

20

30

【 0 2 4 5 】

生物学的実施例：

ウェルプレートにおける葉片テストの一般的実施例：

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

40

【 0 2 4 6 】

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

50

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おいて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。

【0247】

実施例1：ブ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）

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する。葉片に、適用から1日後に真菌の孢子懸濁液を播種する。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% rhにおいてインキュベートし、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する。

10

【0248】

以下の化合物は、200 ppmにおいて、同一の条件下で大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比してブッシニアレコンディタ *f. sp. tritici* (*Puccinia recondita f. sp. tritici*) の少なくとも80%の防除をもたらした。

20

【0249】

（表T1からの）化合物1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.10、1.11、1.14、1.15、1.16、1.17、1.18、1.19、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.27、1.29、1.30、および1.32。

【0250】

実施例2：ブ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。葉切片に真菌の孢子懸濁液を播種する。プレートを暗所において19および75% rhで保管する。水で希釈された配合されたテスト化合物を播種から1日後に適用する。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% rhにおいてインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用葉切片に現われた時点で（適用から6~8日後）、未処理のものとは比した病害防除割合として評価する。

30

【0251】

以下の化合物は、200 ppmにおいて、同一の条件下で大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比してブッシニアレコンディタ *f. sp. tritici* (*Puccinia recondita f. sp. tritici*) の少なくとも80%の防除をもたらした。

40

【0252】

（表T1からの）化合物1.1、1.3、1.4、1.6、1.9、1.14、1.15、1.17、1.18、1.19、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.27、1.28、1.29、1.30、1.31、および1.32。

【0253】

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

50

積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rhにおいて暗闇で24～36時間のインキュベーション期間後、葉片を12時間の光/日および75%のrhで20 に保持する。化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用葉片に現われた時点で（適用から12～14日後）、未処理のものとはした病害防除割合として評価する。

【0254】

以下の化合物は、200ppmにおいて、同一の条件下で大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比してファコプソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) の少なくとも80%の防除をもたらした。

10

【0255】

(表T1からの)化合物1.1、1.2、1.3、1.4、1.6、1.7、1.8、1.9、1.14、1.15、1.16、1.17、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.24、1.26、および1.27。

【0256】

実施例4：グロメララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレ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、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを24 でインキュベートし、適用から3～4日後に成長の阻害を測光法により計測する。

20

【0257】

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

【0258】

(表T1からの)化合物1.1、1.3、1.5、1.6、1.10、1.11、1.12、1.15、1.18、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.27、1.28、1.29、1.30、および1.32。

30

【0259】

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10μl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時間日長および70%の相対湿度において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）、未処理のものとはした病害防除割合として評価する。

40

【0260】

以下の化合物は、このテストでは、適用される配合物中100ppmにおいて、同一の条件下で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。

【0261】

(表T1からの)化合物1.1、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、および1.9。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2017/056032

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
INV.	C07D413/12	C07D271/06
	A01N43/82	A01N43/84
ADD.	C07D413/14	
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, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	"Compound Summary for CID 86777455", 7 February 2015 (2015-02-07), pages 1-11, XP055265245, PubChem Compound Database Retrieved from the Internet: URL:https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/86777455 [retrieved on 2016-04-14] abstract ----- -/--	1
<input checked="" 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		"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
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date		"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
"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)		"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
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means		"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
29 March 2017		06/04/2017
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 Brandstetter, T

2

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2017/056032

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	"Compound Summary for CID 86777507", PubChem Compound Database, 7 February 2015 (2015-02-07), pages 1-11, XP055265251, Retrieved from the Internet: URL:https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compo und/86777507 [retrieved on 2016-04-14] abstract	1
A	----- "Compound Summary for CID 86777680", PubChem Compound Database, 7 February 2015 (2015-02-07), XP055265253, Retrieved from the Internet: URL:https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compo und/86777680 [retrieved on 2016-04-14] abstract	1
A	----- "Compound Summary for CID 86812992", PubChem Compound Database, 7 February 2015 (2015-02-07), pages 1-10, XP055265260, Retrieved from the Internet: URL:https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compo und/86812992 [retrieved on 2016-04-14] abstract	1
A	----- "Compound Summary for CID 86814280", PubChem Compound Database, 7 February 2015 (2015-02-07), pages 1-11, XP055265262, Retrieved from the Internet: URL:https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compo und/86814280 [retrieved on 2016-04-14] abstract	1
A	----- "Compound Summary for CID 99805418", PubChem Compound Database, 11 December 2015 (2015-12-11), pages 1-11, XP055265268, Retrieved from the Internet: URL:https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compo und/99805418 [retrieved on 2016-04-14] abstract	1
	----- -/--	

2

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2017/056032

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	Pubchem: "MolPort-035-387-824 C10H8ClF3N4O2 - PubChem", 7 February 2015 (2015-02-07), XP055359887, Retrieved from the Internet: URL:https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/86814279#section=Top [retrieved on 2017-03-29] abstract	1
X	----- WO 2015/185485 A1 (BASF SE [DE]) 10 December 2015 (2015-12-10) cited in the application claims 1, 8 compounds I-163, I-92 -----	1-15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2017/056032

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2015185485 A1	10-12-2015	AU 2015270651 A1	22-12-2016
		CA 2950084 A1	10-12-2015
		CN 106455572 A	22-02-2017
		EP 3151669 A1	12-04-2017
		WO 2015185485 A1	10-12-2015

フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 31/454 (2006.01)	A 6 1 K 31/454	
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)	A 6 1 K 31/5377	
A 0 1 N 43/836 (2006.01)	A 0 1 N 43/836	
A 0 1 N 43/84 (2006.01)	A 0 1 N 43/84	1 0 1
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	

(81) 指定国 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, 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, TZ

(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 100136249

弁理士 星野 貴光

(72) 発明者 スティエルリ ダニエル

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

(72) 発明者 ホフマン トマス ジェイムズ

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

(72) 発明者 ボウ ハムダン ファルハン

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

F ターム(参考) 4C056 AA01 AB02 AC05 AD01 AE03 AF06 FA16 FB01 FC01

4C063 AA01 BB09 CC58 DD06 DD10 DD25 DD52 EE01 EE03

4C086 AA01 AA02 BC71 BC73 GA07 GA09 GA12 MA01 MA04 NA14

ZB35

4H011 AA01 BB10 DA02 DA04 DA06 DA15 DA16