

(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2014-525424

(P2014-525424A)

(43) 公表日 平成26年9月29日(2014.9.29)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>C O 7 D 239/91 (2006.01)</b>	C O 7 D 239/91 C S P	4 H O 1 1
<b>A O 1 N 43/54 (2006.01)</b>	A O 1 N 43/54 G	
<b>A O 1 N 55/02 (2006.01)</b>	A O 1 N 55/02 B	
<b>A O 1 N 37/50 (2006.01)</b>	A O 1 N 37/50	
<b>A O 1 N 43/40 (2006.01)</b>	A O 1 N 43/40 I O I E	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 73 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2014-527672 (P2014-527672)  
 (86) (22) 出願日 平成24年8月31日 (2012.8.31)  
 (85) 翻訳文提出日 平成26年4月18日 (2014.4.18)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2012/066963  
 (87) 国際公開番号 W02013/030338  
 (87) 国際公開日 平成25年3月7日 (2013.3.7)  
 (31) 優先権主張番号 61/530,457  
 (32) 優先日 平成23年9月2日 (2011.9.2)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

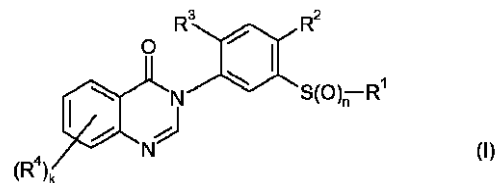
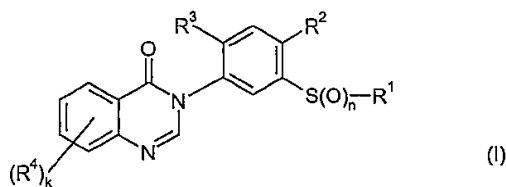
(71) 出願人 508020155  
 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ  
 BASF SE  
 ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)  
 D-67056 Ludwigshafen, Germany  
 (74) 代理人 100091096  
 弁理士 平木 祐輔  
 (74) 代理人 100118773  
 弁理士 藤田 節  
 (74) 代理人 100122389  
 弁理士 新井 栄一

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アリールキナゾリノン化合物を含む農業用混合物

(57) 【要約】

【化1】



本発明は、活性化合物として、1)式(I)で表され、式中R1、R2、R3、R4、kおよびnが明細書中で定義される通りである有害生物活性を有する3-アリールキナゾリン-4-オン化合物の少なくとも1種、ならびに2)明細書中で定義されるアゾール類、ストロビルリン類、カルボキサミド類、カルバマート類、複素環式およびその他の各種化合物から選択される殺菌化合物IIの少なくとも1種の、相乗的に有効な量を含む殺有害生物混合物に関する。本発明は更に、これらの混合物で植物の中および上にいる昆虫、クモ形類動物または線形動物、および有害菌類を駆除するとともに、こうした植物を有害生物の蔓延から

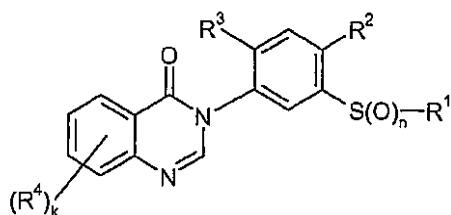
## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

活性化化合物として、

1) 少なくとも1種の殺有害生物活性のある式(I)の3-アリアルキナゾリン-4-オン化合物I

## 【化1】



(I)

10

[ 式中、

R<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、フッ素化C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、シクロプロピルまたはシクロプロピルメチルであり；

R<sup>2</sup> は、水素、ハロゲン、CN、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルもしくはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルであり；

R<sup>3</sup> は、水素、ハロゲン、CN、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルもしくはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルであり；

R<sup>4</sup> は、整数kとは無関係にハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニルおよびC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群から選択され；

20

kは、0、1、2、3もしくは4であり；および

nは、0、1もしくは2である ]

またはその互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオマーもしくは塩、ならびに

2) 以下F.I~F.XIからなるF群から選択される少なくとも1種の殺菌活性化化合物II

## F.I)呼吸阻害剤

a) Q<sub>0</sub>部位での複合体IIIの阻害剤(例えば、ストロビルリン類):アゾキシストロビン、クメトキシストロビン、クモキシストロビン、ジモキシストロビン、エネストロブリン、フェナミンストロビン(fenaminstrobin)、フェノキシストロビン(fenoxystrobin)/フルフェノキシストロビン(flufenoxystrobin)、フルオキサストロビン、クレソキシムメチル、メトミノストロビン、オリサストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、トリフロキシストロビン、2-[2-(2,5-ジメチル-フェノキシメチル)-フェニル]-3-メトキシ-アクリル酸メチルエステル、および2-(2-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-アリリデン-アミノオキシ-メチル)-フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチル-アセトアミド、ピリベンカルブ、トリクロピリカルブ(triclopyricarb)/クロロジンカルブ(chlorodincarb)、ファモキサドン、フェンアミドン；

30

b) Q<sub>i</sub>部位での複合体IIIの阻害剤:シアゾファミド、アミスルプロム；

40

c) 複合体IIの阻害剤(例えば、カルボキサミド類):ベノダニル、ピキサフェン、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フルオピラム、フルトラニル、フルキサピロキサド、フラメトピル、イソピラザム、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルザミド、N-(4'-トリフルオロメチルチオピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、およびN-(2-(1,3,3-トリメチル-ブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド；

d) その他の呼吸阻害剤(例えば、複合体I、脱共役剤):ジフルメトリム；ニトロフェニル誘導体:ピナパクリル、ジノプトン、ジノカップ、フルアジナム；フェリムゾン；有機金属化合物:フェンチン塩、例えばフェンチン酢酸塩、フェンチンクロリドまたはフェンチ

50

ン水酸化物;アメトクトラジン;およびシルチオファミン;

F.II)ステロール生合成阻害剤(SBI殺菌剤)

a)C14デメチラーゼ阻害剤(DMI殺菌剤):トリアゾール類:アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾールM、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、マイクロブタニル、オキスポコナゾール、パクロブトラゾール(paclbutrazole)、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール;イミダゾール類:イマザリル、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール;ピリミジン類、ピリジン類、およびピペラジン類:フェナリモル、ヌアリモル、ピリフェノックス、トリホリン;

10

b) 14還元酵素阻害剤:アルジモルフ、ドデモルフ、ドデモルフ酢酸塩、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミン;

c)3-ケト還元酵素の阻害剤:フェンヘキサミド;

F.III)核酸合成阻害剤

a)フェニルアミド殺菌剤またはアシルアミノ酸殺菌剤:ベナラキシル、ベナラキシルM、キララキシル、メタラキシル、メタラキシルM(メフェノキサム)、オフラセ、オキサジキシル;

b)その他:ヒメキサゾール(hymexazole)、オクチリノン、オキシリニック酸、ブピリメート;

20

F.IV)細胞分裂および細胞骨格の阻害剤

a)チューブリン阻害剤、例えば、ベンゾイミダゾール類、チオファネート類:ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファネートメチル;トリアゾロピリミジン類:5-クロロ-7-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン

b)その他の細胞分裂阻害剤:ジエトフェンカルブ、エタボキサム、ペンシクロン、フルピコリド、ゾキサミド、メトラフェノン、ピリオフェノン;

F.V)アミノ酸合成およびタンパク質合成の阻害剤

a)メチオニン合成阻害剤(アニリノピリミジン類):シプロジニル、メパニピリム、ピリメタニル;

30

b)タンパク質合成阻害剤:プラスチシジンS、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、ミルジオマイシン、ストレプトマイシン、オキシテトラシクリン、ポリオキシン、バリダマイシンA;

F.VI)信号伝達阻害剤

a)MAP/ヒスチジンキナーゼ阻害剤:フルオロイミド(fluoroimid)、イブロジオン、プロシミドン、ピンクロゾリン、フェンピクロニル、フルジオキソニル;

b)Gタンパク質阻害剤:キノキシフェン;

F.VII)脂質合成および膜合成阻害剤

a)リン脂質生合成阻害剤:エジフェンホス、イブロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン;

40

b)脂質過酸化:ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクロホスメチル、ピフェニル、クロロネブ、エトリジアゾール;

c)リン脂質生合成および細胞壁沈着:ジメトモルフ、フルモルフ、マンジプロパミド、ピリモルフ、ベンチアバリカルブ、イブロバリカルブ、バリフェナラートおよびN-(1-(1-(4-シアノ-フェニル)-エタンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン酸-(4-フルオロフェニル)エステル;

d)細胞膜透過性および脂肪酸に影響を及ぼす化合物:プロバモカルブ、プロバモカルブ塩酸塩;

F.VIII)多部位作用を有する阻害剤

50

a)無機活性物質:ボルドー液、酢酸銅、水酸化銅、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、硫黄;

b)チオカルバマートおよびジチオカルバマート類:ファーバム、マンゼブ、マンネブ、カーバム、メチラム、プロピネブ、チウラム、ジネブ、ジラム;

c)有機塩素化合物(例えば、フタルイミド類、スルファミド類、クロロニトリル類):アニラジン、クロロタロニル、カプタホール、キャプタン、ホルペット、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、フルスルファミド、ヘキサクロロベンゼン、ペンタクロロフェノールおよびその塩、フタリド、トリルフルアニド、N-(4-クロロ-2-ニトロ-フェニル)-N-エチル-4-メチル-ベンゼンスルホンアミド;

d)グアニジン類およびその他:グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン酢酸塩、イミノクタジン、イミノクタジン三酢酸塩、イミノクタジントリス(アルベシラート)、ジチアノン

10

#### F.IX)細胞壁合成阻害剤

グルカン合成の阻害剤:バリダマイシン、ポリオキシシンB;メラニン合成阻害剤:ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロパミド、ジシクロメット(dicyclomet)、フェノキサニル;

#### F.X)植物防御誘導剤

アシベンゾラルSメチル、プロベナゾール、イソチアニル、チアジニル、プロヘキサジオンカルシウム;ホスホン酸塩類:ホセチル、ホセチルアルミニウム、亜リン酸およびその塩;

20

#### F.XI)未知の作用機序

プロノポール、キノメチオナート、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフェニルアミン、フェンピラザミン、フルメトベル、フルスルファミド、フルチアニル、メタスルホカルブ、ニトラピリン、ニトロタルイソプロピル、オキシシン銅、プロキナジド、テブフロキン、テクロフタラム、トリアゾキシド、2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン、N-(シクロ-プロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロ-メトキシ-2,3-ジフルオロ-フェニル)-メチル)-2-フェニルアセトアミド、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロボキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロボキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル-アミド、メトキシ-酢酸6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチル-キノリン-4-イルエステル、N-メチル-2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル]-4-チアゾールカルボキサミド、3-[5-(4-メチル-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(ピリソキサゾール)、N-(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)シクロプロパン-カルボン酸アミド、5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-ピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール、2-(4-クロロ-フェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-イソオキサゾール-5-イル]-2-プロパ-2-イニルオキシ-アセトアミド;

30

40

の相乗的に有効な量を含む農業用混合物。

#### 【請求項2】

式(1)の活性化合物Iにおいて、R<sup>1</sup>が2,2,2-トリフルオロエチルである、請求項1に記載の農業用混合物。

50

## 【請求項 3】

式(1)の活性化合物Iにおいて、

$R^3$ が水素、フッ素、塩素、メチルまたはトリフルオロメチルから選択され；

$R^2$ が塩素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルまたはシアノから選択される、請求項 1 または 2 に記載の農業用混合物。

## 【請求項 4】

式(1)の活性化合物Iにおいて、

$R^3$ がフッ素であり；

$R^2$ がメチルである、請求項 1 または 2 に記載の農業用混合物。

## 【請求項 5】

式(1)の活性化合物Iにおいて、 $k$ が0である、請求項 1、2、3 または 4 に記載の農業用混合物。

10

## 【請求項 6】

式(1)の活性化合物Iにおいて、 $k$ が1、2または3であり；

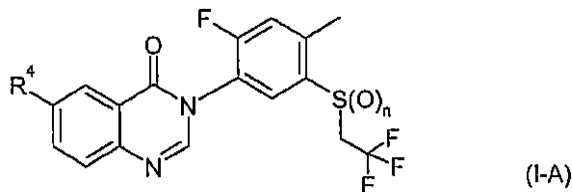
$R^4$ が整数 $k$ とは無関係にフッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシから独立に選択される、請求項 1、2、3 または 4 に記載の農業用混合物。

## 【請求項 7】

式(1-A)

## 【化 2】

20



の活性化合物Iにおいて、

$n$ が0または1であり；

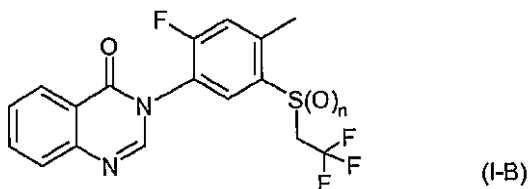
$R^4$ がフッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシから選択される、請求項 1 に記載の農業用混合物。

30

## 【請求項 8】

式(1-B)

## 【化 3】



40

の活性化合物Iにおいて、

$n$ が0または1である、請求項 1 に記載の農業用混合物。

## 【請求項 9】

少なくとも1種の活性化合物IIが、アゾキシストロビン、フルオキサストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビンおよびトリフロキシストロビンからなる群から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載される農業用混合物。

## 【請求項 10】

活性化合物IIがシアゾファミドである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載される農業用混合物。

## 【請求項 11】

50

少なくとも1種の活性化合物IIが、ピキサフェン、ボスカリド、フルオピラム、フルキサピロキサド、イソピラザム、ペンフルフェン、ペンチオピラドおよびセダキサンからなる群から選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項12】

少なくとも1種の活性化合物IIが、アメトクトラジンおよびシルチオフラムからなる群から選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項13】

少なくとも1種の活性化合物IIが、ジフェノコナゾール、エボキシコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、イブコナゾール、メトコナゾール、プロチオコナゾール、テブコナゾール、トリチコナゾールおよびプロクロラズからなる群から選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

10

【請求項14】

少なくとも1種の活性化合物IIが、メタラキシル、メフェノキサム(メタラキシル-M)およびプロピネブから選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項15】

少なくとも1種の活性化合物IIが、ベノミル、カルベンダジムおよびチオファネートメチルからなる群から選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項16】

少なくとも1種の活性化合物IIが、エタボキサム、フルピコリドおよびピリオフェノンからなる群から選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

20

【請求項17】

少なくとも1種の活性化合物IIがジメトモルフである、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項18】

少なくとも1種の活性化合物IIが硫黄である、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項19】

少なくとも1種の活性化合物IIが、酢酸銅、水酸化銅、塩基性塩化銅または塩基性硫酸銅から選択される銅塩である、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

30

【請求項20】

少なくとも1種の活性化合物IIがマンゼブおよびメチラムから選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項21】

少なくとも1種の活性化合物IIがクロロタロニルである、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項22】

少なくとも1種の活性化合物IIが亜リン酸またはその塩から選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載される農業用混合物。

40

【請求項23】

式Iの活性化合物Iおよび活性化合物IIを500:1～1:100の重量比で含む、請求項1～22のいずれか1項に記載される農業用混合物。

【請求項24】

植物、または該植物が成長している土壌もしくは水と、殺有害生物有効量の請求項1～22のいずれか1項に記載される混合物とを接触させることを含む、昆虫、ダニ類または線虫による攻撃または侵入から植物を保護する方法。

【請求項25】

昆虫、ダニ類もしくは線虫またはそれらの餌供給源、生息地、繁殖場所もしくはそれらの生息場所と、殺有害生物有効量の請求項1～22のいずれか1項に記載される混合物と

50

を接触させることを含む、昆虫、クモ形類または線虫を防除する方法。

【請求項 26】

植物繁殖材料と、殺有害生物有効量の請求項 1 ~ 28 のいずれか 1 項に記載され混合物とを接触させることを含む、植物繁殖材料を保護する方法。

【請求項 27】

請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載される混合物を、種子 100kg 当たり 0.1g ~ 10kg の量で含む種子。

【請求項 28】

植物病原菌類を防除する方法であって、該菌類、その生息地、または該菌類の攻撃から保護すべき植物もしくは植物繁殖材料、土壌または種子を、殺菌有効量の請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載される少なくとも 1 種の活性化合物 I および少なくとも 1 種の活性化合物 II の混合物で処理することを含む、上記方法。

10

【請求項 29】

植物病原菌類から植物を保護する方法であって、該菌類、その生息地、または該菌類の攻撃から保護すべき植物もしくは植物繁殖材料、土壌または種子を、殺菌有効量の請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載される少なくとも 1 種の活性化合物 I および少なくとも 1 種の活性化合物 II の混合物で処理することを含む、上記方法。

【請求項 30】

植物病原菌類を駆除するための、請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載される混合物の使用。

20

【請求項 31】

昆虫、クモ形類または線虫を駆除するための、請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載される混合物の使用。

【請求項 32】

液体担体または固体担体と請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載される混合物とを含む農業用組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、相乗的に強化された作用を有する活性成分の混合物、および前記混合物を施用することを含む方法に関する。

30

【背景技術】

【0002】

有害生物および/または菌類の防除の分野において生じる一つの典型的な問題は、有害生物および/または菌類の効果的な防除を可能にしたままで環境上または毒物学上好ましくない影響を低減または回避するために活性成分の用量を減少させる必要性にある。

【0003】

直面するもう一つの問題は、広範囲の有害生物に対して効果的である利用可能な殺有害生物活性薬剤を入手する必要性に関するものである。

【0004】

直面するもう一つの問題は、広範囲の菌類に対して効果的である利用可能な殺菌活性薬剤を入手する必要性に関するものである。

40

【0005】

本発明の根底にあるもう一つの問題は、植物を改善する組成物に対する要求であり、そのプロセスは、一般に、そして以下において「植物の健康」と称される。例えば、列挙し得る有利な性質は、出芽、作物収穫量、タンパク質含有量、より発達した根系、分けつの増加、植物丈の伸張、より大きな葉身、根出葉の枯死減少、より強い分けつ枝、より緑色の濃い葉色、色素含量、光合成作用、必要な肥料量の低減、必要な種子量の低減、より繁殖力のある分けつ枝、早期開花、穀実の早期熟成、植物挫折(倒伏)の減少、苗条成長の増加、植物活力の増大、植物株立本数の増加、および早期発芽、または当業者に公知のその

50

他の利点を含む改良された農作物の特性である。活性化合物を植物または圃場に施用することによって植物の健康を増進させる方法は、一般に必要とされるものである。

【0006】

施用量を減少させるとともに活性化合物IおよびIIの活性スペクトルを拡大することを視野に、施用される活性化合物の総量を減らしながらも有害菌類および動物有害生物に対する活性を向上させた混合物を提供することも本発明の目的である。

【0007】

したがって、本発明の目的は、上記に概説した問題を解決する殺有害生物混合物を提供することであった。

【0008】

農業従事者が直面する問題は、多くの地域における有害な植物病原菌類の駆除だけではない。害虫も農作物および他の植物に大きな被害をもたらす可能性がある。この問題を克服するには、殺菌活性と殺虫活性との効率的な組合せが望ましい。したがって、本発明の更なる目的は、一方では良好な殺菌活性を有し、他方では良好な殺虫活性を有し、結果としてより広範な作用の殺有害生物スペクトルが得られる混合物を提供することである。ノックダウン(know-down)活性と長期間の防除、すなわち、即効性作用と持続性作用を併せ持つ有害生物防除剤または菌防除剤に対する必要性も存在する。

【0009】

殺有害生物剤または殺菌剤の使用に関連するもう一つの難点は、単一の殺有害生物化合物のみを繰り返し施用すると、多くの場合、その活性化合物に対する自然耐性または獲得耐性を発達させた有害生物の急速な選択が起こることである。したがって、耐性の予防または克服の一助となる有害生物防除剤または菌防除剤に対する必要性が存在する。

【0010】

したがって、本発明の目的は、上記の、用量を低減すること、活性のスペクトルを拡大すること、もしくはノックダウン活性と長期間の防除とを併せ持つことといった問題、または耐性管理に関する問題の少なくとも一つを解決する農業用混合物を提供することであった。

【発明の概要】

【0011】

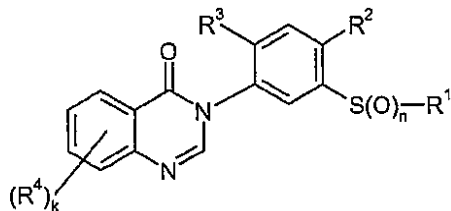
以下に定義する活性化合物の組合せによってこの目的が部分的にまたは全体的に達成されることが見出された。

【0012】

本発明は、農業用混合物に関し、農業用混合物は活性化合物として、

1) 少なくとも1種の殺有害生物活性のある式(I)の3-アリアルキナゾリン-4-オン化合物I

【化1】



(I)

【0013】

[式中、

R<sup>1</sup>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、フッ素化C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、シクロプロピルまたはシクロプロピルメチルであり；

R<sup>2</sup>は、水素、ハロゲン、CN、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルもしくはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルであり；

R<sup>3</sup>は、水素、ハロゲン、CN、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルもしくはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、整数kとは無関係にハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>-ハロアルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C

10

20

30

40

50



4 アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルおよび $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルからなる群から選択され;

kは、0、1、2、3もしくは4であり;および

nは、0、1もしくは2である]

またはその互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオマーもしくは塩、ならびに

2) 以下F.I~F.XIからなるF群から選択される少なくとも1種の殺菌活性化合物II

F.I) 呼吸阻害剤

a)  $Q_0$ 部位での複合体IIIの阻害剤(例えば、ストロビルリン類):アゾキシストロビン、クメトキシストロビン、クモキシストロビン、ジモキシストロビン、エネストロブリン、フェナミンストロビン(fenaminstrobin)、フェノキシストロビン(fenoxystrobin)/フルフェノキシストロビン(flufenoxystrobin)、フルオキサストロビン、クレソキシムメチル、メトミノストロビン、オリサストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、トリフロキシストロビン、2-[2-(2,5-ジメチル-フェノキシメチル)-フェニル]-3-メトキシ-アクリル酸メチルエステル、および2-(2-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-アリリデン-アミノオキシ-メチル)-フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチル-アセトアミド、ピリベンカルブ、トリクロピリカルブ(triclopyricarb)/クロロジンカルブ(chlorodincarb)、ファモキサドン、フェンアミドン;

b)  $Q_1$ 部位での複合体IIIの阻害剤:シアゾファミド、アミスルプロム;

c) 複合体IIの阻害剤(例えば、カルボキサミド類):ベノダニル、ピキサフェン、ボスカリド、カルボキシニ、フェンフラム、フルオピラム、フルトラニル、フルキサピロキサド、フラメトピル、イソピラザム、メプロニル、オキシカルボキシニ、ペンフルフェン、ベンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルザミド、N-(4'-トリフルオロメチルチオピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、およびN-(2-(1,3,3-トリメチル-ブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド;

d) その他の呼吸阻害剤(例えば、複合体I、脱共役剤):ジフルメトリム;ニトロフェニル誘導体:ピナパクリル、ジノプトン、ジノカップ、フルアジナム;フェリムゾン;有機金属化合物:フェンチン塩、例えばフェンチン酢酸塩、フェンチンクロリドまたはフェンチン水酸化物;アメトクトラジン;およびシルチオフアム;

F.II) ステロール生合成阻害剤(SBI殺菌剤)

a)  $C_{14}$ デメチラーゼ阻害剤(DMI殺菌剤):トリアゾール類:アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾールM、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、マイクロブタニル、オキスポコナゾール、パクロブトラゾール(paclobutrazole)、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール;イミダゾール類:イマザリル、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール;ピリミジン類、ピリジン類、およびピペラジン類:フェナリモル、ヌアリモル、ピリフェノックス、トリホリン;

b) 14還元酵素阻害剤:アルジモルフ、ドデモルフ、ドデモルフ酢酸塩、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミン;

c) 3-ケト還元酵素の阻害剤:フェンヘキサミド;

F.III) 核酸合成阻害剤

a) フェニルアミド殺菌剤またはアシルアミノ酸殺菌剤:ベナラキシル、ベナラキシルM、キララキシル、メタラキシル、メタラキシルM(メフェノキサム)、オフラセ、オキサジキシル;

b) その他:ヒメキサゾール(hymexazole)、オクチリノン、オキシリニック酸、ブピリ

10

20

30

40

50

メート;

F.IV) 細胞分裂および細胞骨格の阻害剤

a) チューブリン阻害剤、例えば、ベンゾイミダゾール類、チオファネート類: ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファネートメチル; トリアゾロピリミジン類: 5-クロロ-7-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン

b) その他の細胞分裂阻害剤: ジエトフェンカルブ、エタボキサム、ペンシクロン、フルピコリド、ゾキサミド、メトラフェノン、ピリオフェノン;

F.V) アミノ酸合成およびタンパク質合成の阻害剤

a) メチオニン合成阻害剤(アニリノピリミジン類): シプロジニル、メバニピリム、ピリメタニル;

b) タンパク質合成阻害剤: プラスチシジンS、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、ミルジオマイシン、ストレプトマイシン、オキシテトラシクリン、ポリオキシシン、バリダマイシンA;

F.VI) 信号伝達阻害剤

a) MAP/ヒスチジンキナーゼ阻害剤: フルオロイミド(fluoroimid)、イプロジオン、プロシミドン、ピנקロゾリン、フェンピクロニル、フルジオキソニル;

b) Gタンパク質阻害剤: キノキシフェン;

F.VII) 脂質合成および膜合成阻害剤

a) リン脂質生合成阻害剤: エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン;

b) 脂質過酸化: ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクロホスメチル、ピフェニル、クロロネブ、エトリジアゾール;

c) リン脂質生合成および細胞壁沈着: ジメトモルフ、フルモルフ、マンジプロバミド、ピリモルフ、ベンチアパリカルブ、イプロパリカルブ、バリフェナラートおよびN-(1-(1-(4-シアノフェニル)-エタンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン酸-(4-フルオロフェニル)エステル;

d) 細胞膜透過性および脂肪酸に影響を及ぼす化合物: プロバモカルブ、プロバモカルブ塩酸塩;

F.VIII) 多部位作用を有する阻害剤

a) 無機活性物質: ボルドー液、酢酸銅、水酸化銅、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、硫黄;

b) チオカルバマートおよびジチオカルバマート類: ファーバム、マンゼブ、マンネブ、カーバム、メチラム、プロピネブ、チウラム、ジネブ、ジラム;

c) 有機塩素化合物(例えば、フタルイミド類、スルファミド類、クロロニトリル類): アニラジン、クロロタロニル、カプタホール、キャブタン、ホルベット、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、フルスルファミド、ヘキサクロロベンゼン、ペンタクロロフェノールおよびその塩、フタリド、トリルフルアニド、N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチル-ベンゼンスルホンアミド;

d) グアニジン類およびその他: グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン酢酸塩、イミノクタジン、イミノクタジン三酢酸塩、イミノクタジントリス(アルベシラート)、ジチアノン

F.IX) 細胞壁合成阻害剤

グルカン合成の阻害剤: バリダマイシン、ポリオキシシンB;メラニン合成阻害剤: ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロバミド、ジシクロメット(dicyclomet)、フェノキサニル;

F.X) 植物防御誘導剤

アシベンゾラルSメチル、プロベナゾール、イソチアニル、チアジニル、プロヘキサジオンカルシウム; ホスホン酸塩類: ホセチル、ホセチルアルミニウム、亜リン酸およびその塩;

10

20

30

40

50

## F.XI) 未知の作用機序

プロノポール、キノメチオナート、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフェニルアミン、フェンピラザミン、フルメトベル、フルスルファミド、フルチアニル、メタスルホカルブ、ニトラピリン、ニトロタルイソプロピル、オキシシン銅、プロキナジド、テブフロキン、テクロフタラム、トリアゾキシド、2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン、N-(シクロ-プロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロ-メトキシ-2,3-ジフルオロ-フェニル)-メチル)-2-フェニルアセトアミド、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロボキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロボキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル-アミド、メトキシ-酢酸6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチル-キノリン-4-イルエステル、N-メチル-2-{1-[5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル]-4-チアゾールカルボキサミド、3-[5-(4-メチル-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(ピリソキサゾール)、N-(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)シクロプロパン-カルボン酸アミド、5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-ピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール、2-(4-クロロ-フェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-イソオキサゾール-5-イル]-2-プロパ-2-イニルオキシ-アセトアミド；  
の相乗的に有効な量を含む。

## 【0014】

更に、1種以上の活性化化合物Iと1種以上の化合物IIとの同時施用、すなわち共同もしくは分離施用、または1種以上の活性化化合物Iと1種以上の活性化化合物IIとの逐次施用(すなわち、一方の施用直後に他方を施用することによって所望の場所、例えば、植物上において「in-situ」で混合物を生成すること)により、個々の化合物によってなし得る防除率と比較して有害生物および/または菌類の高度な防除が可能になることが見出されている。

## 【0015】

更に、本発明は、

- 少なくとも1種の活性化化合物Iと少なくとも1種の活性化化合物IIとの混合物を含む農業用組成物；
- 少なくとも1種の活性化化合物Iと少なくとも1種の活性化化合物IIとの混合物の、動物有害生物の駆除のための使用；
- 少なくとも1種の活性化化合物Iと少なくとも1種の活性化化合物IIとの混合物の、植物病原性の有害菌類の駆除のための使用；
- 動物有害生物、動物有害生物が成長しているもしくは成長し得る生息地、繁殖場所、食物供給源、植物、種子、土壌、領域、物質もしくは環境、または動物の攻撃もしくは侵入から保護すべき物質、植物、種子、土壌、表面もしくは空間を、少なくとも1種の活性化化合物Iと少なくとも1種の活性化化合物IIとの混合物の殺有害生物有効量と接触させることを含む、動物有害生物を駆除する方法；
- 農作物を少なくとも1種の活性化化合物Iと少なくとも1種の活性化化合物IIとの混合物と接触させることを含む、動物有害生物および/または植物病原性の有害菌類の攻撃または侵入から農作物を保護する方法；
- 種子を播種前および/または発芽前処理後に少なくとも1種の活性化化合物Iと少なくとも1

10

20

30

40

50

種の活性化化合物IIとの混合物と接触させることを含む、種子を土壌昆虫から保護するとともに、土壌から出てきた実生の根および芽を葉上昆虫および/または植物病原性の有害菌類から保護する方法;

ならびに

-少なくとも1種の活性化化合物Iと少なくとも1種の活性化化合物IIとの混合物を含む種子に関する。

【発明を実施するための形態】

【0016】

化合物I

DE 19547475は、3-(2,4-ジオキソ-ピリミジン-3-イル)-6-シアノ-フェニルスルフィド誘導体、ならびに農作物を害虫および雑草から保護するためのその施用について記載している。米国特許第6,509,354号は、3-(4-オキソ-ピリミジン-3-イル)-フェニルスルフィド誘導体、ならびに様々な昆虫およびダニ有害生物に対するそれらの活性について記載している。US 3755581 Aは、アリアルキナゾロン、ならびに植物病原性のバクテリアおよび菌類、昆虫、ならびに腹足類から農作物を保護するためのその施用について記載している。EP 1076053 A1は、アリアルフェニルスルフィド誘導体、ならびに昆虫およびダニから農作物を保護するためのその施用について記載している。殺有害生物用活性アリアルキナゾリノン化合物は、例えばWO2010/100189に記載されている。

10

【0017】

先行技術は、本発明による選択的アリアルキナゾリノン化合物を、殺菌および/または殺虫活性に関して予期せぬ相乗的な効果を示す他の農業用活性化化合物と組み合わせて含む農業用混合物を開示していない。

20

【0018】

上記の可変部分の定義において言及される化合物Iの有機部分(用語「ハロゲン」など)は、個々の基員を個別に列挙するための総称である。接頭辞「C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>」は、いずれの場合も、基中の炭素原子の可能な数を示す。

【0019】

用語「ハロゲン」は、いずれの場合も、フッ素、臭素、塩素またはヨウ素、特にフッ素、塩素または臭素を表す。

【0020】

本明細書中およびアルコキシ、アルコシアルキル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニルなどのアルキル部分において用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル」は、1、2、3または4個の炭素原子を有する飽和直鎖または分岐鎖の炭化水素基を指す。C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキルは、メチルまたはエチルである。またC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルはさらに、例えば、プロピル、イソプロピル、ブチル、1-メチルプロピル(sec-ブチル)、2-メチルプロピル(イソブチル)または1,1-ジメチル-エチル(tert-ブチル)である。

30

【0021】

本明細書中およびハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニルなどのハロアルキル部分において用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキル」は、1、2、3または4個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖のアルキル基(上記)であって、これらの基中の水素原子の一部または全部が上記のハロゲン原子で置換されていてよいものを指し:特にC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキル、例えばクロロメチル、プロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-プロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、2,3,3-トリフルオロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、4,4-ジフルオロブチル、4,4,4-トリフルオロブチル、3,4,4-トリフルオロブチル、3,3,4,4-テトラフルオロブチル、3,3,4,4,4-ペ

40

50

ンタフルオロブチルまたは1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルを指す。

【0022】

本明細書中で用いられる用語「 $C_1$ - $C_4$ -フルオロアルキル」または「フッ素化 $C_1$ - $C_4$ -アルキル」は、1~4個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖のアルキル基(上記)であって、これらの基中の水素原子の一部または全部がフッ素原子で置換されていてよいものを指し：例としては、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、2,3,3-トリフルオロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、4,4-ジフルオロブチル、4,4,4-トリフルオロブチル、3,4,4-トリフルオロブチル、3,3,4,4-テトラフルオロブチル、3,3,4,4,4-ペンタフルオロブチルおよび1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルが挙げられる。

10

【0023】

本明細書中およびアルケニルオキシなどのアルケニル部分において用いられる用語「 $C_2$ - $C_4$ -アルケニル」は、2~4個の炭素原子および任意の位置に二重結合を有する一不飽和の直鎖または分岐鎖の炭化水素基、例えば、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニルなどを指す。

【0024】

本明細書中およびハロアルケニルオキシ、ハロアルケニルカルボニルなどのハロアルケニル部分において用いられる用語「 $C_2$ - $C_4$ -ハロアルケニル」は、2~4個の炭素原子および任意の位置に二重結合を有する不飽和の直鎖または分岐鎖の炭化水素基(上記)であって、これらの基中の水素原子の一部または全部が上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素および臭素で置換されていてよいものを指し、例えば2-クロロビニル、2-クロロアリル(2-クロロ-2-プロペン-1-イル)、3-クロロ-2-プロペン-1-イル、3,3-ジクロロ-2-プロペン-1-イル、2-フルオロビニル、2,2-フルオロビニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペン-1-イル、2,3,3-トリフルオロ-2-プロペン-1-イル、4,4-ジフルオロ-3-ブテン-1-イル、3,4,4-トリフルオロ-3-ブテン-1-イルなどを指す。

20

【0025】

本明細書中で用いられる用語「 $C_2$ - $C_4$ -フルオロアルケニル」または「フッ素化 $C_2$ - $C_4$ -アルケニル」は、2~4個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖のアルケニル基(上記)であって、これらの基中の水素原子の一部または全部がフッ素原子で置換されていてよいものを指し；例としては以下のものが挙げられる：2-フルオロビニル、2,2-フルオロビニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペン-1-イル、2,3,3-トリフルオロ-2-プロペン-1-イル、4,4-ジフルオロ-3-ブテン-1-イルおよび3,4,4-トリフルオロ-3-ブテン-1-イル。

30

【0026】

本明細書中およびアルキニルオキシ、アルキニルカルボニルなどのアルキニル部分において用いられる用語「 $C_2$ - $C_4$ -アルキニル」は、2~4個の炭素原子および任意の位置に1個の三重結合を有する直鎖または分岐鎖の炭化水素基、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニルなどを指す。

40

【0027】

本明細書中およびハロアルキニルオキシ、ハロアルキニルカルボニルなどのハロアルキニル部分において用いられる用語「 $C_2$ - $C_4$ -ハロアルキニル」は、3~4個の炭素原子および任意の位置に単結合を有する不飽和の直鎖または分岐鎖の炭化水素基(上記)であって、これらの基中の水素原子の一部または全部が上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素および臭素で置換されていてよいものを指す。

【0028】

本明細書中およびアルコキシアルキルのアルコキシ部分において用いられる用語「 $C_1$ - $C_4$ -アルコキシ」は、酸素原子を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する飽和の直鎖または分岐鎖の炭化水素基を指す。 $C_1$ - $C_2$ -アルコキシはメトキシま

50

たはエトキシである。またC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシはさらに、例えば、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ(sec-ブトキシ)、2-メチルプロポキシ(イソブトキシ)または1,1-ジメチルエトキシ(tert-ブトキシ)である。

【0029】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルチオ」は、硫黄原子を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるアルキル基を指し；例は、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオおよびtert-ブチルチオである。

【0030】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルホニル」は、S(O)<sub>2</sub>基を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるアルキル基を指し；例は、メチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピル-スルホニル、n-ブチルスルホニルおよびtert-ブチルスルホニルである。

10

【0031】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルフィニル」は、S(O)基を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるアルキル基を指し；例として、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、イソプロピル-スルフィニル、n-ブチルスルフィニルおよびtert-ブチルスルフィニルが挙げられる。

【0032】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ」は、1~4個の炭素原子を有する酸素原子基(上記)を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるハロアルキル基であって、これらの基中の水素原子の一部または全部がフッ素原子で置換されていてよいものを指し；例として、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ、3,3-ジフルオロプロポキシ、2,3,3-トリフルオロプロポキシ、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ、4,4-ジフルオロブトキシ、4,4,4-トリフルオロブトキシ、3,4,4-トリフルオロブトキシ、3,3,4,4-テトラフルオロブトキシ、3,3,4,4,4-ペンタフルオロブトキシおよび1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルオキシが挙げられる。

20

30

【0033】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルチオ」は、硫黄原子を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるハロアルキル基を指し；例として、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、2-クロロ-2-フルオロエチルチオ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルチオ、ペンタフルオロ-エチルチオ、2,2,3,3-テトラフルオロプロピルチオ、3,3-ジフルオロプロピルチオ、2,3,3-トリフルオロプロピルチオ、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピルチオ、4,4-ジフルオロブチルチオ、4,4,4-トリフルオロブチルチオ、3,4,4-トリフルオロブチルチオ、3,3,4,4-テトラフルオロブチルチオ、3,3,4,4,4-ペンタフルオロブチルチオおよび1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルチオが挙げられる。

40

【0034】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルスルホニル」は、S(O)<sub>2</sub>基を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるハロアルキル基を指し；例として、フルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、1-フルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2,2-ジフルオロエチルスルホニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピルスルホニル、3,3-ジフルオロプロピルスルホニル、2,3,3-トリフルオロプロピルスルホニル、2,2,3,3,3-ペンタフルオ

50

ロプロピルスルホニル、4,4-ジフルオロプロチルスルホニル、4,4,4-トリフルオロプロチルスルホニル、3,4,4-トリフルオロプロチルスルホニル、3,3,4,4-テトラフルオロプロチルスルホニル、3,3,4,4,4-ペンタフルオロプロチルスルホニルおよび1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルスルホニルが挙げられる。

【0035】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキルスルフィニル」は、S(0)基を介して分子の残りの部分に結合している、1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるハロアルキル基を指し；例として、フルオロメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、1-フルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2,2-ジフルオロエチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピルスルフィニル、3,3-ジフルオロプロピルスルフィニル、2,3,3-トリフルオロプロピルスルフィニル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピルスルフィニル、4,4-ジフルオロプロチルスルフィニル、4,4,4-トリフルオロプロチルスルフィニル、3,4,4-トリフルオロプロチルスルフィニル、3,3,4,4,4-ペンタフルオロプロチルスルフィニルおよび1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルスルフィニルが挙げられる。

10

【0036】

本明細書中で用いられる用語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル」は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ基で置換された、上記に定義される直鎖または分岐鎖のC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル基を指し、特にメトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、n-ブトキシエチル、2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、2-(n-プロポキシ)エチル、2-(n-ブトキシ)エチル、2-メトキシプロピル、2-エトキシプロピル、2-(n-プロポキシ)プロピル、2-(n-ブトキシ)プロピル、3-メトキシプロピル、3-エトキシプロピル、3-(n-プロポキシ)プロピル、3-(n-ブトキシ)プロピル、4-メトキシブチルおよび4-エトキシブチルを指す。

20

【0037】

式Iの化合物の可変部分、本発明による使用および方法の特徴、および本発明の組成物の好ましい実施形態に関してさらに以下に記載される注釈は、それ自体、さらに好ましくは互いに組み合わせて有効である。

【0038】

式(1)の化合物Iおよびそれらの例は、それらの互変異性体、ラセミ混合物、個々の純粋なエナンチオマーおよびジアステレオマーならびにそれらの光学活性混合物を包含する。

30

【0039】

化合物II

F.I群からF.XI群の上記活性化合物II、その調製法およびその害菌に対する作用は一般に知られており(例えば、<http://www.hclrss.demon.co.uk/index.html>参照)、これらの活性化合物は市販されている。

【0040】

ベナラキシル、メチルN-(フェニルアセチル)-N-(2,6-キシリル)-DL-アラニナート(DE 29 03 612);メタラキシル、メチルN-(メトキシアセチル)-N-(2,6-キシリル)-DL-アラニナート(GB 15 00 581);オフラセ、(RS)- (2-クロロ-N-2,6-キシリルアセトアミド)- -ブチロラクトン[CAS RN 58810-48-3];オキサジキシル;N-(2,6-ジメチルフェニル)-2-メトキシ-N-(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)アセトアミド(GB 20 58 059);アルジモルフ、「4-アルキル-2,5(または2,6)-ジメチルモルホリン」、65~75%の2,6-ジメチルモルホリンと25~35%の2,5-ジメチルモルホリンとを含み、85%超の4-ドデシル-2,5(または2,6)-ジメチルモルホリンを含み、この場合「アルキル」にはオクチル、デシル、テトラデシルおよびヘキサデシルも含まれ、cis/trans比が1:1である[CAS RN 91315-15-0];ドジン、1-ドデシルグアニジニウムアセタート(Plant Dis. Rep., Vol. 41, p.1029 (1957));ドデモルフ、4-シクロドデシル-2,6-ジメチルモルホリン(DE-A 11 98 125);フェンプロピモルフ、(RS)-cis-4-[3-(4-tert-ブチルフェニル)-2-メチルプロピル]-2,6-ジメチルモルホリン(DE A 27 52 096);フェンプロピジン、(RS)-1-[3-(4-tert-ブチルフェニル)-2-メチルプロピル]

40

50

ピペリジン (DE A 27 52 096); グアザチン、工業銘柄のイミノジ(オクタメチレン)ジアミンの amid 化反応生成物の混合物であって、各種グアニジンおよびポリアミンを含む [CAS RN 108173-90-6]; イミノクタジン、1,1'-イミノジ(オクタメチレン)ジグアニジン (Congr. Plant Pathol., 1., p.27(1968)); スピロキサミン、(8-tert-ブチル-1,4-ジオキサスピロ[4.5]デカ-2-イル)ジエチルアミン (EP-A 281 842); トリデモルフ、2,6-ジメチル-4-トリデシルモルホリン (DE-A 11 64 152); ピリメタニル、4,6-ジメチルピリミジン-2-イルフェニルアミン (DD-A 151 404); メパニピリム、(4-メチル-6-プロパ-1-イニルピリミジン-2-イル)フェニルアミン (EP-A 224 339); シプロジニル、(4-シクロプロピル-6-メチルピリミジン-2-イル)フェニルアミン (EP-A 310 550); シクロヘキシミド、4-{(2R)-2-[(1S,3S,5S)-3,5-ジメチル-2-オキソシクロヘキシル]-2-ヒドロキシエチル}ピペリジン-2,6-ジオン [CAS RN 66-81-9]; グリセオフルピン、7-クロロ-2',4,6-トリメトキシ-6'-メチルスピロ[ベンゾフラン-2(3H),1'-シクロヘキサ-2'-エン]-3,4'-ジオン [CAS RN 126-07-8]; カスガマイシン、3-O-[2-アミノ-4-[(カルボキシイミノメチル)アミノ]-2,3,4,6-テトラデオキシ-D-アラビノ-ヘキソピラノシル]-D-chiro-イノシトール [CAS RN 6980-18-3]; ナタマイシン、(8E,14E,16E,18E,20E)-(1R,3S,5R,7R,12R,22R,24S,25R,26S)-22-(3-アミノ-3,6-ジデオキシ-D-マンノピラノシルオキシ)-1,3,26-トリヒドロキシ-12-メチル-10-オキソ-6,11,28-トリオキサトリシクロ[22.3.1.0<sup>5,7</sup>]オクタコサ-8,14,16,18,20-ペンタエン-25-カルボン酸 [CAS RN 7681-93-8]; ポリオキシン、5-(2-アミノ-5-O-カルバモイル-2-デオキシ-L-キシロンアミド)-1-(5-カルボキシ-1,2,3,4-テトラヒドロ-2,4-ジオキソピリミジン-1-イル)-1,5-ジデオキシ-D-アロフラヌロン酸 [CAS RN 22976-86-9]; ストレプトマイシン、1,1'-{1-L-(1,3,5/2,4,6)-4-[5-デオキシ-2-O-(2-デオキシ-2-メチルアミノ-L-グルコピラノシル)-3-C-ホルミル-L-リキソフラノシルオキシ]-2,5,6-トリヒドロキシシクロヘキサ-1,3-イルエン}ジグアニジン (J. Am. Chem. Soc. Vol. 69, p.1234 (1947)); ビテルタノール、-([1,1'-ビフェニル]-4-イルオキシ)--(1,1-ジメチル-エチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-エタノール (DE-A 23 24 020); プロムコナゾール、1-[4-プロモ-2-(2,4-ジクロロフェニル)テトラヒドロ-2-フラニル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (Proc. 1990 Br. Crop. Prot. Conf. - Pests Dis. Vol. 1, p. 459); シプロコナゾール、2-(4-クロロフェニル)-3-シクロプロピル-1-[1,2,4]トリアゾール-1-イルブタン-2-オール (US 4,664,696); ジフェノコナゾール、1-{2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-4-メチル-[1,3]ジオキソラン-2-イルメチル}-1H-[1,2,4]トリアゾール (GB-A 2 098 607); ジニコナゾール、(E)-[(2,4-ジクロロフェニル)メチレン]--(1,1-ジメチルエチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-エタノール (Noyaku Kagaku, 1983, Vol. 8, p. 575); エニルコナゾール(イマザリル)、1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(2-プロペニルオキシ)エチル]-1H-イミダゾール (Fruits, 1973, Vol. 28, p. 545); エポキシコナゾール、(2RS,3SR)-1-[3-(2-クロロフェニル)-2,3-エポキシ-2-(4-フルオロフェニル)プロピル]-1H-1,2,4-トリアゾール (EP-A 196 038); フェンブコナゾール、-[2-(4-クロロフェニル)エチル]-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-プロパンニトリル (Proc. 1988 Br. Crop Prot. Conf. - Pests Dis., Vol. 1, p. 33); フルキンコナゾール、3-(2,4-ジクロロフェニル)-6-フルオロ-2-[1,2,4]-トリアゾール-1-イル-3H-キナゾリン-4-オン (Proc. Br. Crop Prot. Conf.-Pests Dis., 5-3, 411 (1992)); フルシラゾール、1-{[ビス(4-フルオロフェニル)メチルシラニル]メチル}-1H-[1,2,4]トリアゾール (Proc. Br. Crop Prot. Conf.-Pests Dis., Vol. 1, p.413 (1984)); フルトリアホール、-(2-フルオロ-フェニル)--(4-フルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-エタノール (EP A 15 756); ヘキサコナゾール、2-(2,4-ジクロロフェニル)-1-[1,2,4]トリアゾール-1-イルヘキサ-2-オール (CAS RN 79983-71-4); イブコナゾール、2-[(4-クロロフェニル)メチル]-5-(1-メチルエチル)-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール (EP-A 267 778); メトコナゾール、5-(4-クロロベンジル)-2,2-ジメチル-1-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチルシクロペンタノール (GB 857 383); ミクロブタニル、2-(4-クロロフェニル)-2-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチルペンタンニトリル (CAS RN 88671-89-0); ペンコナゾール、1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)ペンチル]-1H-[1,2,4]トリアゾール (Pesticide Manual, 12th Ed



. 2000, p. 712); プロピコナゾール、1-[[2-(2,4-ジクロロフェニル)-4-プロピル-1,3-ジ  
 オキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(BE 835 579); プロクロラズ、N-(プ  
 ロピル-[2-(2,4,6-トリクロロフェノキシ)エチル])イミダゾール-1-カルボキサミド(US3,  
 991,071); プロチオコナゾール、2-[2-(1-クロロシクロプロピル)-3-(2-クロロフェニル)-  
 2-ヒドロキシプロピル]-2,4-ジヒドロ[1,2,4]トリアゾール-3-チオン(WO 96/16048); シメ  
 コナゾール、-(4-フルオロフェニル)- -[(トリメチルシリル)メチル]-1H-1,2,4-トリ  
 アゾール-1-エタノール[CAS RN 149508-90-7]、テブコナゾール、1-(4-クロロフェニル)-  
 4,4-ジメチル-3-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチルペンタン-3-オール(EP-A 40 345); テ  
 トラコナゾール、1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-3-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)プ  
 ロピル]-1H-1,2,4-トリアゾール(EP-A 234 242); トリアジメホン、1-(4-クロロフェノキシ) 10  
 -3,3-ジメチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-2-ブタノン(BE 793 867); トリア  
 ジメノール、-(4-クロロフェノキシ)- -(1,1-ジメチルエチル)-1H-1,2,4-トリアゾー  
 ル-1-エタノール(DE A 3 24 010); トリフルミゾール、(4-クロロ-2-トリフルオロメチル  
 フェニル)-(2-プロボキシ-1-[1,2,4]トリアゾール-1-イルエチリデン)-アミン(JP-A 79/1  
 19 462); トリチコナゾール、(5E)-5-[(4-クロロフェニル)メチレン]-2,2-ジメチル-1-(1H  
 -1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール(FR 26 41 277); イプロジオン、  
 N-イソプロピル-3-(3,5-ジクロロフェニル)-2,4-ジオキソイミダゾリジン-1-カルボキサ  
 ミド(GB 13 12 536); ミクロゾリン、(RS)-3-(3,5-ジクロロフェニル)-5-メトキシメチル-  
 5-メチル-1,3-オキサゾリジン-2,4-ジオン[CAS RN 54864-61-8]; プロシミドン、N-(3,5-  
 ジクロロフェニル)-1,2-ジメチルシクロプロパン-1,2-ジカルボキシイミド(US 3,903,090) 20  
 ); ピンクロゾリン、3-(3,5-ジクロロフェニル)-5-メチル-5-ビニルオキサゾリジン-2,4-  
 ジオン(DE-A 22 07 576); ファーバム、ジメチルジチオカルバミン酸鉄(3+)(US1,972,961)  
 ); ナーバム、エチレンビス(ジチオカルバミン酸)ニナトリウム(US2,317,765); マンネブ、  
 エチレンビス(ジチオカルバミン酸)マンガン(US2,504,404); マンゼブ、エチレンビス(ジ  
 チオカルバミン酸)マンガンポリマー錯体亜鉛塩(GB 996 264); カーバム、メチルジチオカ  
 ルバミン酸(US2,791,605); メチラム、エチレンビス(ジチオカルバミン酸)亜鉛アンモニ  
 化物(US3,248,400); プロピネブ、プロピレンビス(ジチオカルバミン酸)亜鉛ポリマー(BE  
 611 960); ポリカーバメート、ビス(ジメチルカルバモジチオアト- S, S')[ $\mu$ -[[1,2-エ  
 タンジールビス[カルバモジチオアト- S, S']](2-)]ジ[亜鉛][CAS RN 64440-88-6]; チ  
 ウラム、ビス(ジメチルチオカルバモイル)ジスルフィド(DE-A 642 532); ジラム、ジメチ  
 ルジチオカルバマート[CAS RN 137-30-4]; ジネブ、エチレンビス(ジチオカルバミン酸)亜  
 鉛(US2,457,674); アニラジン、4,6-ジクロロ-N-(2-クロロフェニル)-1,3,5-トリアジン-2  
 -アミン(US2,720,480); ベノミル、N-ブチル-2-アセチルアミノベンゾイミダゾール-1-カ  
 ルボキサミド(US3,631,176); ポスカリド、2-クロロ-N-(4'-クロロピフェニル-2-イル)ニ  
 コチンアミド(EP-A 545 099); カルペンダジム、(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)カルバ  
 ミン酸メチル(US3,657,443); カルボキシシ、5,6-ジヒドロ-2-メチル-N-フェニル-1,4-オ  
 キサチン-3-カルボキサミド(US3,249,499); オキシカルボキシシ、5,6-ジヒドロ-2-メチ  
 ル-1,4-オキサチン-3-カルボキシアニリド4,4-ジオキシド(US3,399,214); シアゾファミ  
 ド、4-クロロ-2-シアノ-N,N-ジメチル-5-(4-メチルフェニル)-1H-イミダゾール-1-スルホ  
 ンアミド(CAS RN 120116-88-3); ダゾメット、3,5-ジメチル-1,3,5-チアジアジナン-2-チ  
 オン(Bull. Soc. Chim. Fr. Vol. 15, p. 891 (1897)); ジフルフェンゾピル、2-{1-[4-(3  
 ,5-ジフルオロフェニル)セミカルパゾノ]エチル}ニコチン酸[CAS RN 109293-97-2]; ジチ  
 アノン、5,10-ジオキソ-5,10-ジヒドロナフト[2,3-b][1,4]ジチイン-2,3-ジカルボニトリ  
 ル(GB 857 383); ファモキサドン、(RS)-3-アニリノ-5-メチル-5-(4-フェノキシフェニル)  
 -1,3-オキサゾリジン-2,4-ジオン[CAS RN 131807-57-3]; フェンアミドン、(S)-1-アニリ  
 ノ-4-メチル-2-メチルチオ-4-フェニルイミダゾリン-5-オン[CAS RN 161326-34-7]; フェ  
 ナリモル、-(2-クロロフェニル)- -(4-クロロフェニル)-5-ピリミジンメタノール(GB  
 12 18 623); フベリダゾール、2-(2-フラニル)-1H-ベンゾイミダゾール(DE-A 12 09 799);  
 フルトラニル、, , -トリフルオロ-3'-イソプロボキシ-o-トルアニリド(JP 1104514)  
 ); フラメトピル、5-クロロ-N-(1,3-ジヒドロ-1,1,3-トリメチル-4-イソベンゾフラニル)-1 40  
 50

,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド[CAS RN 123572-88-3];イソプロチオラン、1,3-ジチオラン-2-イリデンマロン酸ジイソプロピル(Proc. Insectic. Fungic. Conf. 8. Vol. 2, p. 715 (1975));メプロニル、3'-イソプロポキシ-o-トルアニリド(US3,937,840);ヌアリモール、-(2-クロロフェニル)--(4-フルオロフェニル)-5-ピリミジンメタノール(GB 12 18 623);フルオピコリド(ピコベンザミド(picobenzamid))、2,6-ジクロロ-N-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルメチル)ベンズアミド(WO 99/42447);プロベナゾール、3-アリルオキシ-1,2-ベンゾチアゾール1,1-ジオキシド(Agric. Biol. C hem. Vol. 37, p. 737 (1973));プロキナジド、6-ヨード-2-プロポキシ-3-プロピルキナゾリン-4(3H)-オン(WO 97/48684);ピリフェノックス、2',4'-ジクロロ-2-(3-ピリジル)アセトフェノン(EZ)-0-メチルオキシム(EP 49 854);ピロキロン、1,2,5,6-テトラヒドロピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(GB 139 43 373);キノキシフェン、5,7-ジクロロ-4-(4-フルオロフェノキシ)キノリン(US5,240,940);シルチオフアム、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[CAS RN 175217-20-6];チアベンダゾール、2-(1,3-チアゾール-4-イル)ベンゾイミダゾール(US3,017,415);チフルザミド、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[CAS RN 130000-40-7];チオフアナートメチル、1,2-フェニレンビス(イミノカルボノチオイル)ビス(ジメチルカルバマート)(DE-A 19 30 540);チアジニル、3'-クロロ-4,4'-ジメチル-1,2,3-チアジアゾール-5-カルボキシアニリド[CAS RN 22358 0-51-6];トリシクラゾール、5-メチル-1,2,4-トリアゾロ[3,4-b][1,3]ベンゾチアゾール[CAS RN 41814-78-2];トリホリン、N,N'-{ピペラジン-1,4-ジイルビス[(トリクロロメチル)メチレン]}ジホルムアミド(DE A 19 01 421);5-クロロ-7-(4-メチルペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン(WO 98/46607)およびその他のトリアゾロピリミジン(EP-A 71 792;EP-A 141 317;WO 2003/009687;WO 20 05/087771;WO 2005/087772;WO 2005/087773;WO 2006/087325;WO 2006/092428);ボルドー液、CuSO<sub>4</sub> × 3Cu(OH)<sub>2</sub> × 3CaSO<sub>4</sub>の混合物[CAS RN 8011-63-0];酢酸銅、Cu(OCOCH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>[CAS RN 8011-63-0];塩基性塩化銅、Cu<sub>2</sub>Cl(OH)<sub>3</sub>[CAS RN 1332-40-7];塩基性硫酸銅、CuSO<sub>4</sub>[CAS RN 1344-73-6];ピナパクリル、(RS)-2-sec-ブチル-4,6-ジニトロフェニル3-メチルクロトナート[CAS RN 485-31-4];ジノカップ、2,6-ジニトロ-4-オクチルフェニルクロトナートと2,4-ジニトロ-6-オクチルフェニルクロトナートとの混合物、ただし、「オクチル」は1-メチルヘブチル、1-エチルヘキシルおよび1-プロピルペンチルの混合物(US2,526,660);ジノブトン、(RS)-2-sec-ブチル-4,6-ジニトロフェニルイソプロピルカーボナート[CAS RN 973-21-7];ニトロタルイソプロピル、ジイソプロピル5-ニトロイソフタラート(Proc. B r. Insectic. Fungic. Conf. 7., Vol. 2, p. 673 (1973));フェンピクロニル、4-(2,3-ジクロロフェニル)-1H-ピロール-3-カルボニトリル(Proc. 1988 Br. Crop Prot. Conf. - Pests Dis., Vol. 1, p. 65);フルジオキサニル、4-(2,2-ジフルオロベンゾ[1,3]ジオキサゾール-4-イル)-1H-ピロール-3-カルボニトリル(The Pesticide Manual, publ. The British Crop Protection Council, 10th ed. 1995, p. 482);アシベンゾラルSメチル、メチル1,2,3-ベンゾチアジアゾール-7-カルボチオアート[CAS RN 135158-54-2];フルベンチアバリカルブ(ベンチアバリカルブ)、イソプロピル{(S)-1-[(1R)-1-(6-フルオロベンゾ-チアゾール-2-イル)-エチルカルバモイル]-2-メチルプロピル}カルバマート(JP-A 09/323 984);カルプロパミド、2,2-ジクロロ-N-[1-(4-クロロフェニル)エチル]-1-エチル-3-メチルシクロプロパン-カルボキサミド[CAS RN 104030-54-8];クロロタロニル、2,4,5,6-テトラクロロイソフタロニトリル(US3,290,353);シフルフェナミド、(Z)-N-[-(シクロプロピルメトキシイミノ)-2,3-ジフルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-2-フェニルアセトアミド(WO 96/19442);シモキサニル、1-(2-シアノ-2-メトキシイミノアセチル)-3-エチル尿素(US3,957,847);ジクロメジン、6-(3,5-ジクロロフェニル-p-トリル)ピリダジン-3(2H)-オン(US4,052,395);ジクロシメット、(RS)-2-シアノ-N-[(R)-1-(2,4-ジクロロフェニル)エチル]-3,3-ジメチルブチルアミド[CAS RN 139920-32-4];ジエトフェンカルブ、イソプロピル3,4-ジエトキシカルバラート(EP A 78 663);エジフェンホス、0-エチルS,S-ジフェニルホスホロジチオアート(DE-A 14 93 736);エタボキサム、N-(シアノ-2-チエニ

10

20

30

40

50

ルメチル)-4-エチル-2-(エチルアミノ)-5-チアゾールカルボキサミド(EP-A 639 574);フェンヘキサミド、N-(2,3-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニル)-1-メチルシクロヘキサンカルボキサミド(Proc. Br. Crop Prot. Conf. - Pests Dis., 1998, Vol. 2, p. 327);フェンチン酢酸塩、トリフェニルスズ(US3,499,086);フェノキサニル、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)プロパンアミド(EP-A 262 393);フェリムゾン、(Z)-2'-メチルアセトフェノン-4,6-ジメチルピリミジン-2-イルヒドラゾン[CAS RN 892 69-64-7];フルアジナム、3-クロロ-N-[3-クロロ-2,6-ジニトロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジンアミン(The Pesticide Manual, publ. The British Crop Protection Council, 10th ed. (1995), p. 474);ホセチル、ホセチルアルミニウム、エチルホスホナート(FR 22 54 276);イプロバリカルブ、イソプロピル[(1S)-2-メチル-1-(1-p-トリルエチルカルバモイル)プロピル]カルバマート(EP-A 472 996);ヘキサクロロベンゼン(C. R. Seances Acad. Agric. Fr., Vol. 31, p 24 (1945));マンジプロパミド、(RS)-2-(4-クロロフェニル)-N-[3-メトキシ-4-(プロパ-2-イニルオキシ)フェネチル]-2-(プロパ-2-イニルオキシ)アセトアミド(WO 03/042166);メトラフェノン、3'-プロモ-2,3,4,6'-テトラメトキシ-2',6-ジメチルベンゾフェノン(US5,945,567);ペンシクロン、1-(4-クロロベンジル)-1-シクロペンチル-3-フェニル尿素(DE-A 27 32 257);ペンチオピラド、(RS)-N-[2-(1,3-ジメチルブチル)-3-チエニル]-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(JP 10/130268);プロパモカルブ、イソプロピル3-(ジメチルアミノ)プロピルカルバマート(DE-A 15 67 169);フタリド(DE-A 16 43 3 47);トルクロホスメチル、0-2,6-ジクロロ-p-トリル0,0-ジメチルホスホロチオアート(GB 14 67 561);キントゼン、ペンタクロロニトロベンゼン(DE-A 682 048);ゾキサミド、(RS)-3,5-ジクロロ-N-(3-クロロ-1-エチル-1-メチル-2-オキソプロピル)-p-トルアミド[CAS RN 156052-68-5];カプタホール、N-(1,1,2,2-テトラクロロエチルチオ)シクロヘキサ-4-エン-1,2-ジカルボキシイミド(Phyto-pathology, Vol. 52, p. 754 (1962));キャプタン、N-(トリクロロメチルチオ)シクロヘキサ-4-エン-1,2-ジカルボキシイミド(US2,553,770);ジクロフルアニド、N-ジクロロフルオロメチルチオ-N,N-ジメチル-N-フェニルスルファミド(DE-A 11 93 498);ホルペット、N-(トリクロロメチルチオ)フタルイミド(US2,553,770);トリルフルアニド、N-ジクロロフルオロメチルチオ-N,N-ジメチル-N-p-トリルスルファミド(DE-A 11 93 498);ジメトモルフ、3-(4-クロロフェニル)-3-(3,4-ジメトキシフェニル)-1-モルホリン-4-イル-プロペノン(EP A 120 321);フルメトベル、2-(3,4-ジメトキシフェニル)-N-エチル- , , -トリフルオロ-N-メチル-p-トルアミド[AGROW no. 243, 22 (1995)];フルモルフ、3-(4-フルオロフェニル)-3-(3,4-ジメトキシフェニル)-1-モルホリン-4-イル-プロペノン(EP-A 860 438);N-(4'-プロモピフェニル-2-イル)-4-ジフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボキサミド、N-(4'-トリフルオロメチルピフェニル-2-イル)-4-ジフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボキサミド、N-(4'-クロロ-3'-フルオロピフェニル-2-イル)-4-ジフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボキサミド(WO 03/66610);N-(3',4'-ジクロロ-4-フルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチルピラゾール-4-カルボキサミド、およびN(3',4'-ジクロロ-5フルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1メチルピラゾール-4-カルボキサミド(WO 03/70705);N-(2-シアノフェニル)-3,4-ジクロロイソチアゾール-5-カルボキサミド(WO 99/24413);N-(2-(4-[3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-イニルオキシ]-3-メトキシフェニル)エチル)-2-メタンスルホニルアミノ-3-メチルブチルアミド、N-(2-(4-[3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-イニルオキシ]-3-メトキシフェニル)エチル)-2-エタンスルホニルアミノ-3-メチルブチルアミド(WO 04/49804);N-(2-ピシクロプロパ-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドは、ジアステレオマーN-(trans-2-ピシクロプロパ-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドとN-(cis-2-ピシクロ-プロパ-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドとの混合物である(WO 03/074491およびWO 2006/015866);3-[5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチルイソオキサゾリジン-3-イル]ピリジン(EP-A 10 35 122);2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン(WO 03/14103);N,N-ジメチル-3-(3-プロ

モ-6-フルオロ-2-メチルインドール-1-スルホニル)-[1,2,4]トリアゾール-1-スルホンアミド(EP-A 10 31 571);メチル(2-クロロ-5-[1-(3-メチルベンジルオキシイミノ)エチル]ベンジル)カルバマート、メチル(2-クロロ-5-[1-(6-メチルピリジン-2-イルメトキシイミノ)エチル]ベンジル)カルバマート(EP-A 12 01 648);メチル3-(4-クロロフェニル)-3-(2-イソプロポキシカルボニルアミノ-3-メチルブチルアミノ)プロピオナート(EP-A 10 28 125);アゾキシストロピン、メチル2-{2-[6-(2-シアノ-1-ビニルペンタ-1,3-ジエニルオキシ)ピリミジン-4-イルオキシ]フェニル}-3-メトキシアクリラート(EP-A 382 375)、ジモキシストロピン、(E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-[ (2,5-キシリルオキシ)-o-トリル]アセトアミド(EP-A 477 631);フルオキサストロピン、(E)-{2-[6-(2-クロロフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イルオキシ]フェニル}(5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン-3-イル)メタノンO-メチルオキシム(WO 97/27189);クレソキシムメチル、メチル(E)-メトキシイミノ[ (o-トリルオキシ)-o-トリル]アセタート(EP-A 253 213);メトミノストロピン、(E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-フェノキシフェニル)アセトアミド(EP-A 398 692);オリサストロピン、(2E)-2-(メトキシイミノ)-2-{2-[(3E,5E,6E)-5-(メトキシイミノ)-4,6-ジメチル-2,8-ジオキサ-3,7-ジアザノナ-3,6-ジエン-1-イル]フェニル}-N-メチルアセトアミド(WO 97/15552);ピコキシストロピン、メチル3-メトキシ-2-[2-(6-トリフルオロ-メチルピリジン-2-イルオキシメチル)フェニル]アクリラート(EP-A 278 595);ピラクロストロピン、メチルN-{2-[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イルオキシメチル]フェニル}(N-メトキシ)カルバマート(WO 96/01256);トリフロキシストロピン、メチル(E)-メトキシイミノ-{(E)- [1-( ( , , -トリフルオロ-m-トリル)エチリデンアミノオキシ]-o-トリル}アセタート(EP-A 460 575);メチル2-[オルト-(2,5-ジ-メチルフェニルオキシメチレン)フェニル]-3-メトキシアクリラート(EP-A 226 917);5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾール[1,5-a]ピリミジン(WO 98/46608);3,4-ジクロロ-N-(2-シアノフェニル)イソチアゾール-5-カルボキサミド(WO 99/24413)、式IIIの化合物(WO 04/049804);N-(2-(4-[3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-イニルオキシ]-3-メトキシフェニル)エチル)-2-メタンスルホニルアミノ-3-メチルブチルアミド、およびN-(2-(4-[3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-イニルオキシ]-3-メトキシフェニル)エチル)-2-エタンスルホニルアミノ-3-メチルブチルアミド(WO 03/66609);2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン(WO 03/14103);N,N-ジメチル-3-(3-ブromo-6-フルオロ-2-メチルインドール-1-スルホニル)-[1,2,4]トリアゾール-1-スルホンアミド(WO 03/053145);メチル3-(4-クロロフェニル)-3-(2-イソプロポキシカルボニルアミノ-3-メチルブチルアミノ)-プロパノアート(EP-A 1028125)。

10

20

30

【0041】

好ましい例

好ましい式Iの化合物I

本発明の殺有害生物剤混合物における式Iの化合物Iの使用に関して、本明細書中以下に定義されるとおりに置換基が選択される式Iの化合物Iが好ましい。

【0042】

好ましいのは、R<sup>1</sup>が2,2,2-トリフルオロエチルである式(1)の化合物Iである。

【0043】

好ましいのは、R<sup>2</sup>が、塩素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルまたはシアノから選択される、式(1)の化合物Iである。

40

【0044】

好ましいのは、R<sup>2</sup>がメチルである式(1)の化合物Iである。

【0045】

好ましいのは、R<sup>3</sup>が、水素、フッ素、塩素、メチルまたはトリフルオロメチルから選択される、式(1)の化合物Iである。

【0046】

好ましいのは、R<sup>3</sup>がフッ素である式(1)の化合物である。

【0047】

50

特に好ましいのは、 $R^2$ が、塩素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルまたはシアノから選択され、 $R^3$ が、水素、フッ素、塩素、メチルまたはトリフルオロメチルから選択される、式(1)の化合物Iである。

【0048】

特により好ましいのは、 $R^3$ がフッ素であり、且つ $R^2$ がメチルである、式(1)の化合物Iである。

【0049】

式(1)の化合物Iの1つの好ましい実施形態において、 $k$ は0である。

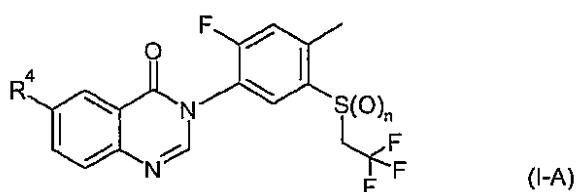
【0050】

式(1)の化合物Iの別の好ましい実施形態において、 $k$ は、1、2または3であり、且つ $R^4$ は、整数 $k$ とは独立に、フッ素、塩素、CN、 $NO_2$ 、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、またはトリフルオロメトキシから選択される。

【0051】

特に好ましいのは、式(1-A)：

【化2】



20

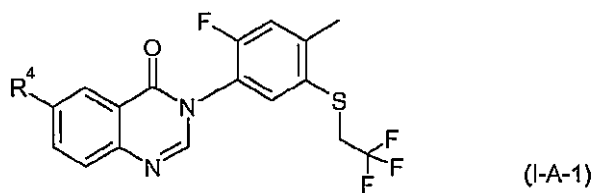
【0052】

(式中、 $R^4$ は、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択され、且つ $n$ は、0または1である)で表される化合物Iである。

【0053】

特に好ましいのは、式(1-A-1)：

【化3】



30

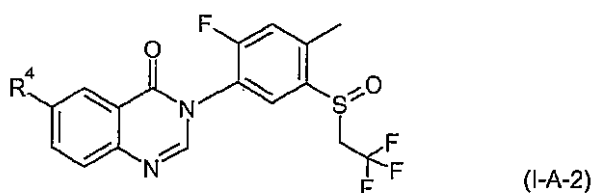
【0054】

(式中、 $R^4$ は、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択される)で表される化合物Iである。

【0055】

特に好ましいのは、式(1-A-2)：

【化4】



40

【0056】

(式中、 $R^4$ は、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択される)

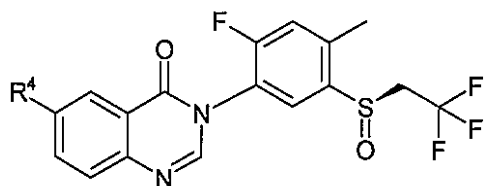
50

で表される化合物Iである。

【0057】

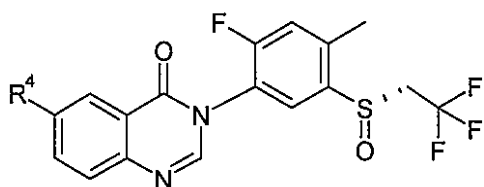
式I-A-2の化合物Iはキラルスルホキッド基を有し、これにより硫黄原子においてR配置またはS配置を有する2つのエナンチオマーを形成する：

【化5】



(I-A-2), R-エナンチオマー

10



(I-A-2), S-エナンチオマー

20

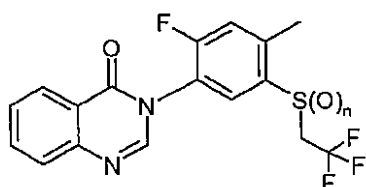
【0058】

両エナンチオマーならびに両エナンチオマーの混合物、またはラセミ化合物は、本発明の特に好ましい化合物である。

【0059】

特に好ましいのは、式(I-B)：

【化6】



(I-B)

30

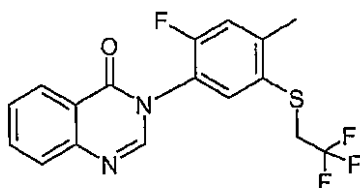
【0060】

(式中、nは0または1である)  
で表される化合物Iである。

【0061】

特に好ましいのは、式(I-B-1)：

【化7】



(I-B-1)

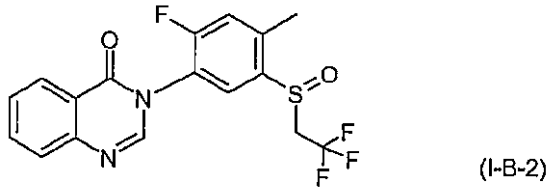
40

で表される化合物Iである。

【0062】

特に好ましいのは、式(I-B-2)：

## 【化8】



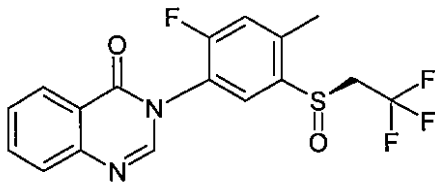
で表される化合物Iである。

## 【0063】

式(I-B-2)の化合物Iはキラルスルホキシド基を有し、これにより硫黄原子においてR配置またはS配置を有する以下の2つのエナンチオマーを形成する：

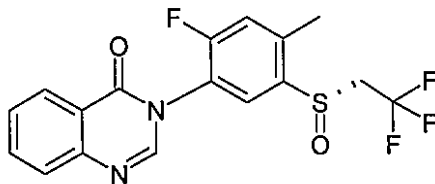
10

## 【化9】



(I-B-2), R-エナンチオマー

20



(I-B-2), S-エナンチオマー

## 【0064】

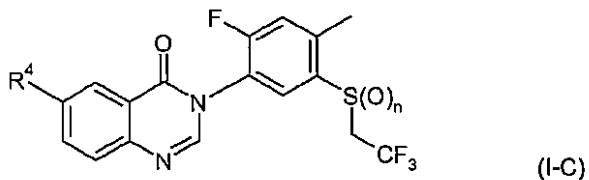
両エナンチオマーならびに両エナンチオマーの混合物、またはラセミ化合物は、本発明の特に好ましい化合物Iである。

30

## 【0065】

本発明の好ましいアリールキナゾリノン化合物Iの例は、以下の式(I-C)：

## 【化10】



## 【0066】

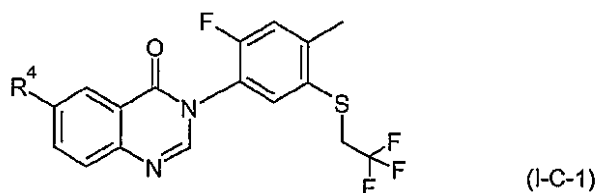
(式中、R<sup>4</sup>は、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択され、且つnは0または1である)で表されるアリールキナゾリノン化合物Iである。

40

## 【0067】

さらに特に好ましい本発明の化合物は、式(I-C-1)：

## 【化11】



## 【0068】

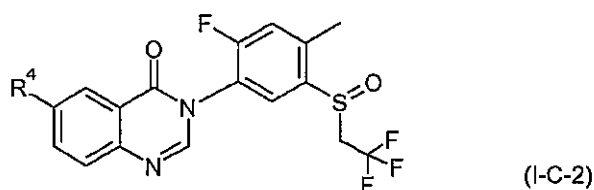
(式中、R<sup>4</sup>は、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択される)  
で表される化合物である。

10

## 【0069】

さらに特に好ましい本発明の化合物は、式(I-C-2)：

## 【化12】



20

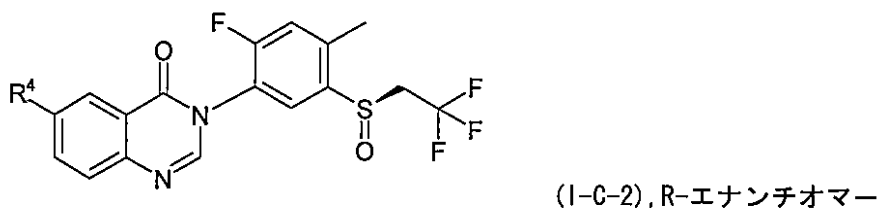
## 【0070】

(式中、R<sup>4</sup>は、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択される)  
で表される化合物である。

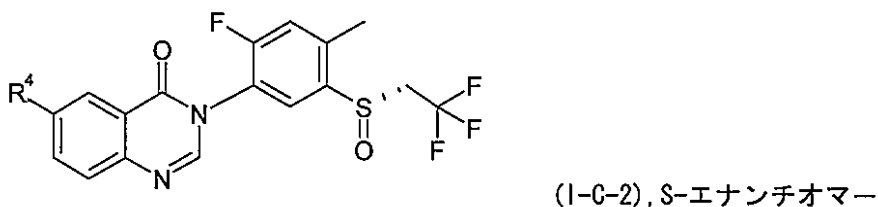
## 【0071】

式I-C-2の化合物はキラルスルホキシル基を有し、これにより硫黄原子においてR配置またはS配置を有する2つのエナンチオマーを形成する：

## 【化13】



30



40

## 【0072】

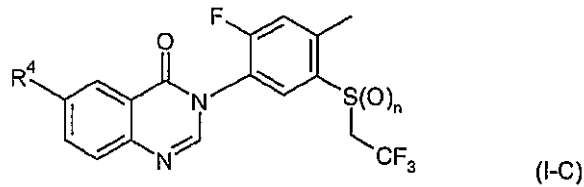
両エナンチオマーならびに両エナンチオマーの混合物、またはラセミ化合物は、本発明の特に好ましい化合物である。

## 【0073】

本発明の特に好ましいアリアルキナゾリノン化合物Iの例は、式(I-C)



## 【化14】



## 【0074】

(式中、 $R^4$ および $n$ は、表C.I.1の1つの列において定義される)  
で表されるアリールキナゾリノン化合物Iである。

10

## 【表1】

表 C.I.1:

化合物 C.I	n	$R^4$
C.I-1	0	H
C.I-2	0	CH <sub>3</sub>
C.I-3	0	CF <sub>3</sub>
C.I-4	0	F
C.I-5	0	Cl
C.I-6	0	Br
C.I-7	0	CN
C.I-8	0	OCH <sub>3</sub>
C.I-9	0	OCHF <sub>2</sub>
C.I-10	0	OCF <sub>3</sub>

化合物 C.I	n	$R^4$
C.I-11	1	H
C.I-12	1	CH <sub>3</sub>
C.I-13	1	CF <sub>3</sub>
C.I-14	1	F
C.I-15	1	Cl
C.I-16	1	Br
C.I-17	1	CN
C.I-18	1	OCH <sub>3</sub>
C.I-19	1	OCHF <sub>2</sub>
C.I-20	1	OCF <sub>3</sub>

20

## 【0075】

## 式Iの化合物の一般的な調製方法

式Iの化合物の調製は、有機化学の標準的な方法に従って、例えば、WO 2010/100189に記載されている方法または実施例によって、この文献に示される経路に限定されることなく達成することができる。

## 【0076】

## 群Fから選択される好ましい活性化合物II

本発明の農薬混合物における使用に関して、下の段落に記載される化合物C.IIが特に好ましい。

30

## 【0077】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.Ia)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはアゾキシストロピン、フルオキサストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピンまたはトリフロキシストロピンである。

## 【0078】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.Ib)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはシアゾファミドである。

## 【0079】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.Ic)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはピキサフェン、ボスカリド、フルオピラム、フルキサピロキサド、イソピラザム、ペンフルフェン、ペンチオピラドまたはセダキサンである。

40

## 【0080】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.Id)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはアメクトラジンまたはシルチオフラムである。

## 【0081】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.IIa)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはジフェノコナゾール、エポキシコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、イブコナゾール、メトコナゾール、プロチオコナ

50

ゾール、テブコナゾール、トリチコナゾールまたはプロクロラズである。

【0082】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.IIb)から選択される。本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.IIIa)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはメタラキシルおよびメフェノキサム(メタラキシル-M)から選択される。

【0083】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.IIIb)から選択される。

【0084】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.IVa)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはベノミル、カルベンダジム、およびチオファネートメチルである。

10

【0085】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.IVb)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはエタボキサム、フルピコリドまたはピリオフェノンである。

【0086】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.Va)から選択される。本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.Vb)から選択される。

【0087】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIa)から選択される。本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIb)から選択される。

20

【0088】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIa)から選択される。本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIb)から選択される。本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIc)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはジメトモルフである。本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIId)から選択される。

【0089】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIIa)から選択される。さらに好ましくは化合物IIは硫黄である。さらに好ましくは化合物IIは、酢酸銅、水酸化銅、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅から選択される銅塩である。

30

【0090】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIIb)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはマンゼブ、メチラムまたはプロピネブである。

【0091】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIIc)から選択される。さらに好ましくは化合物IIはクロロタロニルである。

【0092】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.VIIId)から選択される。

【0093】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.IX)から選択される。

40

【0094】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.X)から選択される。さらに好ましくは化合物IIは亜リン酸またはその塩である。

【0095】

本発明の農薬混合物における使用に関して、化合物IIは群F.XI)から選択される。

【0096】

化合物IIとしてアゾキシストロピンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてフルオキサストロピンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてピコキシストロピンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてピラクロストロピンを含む農薬混

50

化合物が特に好ましい。化合物IIとしてトリフロキシストロピンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてシアゾファミドを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてピキサフェンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてボスカリドを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてフルオピラムを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてフルキサピロキサドを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてイソピラザムを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてペンフルフェンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてペンチオピラドを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてセダキサンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてアメトクトラジンを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物シルチオフラムを含む農薬混合物が特に好ましい。

10

## 【0097】

化合物IIとしてエポキシコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてジフェノコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてフルキンコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてフルトリアホールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてフルシラゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてイブコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてメトコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてプロチオコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてテブコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてトリチコナゾールを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物プロクロラズを含む農薬混合物が特に好ましい。

20

## 【0098】

化合物IIとして化合物メタラキシルを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物メフェノキサム(メタラキシル-M)を含む農薬混合物が特に好ましい。

## 【0099】

化合物IIとしてベノミルを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物カルベンダジムを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物チオフアナートメチルを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてエタボキサムを含む農薬混合物が特に好ましい。

## 【0100】

化合物IIとしてフルピコリドを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとしてピリオフェノンを含む農薬混合物が特に好ましい。

30

## 【0101】

化合物IIとしてジメトモルフを含む農薬混合物が特に好ましい。

## 【0102】

化合物IIとして化合物銅塩を含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして硫黄を含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物マンゼブを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物メチラムを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物プロピネブを含む農薬混合物が特に好ましい。化合物IIとして化合物クロロタロニルを含む農薬混合物が特に好ましい。

## 【0103】

化合物IIとし化合物垂リン酸を含む農薬混合物が特に好ましい。

40

## 【0104】

好ましい本発明の混合物

群Mの化合物IIがアゾキシストロピンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがピコキシストロピンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがピラクロストロピンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがトリフロキシストロピンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

## 【0105】

50

群Mの化合物IIがピキサフェンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがボスカリドであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがフルオピラムであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがフルキサピロキサドであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがイソピラザムであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがペンフルフェンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがペンチオピラドであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがセダキサンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

10

**【0106】**

化合物IIがアメトクトラジンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。化合物IIがシルチオフアムであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがジフェノコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがエポキシコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがフルキンコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがフルシラゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがフルトリアホールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがイプコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがメトコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがプロチオコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがテブコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがトリチコナゾールであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがプロクロラズであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

20

**【0107】**

群Mの化合物IIがメタラキシルであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがメフェノキサム(メタラキシル-M)であり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

30

**【0108】**

群Mの化合物IIがベノミルであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがカルペンダジムであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがチオフアネートメチルであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

**【0109】**

群Mの化合物IIがエタボキサムであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがフルピコリドであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがピリオフェノンであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

40

**【0110】**

群Mの化合物IIがジメトモルフであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

**【0111】**

群Mの化合物IIが銅塩であり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIが硫黄であり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

50

## 【 0 1 1 2 】

群Mの化合物IIがマンネブであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。群Mの化合物IIがメチラムであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

## 【 0 1 1 3 】

群Mの化合物IIがクロロタロニルであり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

## 【 0 1 1 4 】

群Mの化合物IIが垂リン酸であり、式Iの化合物Iが表C.1.1の化合物である本発明の混合物が特に好ましい。

下記の表Mに、本発明の混合物における表C.1.1に定義される式Iの活性化合物Iと群Fの活性化合物IIとの好ましい組合せを示す。

【表 2】

表 M:

混合物	化合物-I	化合物-II	混合物	化合物-I	化合物-II
M.1	C.I-1	アゾキシストロビン	M.201	C.I-1	メタラキシル
M.2	C.I.-3	アゾキシストロビン	M.202	C.I.-3	メタラキシル
M.3	C.I-4	アゾキシストロビン	M.203	C.I-4	メタラキシル
M.4	C.I-9	アゾキシストロビン	M.204	C.I-9	メタラキシル
M.5	C.I-10	アゾキシストロビン	M.205	C.I-10	メタラキシル
M.6	C.I-11	アゾキシストロビン	M.206	C.I-11	メタラキシル
M.7	C.I-13	アゾキシストロビン	M.207	C.I-13	メタラキシル
M.8	C.I-14	アゾキシストロビン	M.208	C.I-14	メタラキシル
M.9	C.I-19	アゾキシストロビン	M.209	C.I-19	メタラキシル
M.10	C.I-20	アゾキシストロビン	M.210	C.I-20	メタラキシル
M.11	C.I-1	ピコキシストロビン	M.211	C.I-1	メフェノキサム
M.12	C.I.-3	ピコキシストロビン	M.212	C.I.-3	メフェノキサム
M.13	C.I-4	ピコキシストロビン	M.213	C.I-4	メフェノキサム
M.14	C.I-9	ピコキシストロビン	M.214	C.I-9	メフェノキサム
M.15	C.I-10	ピコキシストロビン	M.215	C.I-10	メフェノキサム
M.16	C.I-11	ピコキシストロビン	M.216	C.I-11	メフェノキサム
M.17	C.I-13	ピコキシストロビン	M.217	C.I-13	メフェノキサム
M.18	C.I-14	ピコキシストロビン	M.218	C.I-14	メフェノキサム
M.19	C.I-19	ピコキシストロビン	M.219	C.I-19	メフェノキサム
M.20	C.I-20	ピコキシストロビン	M.220	C.I-20	メフェノキサム
M.21	C.I-1	ピラクロストロビン	M.221	C.I-1	カルベンダジム
M.22	C.I.-3	ピラクロストロビン	M.222	C.I.-3	カルベンダジム
M.23	C.I-4	ピラクロストロビン	M.223	C.I-4	カルベンダジム
M.24	C.I-9	ピラクロストロビン	M.224	C.I-9	カルベンダジム
M.25	C.I-10	ピラクロストロビン	M.225	C.I-10	カルベンダジム
M.26	C.I-11	ピラクロストロビン	M.226	C.I-11	カルベンダジム
M.27	C.I-13	ピラクロストロビン	M.227	C.I-13	カルベンダジム
M.28	C.I-14	ピラクロストロビン	M.228	C.I-14	カルベンダジム
M.29	C.I-19	ピラクロストロビン	M.229	C.I-19	カルベンダジム
M.30	C.I-20	ピラクロストロビン	M.230	C.I-20	カルベンダジム
M.31	C.I-1	トリフロキシストロビン	M.231	C.I-1	ベノミル
M.32	C.I.-3	トリフロキシストロビン	M.232	C.I.-3	ベノミル
M.33	C.I-4	トリフロキシストロビン	M.233	C.I-4	ベノミル
M.34	C.I-9	トリフロキシストロビン	M.234	C.I-9	ベノミル
M.35	C.I-10	トリフロキシストロビン	M.235	C.I-10	ベノミル
M.36	C.I-11	トリフロキシストロビン	M.236	C.I-11	ベノミル
M.37	C.I-13	トリフロキシストロビン	M.237	C.I-13	ベノミル

10

20

30

40

混合物	化合物-I	化合物-II	混合物	化合物-I	化合物-II
M.38	C.I-14	トリフロキシストロビン	M.238	C.I-14	ベノミル
M.39	C.I-19	トリフロキシストロビン	M.239	C.I-19	ベノミル
M.40	C.I-20	トリフロキシストロビン	M.240	C.I-20	ベノミル
M.41	C.I-1	フルオキサストロビン	M.241	C.I-1	シアゾファミド
M.42	C.I-3	フルオキサストロビン	M.242	C.I-3	シアゾファミド
M.43	C.I-4	フルオキサストロビン	M.243	C.I-4	シアゾファミド
M.44	C.I-9	フルオキサストロビン	M.244	C.I-9	シアゾファミド
M.45	C.I-10	フルオキサストロビン	M.245	C.I-10	シアゾファミド
M.46	C.I-11	フルオキサストロビン	M.246	C.I-11	シアゾファミド
M.47	C.I-13	フルオキサストロビン	M.247	C.I-13	シアゾファミド
M.48	C.I-14	フルオキサストロビン	M.248	C.I-14	シアゾファミド
M.49	C.I-19	フルオキサストロビン	M.249	C.I-19	シアゾファミド
M.50	C.I-20	フルオキサストロビン	M.250	C.I-20	シアゾファミド
M.51	C.I-1	ボスカリド	M.251	C.I-1	フルトリアホール
M.52	C.I-3	ボスカリド	M.252	C.I-3	フルトリアホール
M.53	C.I-4	ボスカリド	M.253	C.I-4	フルトリアホール
M.54	C.I-9	ボスカリド	M.254	C.I-9	フルトリアホール
M.55	C.I-10	ボスカリド	M.255	C.I-10	フルトリアホール
M.56	C.I-11	ボスカリド	M.256	C.I-11	フルトリアホール
M.57	C.I-13	ボスカリド	M.257	C.I-13	フルトリアホール
M.58	C.I-14	ボスカリド	M.258	C.I-14	フルトリアホール
M.59	C.I-19	ボスカリド	M.259	C.I-19	フルトリアホール
M.60	C.I-20	ボスカリド	M.260	C.I-20	フルトリアホール
M.61	C.I-1	フルオピラム	M.261	C.I-1	ジフェノコナゾール
M.62	C.I-3	フルオピラム	M.262	C.I-3	ジフェノコナゾール
M.63	C.I-4	フルオピラム	M.263	C.I-4	ジフェノコナゾール
M.64	C.I-9	フルオピラム	M.264	C.I-9	ジフェノコナゾール
M.65	C.I-10	フルオピラム	M.265	C.I-10	ジフェノコナゾール
M.66	C.I-11	フルオピラム	M.266	C.I-11	ジフェノコナゾール
M.67	C.I-13	フルオピラム	M.267	C.I-13	ジフェノコナゾール
M.68	C.I-14	フルオピラム	M.268	C.I-14	ジフェノコナゾール
M.69	C.I-19	フルオピラム	M.269	C.I-19	ジフェノコナゾール
M.70	C.I-20	フルオピラム	M.270	C.I-20	ジフェノコナゾール
M.71	C.I-1	フルキサピロキサド	M.271	C.I-1	ビキサフェン
M.72	C.I-3	フルキサピロキサド	M.272	C.I-3	ビキサフェン
M.73	C.I-4	フルキサピロキサド	M.273	C.I-4	ビキサフェン
M.74	C.I-9	フルキサピロキサド	M.274	C.I-9	ビキサフェン
M.75	C.I-10	フルキサピロキサド	M.275	C.I-10	ビキサフェン
M.76	C.I-11	フルキサピロキサド	M.276	C.I-11	ビキサフェン
M.77	C.I-13	フルキサピロキサド	M.277	C.I-13	ビキサフェン

10

20

30

40

混合物	化合物-I	化合物-II	混合物	化合物-I	化合物-II
M.78	C.I-14	フルキサピロキサド	M.278	C.I-14	ビキサフェン
M.79	C.I-19	フルキサピロキサド	M.279	C.I-19	ビキサフェン
M.80	C.I-20	フルキサピロキサド	M.280	C.I-20	ビキサフェン
M.81	C.I-1	ペンチオピラド	M.281	C.I-1	イソピラザム
M.82	C.I.-3	ペンチオピラド	M.282	C.I.-3	イソピラザム
M.83	C.I-4	ペンチオピラド	M.283	C.I-4	イソピラザム
M.84	C.I-9	ペンチオピラド	M.284	C.I-9	イソピラザム
M.85	C.I-10	ペンチオピラド	M.285	C.I-10	イソピラザム
M.86	C.I-11	ペンチオピラド	M.286	C.I-11	イソピラザム
M.87	C.I-13	ペンチオピラド	M.287	C.I-13	イソピラザム
M.88	C.I-14	ペンチオピラド	M.288	C.I-14	イソピラザム
M.89	C.I-19	ペンチオピラド	M.289	C.I-19	イソピラザム
M.90	C.I-20	ペンチオピラド	M.290	C.I-20	イソピラザム
M.91	C.I-1	セダキサン	M.291	C.I-1	ペンフルフェン
M.92	C.I.-3	セダキサン	M.292	C.I.-3	ペンフルフェン
M.93	C.I-4	セダキサン	M.293	C.I-4	ペンフルフェン
M.94	C.I-9	セダキサン	M.294	C.I-9	ペンフルフェン
M.95	C.I-10	セダキサン	M.295	C.I-10	ペンフルフェン
M.96	C.I-11	セダキサン	M.296	C.I-11	ペンフルフェン
M.97	C.I-13	セダキサン	M.297	C.I-13	ペンフルフェン
M.98	C.I-14	セダキサン	M.298	C.I-14	ペンフルフェン
M.99	C.I-19	セダキサン	M.299	C.I-19	ペンフルフェン
M.100	C.I-20	セダキサン	M.300	C.I-20	ペンフルフェン
M.101	C.I-1	シルチオフアム	M.301	C.I-1	ジメトモルフ
M.102	C.I.-3	シルチオフアム	M.302	C.I.-3	ジメトモルフ
M.103	C.I-4	シルチオフアム	M.303	C.I-4	ジメトモルフ
M.104	C.I-9	シルチオフアム	M.304	C.I-9	ジメトモルフ
M.105	C.I-10	シルチオフアム	M.305	C.I-10	ジメトモルフ
M.106	C.I-11	シルチオフアム	M.306	C.I-11	ジメトモルフ
M.107	C.I-13	シルチオフアム	M.307	C.I-13	ジメトモルフ
M.108	C.I-14	シルチオフアム	M.308	C.I-14	ジメトモルフ
M.109	C.I-19	シルチオフアム	M.309	C.I-19	ジメトモルフ
M.110	C.I-20	シルチオフアム	M.310	C.I-20	ジメトモルフ
M.111	C.I-1	カルベンダジム	M.311	C.I-1	プロピネブ
M.112	C.I.-3	カルベンダジム	M.312	C.I.-3	プロピネブ
M.113	C.I-4	カルベンダジム	M.313	C.I-4	プロピネブ
M.114	C.I-9	カルベンダジム	M.314	C.I-9	プロピネブ
M.115	C.I-10	カルベンダジム	M.315	C.I-10	プロピネブ
M.116	C.I-11	カルベンダジム	M.316	C.I-11	プロピネブ
M.117	C.I-13	カルベンダジム	M.317	C.I-13	プロピネブ

10

20

30

40



混合物	化合物-I	化合物-II	混合物	化合物-I	化合物-II
M.118	C.I-14	カルベンダジム	M.318	C.I-14	プロピネブ
M.119	C.I-19	カルベンダジム	M.319	C.I-19	プロピネブ
M.120	C.I-20	カルベンダジム	M.320	C.I-20	プロピネブ
M.121	C.I-1	エポキシコナゾール	M.321	C.I-1	アメトクトラジン
M.122	C.I-3	エポキシコナゾール	M.322	C.I-3	アメトクトラジン
M.123	C.I-4	エポキシコナゾール	M.323	C.I-4	アメトクトラジン
M.124	C.I-9	エポキシコナゾール	M.324	C.I-9	アメトクトラジン
M.125	C.I-10	エポキシコナゾール	M.325	C.I-10	アメトクトラジン
M.126	C.I-11	エポキシコナゾール	M.326	C.I-11	アメトクトラジン
M.127	C.I-13	エポキシコナゾール	M.327	C.I-13	アメトクトラジン
M.128	C.I-14	エポキシコナゾール	M.328	C.I-14	アメトクトラジン
M.129	C.I-19	エポキシコナゾール	M.329	C.I-19	アメトクトラジン
M.130	C.I-20	エポキシコナゾール	M.330	C.I-20	アメトクトラジン
M.131	C.I-1	フルキンコナゾール	M.331	C.I-1	マンゼブ
M.132	C.I-3	フルキンコナゾール	M.332	C.I-3	マンゼブ
M.133	C.I-4	フルキンコナゾール	M.333	C.I-4	マンゼブ
M.134	C.I-9	フルキンコナゾール	M.334	C.I-9	マンゼブ
M.135	C.I-10	フルキンコナゾール	M.335	C.I-10	マンゼブ
M.136	C.I-11	フルキンコナゾール	M.336	C.I-11	マンゼブ
M.137	C.I-13	フルキンコナゾール	M.337	C.I-13	マンゼブ
M.138	C.I-14	フルキンコナゾール	M.338	C.I-14	マンゼブ
M.139	C.I-19	フルキンコナゾール	M.339	C.I-19	マンゼブ
M.140	C.I-20	フルキンコナゾール	M.340	C.I-20	マンゼブ
M.141	C.I-1	イブコナゾール	M.341	C.I-1	メチラム
M.142	C.I-3	イブコナゾール	M.342	C.I-3	メチラム
M.143	C.I-4	イブコナゾール	M.343	C.I-4	メチラム
M.144	C.I-9	イブコナゾール	M.344	C.I-9	メチラム
M.145	C.I-10	イブコナゾール	M.345	C.I-10	メチラム
M.146	C.I-11	イブコナゾール	M.346	C.I-11	メチラム
M.147	C.I-13	イブコナゾール	M.347	C.I-13	メチラム
M.148	C.I-14	イブコナゾール	M.348	C.I-14	メチラム
M.149	C.I-19	イブコナゾール	M.349	C.I-19	メチラム
M.150	C.I-20	イブコナゾール	M.350	C.I-20	メチラム
M.151	C.I-1	メトコナゾール	M.351	C.I-1	銅塩
M.152	C.I-3	メトコナゾール	M.352	C.I-3	銅塩
M.153	C.I-4	メトコナゾール	M.353	C.I-4	銅塩
M.154	C.I-9	メトコナゾール	M.354	C.I-9	銅塩
M.155	C.I-10	メトコナゾール	M.355	C.I-10	銅塩
M.156	C.I-11	メトコナゾール	M.356	C.I-11	銅塩
M.157	C.I-13	メトコナゾール	M.357	C.I-13	銅塩

10

20

30

40

混合物	化合物-I	化合物-II	混合物	化合物-I	化合物-II
M.158	C.I-14	メトコナゾール	M.358	C.I-14	銅塩
M.159	C.I-19	メトコナゾール	M.359	C.I-19	銅塩
M.160	C.I-20	メトコナゾール	M.360	C.I-20	銅塩
M.161	C.I-1	プロチオコナゾール	M.361	C.I-1	硫黄
M.162	C.I-3	プロチオコナゾール	M.362	C.I-3	硫黄
M.163	C.I-4	プロチオコナゾール	M.363	C.I-4	硫黄
M.164	C.I-9	プロチオコナゾール	M.364	C.I-9	硫黄
M.165	C.I-10	プロチオコナゾール	M.365	C.I-10	硫黄
M.166	C.I-11	プロチオコナゾール	M.366	C.I-11	硫黄
M.167	C.I-13	プロチオコナゾール	M.367	C.I-13	硫黄
M.168	C.I-14	プロチオコナゾール	M.368	C.I-14	硫黄
M.169	C.I-19	プロチオコナゾール	M.369	C.I-19	硫黄
M.170	C.I-20	プロチオコナゾール	M.370	C.I-20	硫黄
M.171	C.I-1	テブコナゾール	M.371	C.I-1	亜リン酸
M.172	C.I-3	テブコナゾール	M.372	C.I-3	亜リン酸
M.173	C.I-4	テブコナゾール	M.373	C.I-4	亜リン酸
M.174	C.I-9	テブコナゾール	M.374	C.I-9	亜リン酸
M.175	C.I-10	テブコナゾール	M.375	C.I-10	亜リン酸
M.176	C.I-11	テブコナゾール	M.376	C.I-11	亜リン酸
M.177	C.I-13	テブコナゾール	M.377	C.I-13	亜リン酸
M.178	C.I-14	テブコナゾール	M.378	C.I-14	亜リン酸
M.179	C.I-19	テブコナゾール	M.379	C.I-19	亜リン酸
M.180	C.I-20	テブコナゾール	M.380	C.I-20	亜リン酸
M.181	C.I-1	トリチコナゾール	M.381	C.I-1	クロロタロニル
M.182	C.I-3	トリチコナゾール	M.382	C.I-3	クロロタロニル
M.183	C.I-4	トリチコナゾール	M.383	C.I-4	クロロタロニル
M.184	C.I-9	トリチコナゾール	M.384	C.I-9	クロロタロニル
M.185	C.I-10	トリチコナゾール	M.385	C.I-10	クロロタロニル
M.186	C.I-11	トリチコナゾール	M.386	C.I-11	クロロタロニル
M.187	C.I-13	トリチコナゾール	M.387	C.I-13	クロロタロニル
M.188	C.I-14	トリチコナゾール	M.388	C.I-14	クロロタロニル
M.189	C.I-19	トリチコナゾール	M.389	C.I-19	クロロタロニル
M.190	C.I-20	トリチコナゾール	M.390	C.I-20	クロロタロニル
M.191	C.I-1	プロクロラズ	M.391	C.I-1	チオファネートメチル
M.192	C.I-3	プロクロラズ	M.392	C.I-3	チオファネートメチル
M.193	C.I-4	プロクロラズ	M.393	C.I-4	チオファネートメチル
M.194	C.I-9	プロクロラズ	M.394	C.I-9	チオファネートメチル
M.195	C.I-10	プロクロラズ	M.395	C.I-10	チオファネートメチル
M.196	C.I-11	プロクロラズ	M.396	C.I-11	チオファネートメチル
M.197	C.I-13	プロクロラズ	M.397	C.I-13	チオファネートメチル

10

20

30

40

混合物	化合物-I	化合物-II	混合物	化合物-I	化合物-II
M.198	C.I-14	プロクロラズ	M.398	C.I-14	チオファネートメチル
M.199	C.I-19	プロクロラズ	M.399	C.I-19	チオファネートメチル
M.200	C.I-20	プロクロラズ	M.400	C.I-20	チオファネートメチル
M.201	C.I-1	エタボキサム	M.401	C.I-1	フルピコリド
M.202	C.I-3	エタボキサム	M.402	C.I-3	フルピコリド
M.203	C.I-4	エタボキサム	M.403	C.I-4	フルピコリド
M.204	C.I-9	エタボキサム	M.404	C.I-9	フルピコリド
M.205	C.I-10	エタボキサム	M.405	C.I-10	フルピコリド
M.206	C.I-11	エタボキサム	M.406	C.I-11	フルピコリド
M.207	C.I-13	エタボキサム	M.407	C.I-13	フルピコリド
M.208	C.I-14	エタボキサム	M.408	C.I-14	フルピコリド
M.209	C.I-19	エタボキサム	M.409	C.I-19	フルピコリド
M.210	C.I-20	エタボキサム	M.410	C.I-20	フルピコリド
M.211	C.I-1	ピリオフェノン	M.411	C.I-1	フルシラゾール
M.212	C.I-3	ピリオフェノン	M.412	C.I-3	フルシラゾール
M.213	C.I-4	ピリオフェノン	M.413	C.I-4	フルシラゾール
M.214	C.I-9	ピリオフェノン	M.414	C.I-9	フルシラゾール
M.215	C.I-10	ピリオフェノン	M.415	C.I-10	フルシラゾール
M.216	C.I-11	ピリオフェノン	M.416	C.I-11	フルシラゾール
M.217	C.I-13	ピリオフェノン	M.417	C.I-13	フルシラゾール
M.218	C.I-14	ピリオフェノン	M.418	C.I-14	フルシラゾール
M.219	C.I-19	ピリオフェノン	M.419	C.I-19	フルシラゾール
M.220	C.I-20	ピリオフェノン	M.420	C.I-20	フルシラゾール

10

20

## 【0115】

30

式Iの化合物および群F.I~F.XIから選択される化合物IIの二成分混合物は、本発明の好ましい一実施形態である。

## 【0116】

式Iの化合物および群F.I~F.XIから選択される2個の化合物IIの三成分混合物は、本発明の好ましい別の実施形態である。

## 【0117】

## 有害生物および菌類

活性化化合物IおよびIIの混合物、または、同時に(すなわち一緒にまたは別々に)使用される活性化化合物IおよびIIは、以下の目に属する有害生物に対して極めて優れた作用を示す：

40

チョウ類(鱗翅目(Lepidoptera))の昆虫、例えば、タマナヤガ(*Agrotis ypsilon*)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、アメリカワタノミガ(*Alabama argillacea*)、ハッショウマメケムシ(*Anticarsia gemmatalis*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、ガンマキンウワバ(*Autographa gamma*)、ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、カコエシア・ムリナナ(*Cacoecia murinana*)、カプア・レチクラナ(*Capua reticulana*)、ケイマトビア・ブルマタ(*Cheimatobia brumata*)、トウヒシントメハマキ(*Choristoneura fumiferana*)、コリストネウラ・オシデンタリス(*Choristoneura occidentalis*)、アワヨトウ(*Cirphis unipuncta*)、コドリノガ(*Cydia pomonella*)、デンドロリムス・ピニ(*Dendrolimus pini*)、アメリカウリノメイガ(*Diaphania nitidalis*)、サウスウエスタンコーンボラー(*Diatraea grandiosella*)、ミスジアオリングア(*Earias insulana*)、モロコシマダラ

50

メイガ(*Elasmopalpus lignosellus*)、ブドウホソハマキ(*Eupoecilia ambiguella*)、エベトリア・ボウリアナ(*Evetria bouliana*)、フェルチア・スプテラネア(*Feltia subterranea*)、ハチノスツリガ(*Galleria mellonella*)、グラホリタ・フネブラナ(*Grapholitha funebrana*)、ナツヒメシンクイ(*Grapholitha molesta*)、タバコガ(*Heliothis armigera*)、ニセアメリカタバコガ(*Heliothis virescens*)、タバコガ(*Heliothis zea*)、ハイマダラノメイガ(*Heliula undalis*)、ヒベルニア・デホリアリア(*Hibernia defoliaria*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、ヒボノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコペルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、ランブジナ・フィセラリア(*Lambdina fiscellaria*)、シロイチモンジヨトウ(*Laphygma exigua*)、ロイコプテラ・コフイーラ(*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、キンモンソガ(*Lithocolletis blancardella*)、ホソバヒメハマキ(*Lobesia botrana*)、ヘリキスジノメイガ(*Loxostege sticticalis*)、マイマイガ(*Lymantria dispar*)、ノンネマイマイ(*Lymantria monacha*)、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)、オビカレハ(*Malacosoma neustria*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、オルギア・ブソイドツガータ(*Orgyia pseudotsugata*)、アワノメイガ(*Ostrinia nubilalis*)、マツキリガ(*Panolis flammea*)、ワタキバガ(*Pectinophora gossypiella*)、ニセタマナヤガ(*Peridroma saucia*)、ファレラ・ブセファラ(*Phalera bucephala*)、ジャガイモキバガ(*Phthorimaea operculella*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、オオモンシロチョウ(*Pieris brassicae*)、ヤガ(*Plathypena scabra*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、キンウワバ(*Pseudoplusia includens*)、リアシオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、トマトガ(*Scrobipalpus ab soluta*)、バクガ(*Sitotroga cerealella*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、ヨトウガ(*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・リットラリス(*Spodoptera littoralis*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、マツノギョウレツケムシ(*Thaumatopoea pityocampa*)、トルトリキス・ピリダナ(*Tortrix viridana*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、およびゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)、

10

20

甲虫類(鞘翅目(*Coleoptera*))、例えば、アカバナガタマムシ(*Agrilus sinuatus*)、アグリオテス・リネアツス(*Agriotes lineatus*)、アグリオテス・オブスクルス(*Agriotes obscurus*)、アンフィマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスパル(*Anisandrus dispar*)、アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*)、アントノムス・ポモルム(*Anthonomus pomorum*)、アフトナ・オイフォリダエ(*Aphthona euphoridae*)、アトウス・ヘモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、ブラストファグス・ピニペルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダタ(*Blitophaga undata*)、ソラマメゾウムシ(*Bruchus rufimanus*)、エンドウゾウムシ(*Bruchus pisorum*)、ヒラマメゾウムシ(*Bruchus lentis*)、ドロハマキチョッキリ(*Byctiscus betulae*)、カメノコハムシ(*Cassida nebulosa*)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、キンイロハナムグリ(*Cetonia aurata*)、コイトリンクス・アッシミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・ナピ(*Ceuthorrhynchus napi*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、コノデルス・ベスペルチヌス(*Conoderus vespertinus*)、アスパラガスクビナガハムシ(*Crioceris asparagi*)、クテニセラ属の種(*Ctenicera* ssp.)、ジアプロチカ・ロンギコルニス(*Diabrotica longicornis*)、ジアプロチカ・セミプンクタタ(*Diabrotica semipunctata*)、ジアプロチカ・12-プンクタタ(*Diabrotica 12-punctata*)、ジアプロチカ・スペシオサ(*Diabrotica speciosa*)、ジアプロチカ・ビルギフェラ(*Diabrotica virgifera*)、インゲンテントウ(*Epilachna varivestis*)、エピトリクス・ヒルチペンニス(*Epitrix hirtipennis*)、ユーチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、マツアナアキゾウムシ(*Hylobius abietis*)、ヒペラ・ブルンネイペンニス(*Hypera brunneipennis*)、ヒペラ・ポストカ(*Hypera postica*)、ヤツバキクイムシ(*Ips typographus*)、レマ・ビリネアタ(*Lema bilineata*)、レマ・メラノプス(*Lema melanopus*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リモニウス・カリホルニクス(*Limonius californicus*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhynchus oryzophilus*)、メラノツス・コムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス・アエネ

30

40

50

ウス(*Meligethes aeneus*)、コフキコガネ(*Melolontha hippocastani*)、コフキコガネ(*Melolontha melolontha*)、イネクビボソハムシ(*Oulema oryzae*)、キンケクチプトゾウムシ(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オバツス(*Otiorrhynchus ovatus*)、ファエドン・コクレアリエ(*Phaedon cochleariae*)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロトレタ・クリソセファラ(*Phyllotreta chrysocephala*)、フィロファガ属の種(*Phyllophaga* sp.)、フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta nemorum*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、アカアシチビコフキゾウムシ(*Sitona lineatus*)、およびシトフィルス・グラナリア(*Sitophilus granaria*)、

ハエ、カ(双翅目(Diptera))、例えば、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、キンイロヤブカ(*Aedes vexans*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、ハマダラカ(*Anopheles maculipennis*、*Anopheles crucians*、*Anopheles albimanus*)、ガンビアハマダラカ(*Anopheles gambiae*)、ハマダラカ(*Anopheles freeborni*、*Anopheles leucosphyrus*)、コガタハマダラカ(*Anopheles minimus*)、ハマダラカ(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(*Calliphora vicina*)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、旧世界ラセンウジバエ(*Chrysomya bezziana*)、新世界ラセンウジバエ(*Chrysomya hominivorax*)、ハエ(*Chrysomya macellaria*)、サシバエ(*Chrysops discalis*)、アブ(*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*)、ラセンウジバエ(*Cochliomyia hominivorax*)、ソルガムタマバエ(*Contarinia sorghicola*)、ヒトクイバエ(*Cordylobia anthropophaga*)、ヌカカ(*Culicoides furens*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、イエカ(*Culex nigripalpus*)、ネッタイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、イエカ(*Culex tarsalis*)、ハボシカ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オリブミバエ(*Dacus oleae*)、ダイコンタマバエ(*Dasineura brassicae*)、タマネギバエ(*Delia antique*)、コムギハナバエ(*Delia coarctata*)、タネバエ(*Delia platura*)、キャベツハナバエ(*Delia radicum*)、ヒフバエ(*Dermatobia hominis*)、ヒメイエバエ(*Fannia canicularis*)、ヒメコバエ(*Geomyza tripunctata*)、ウマバエ(*Gasterophilus intestinalis*)、ツェツェバエ(*Glossina morsitans*)、ツェツェバエ(*Glossina palpalis*、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、タネバエ(*Hylemyia platura*)、ウシバエ(*Hypoderma lineata*)、ヌカカ(*Leptocnops torrens*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、キンバエ(*Lucilia caprina*)、ヒツジキンバエ(*Lucilia cuprina*)、ヒロズキンバエ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・チチラヌス(*Mansonia titillanus*)、コムギタマバエ(*Mayetiola destructor*)、イエバエ(*Musca domestica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、オポマイザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、アカザモクセリハナバエ(*Pegomya hysocyami*)、ホルビア属のハエ(*Phorbia antiqua*、*Phorbia brassicae*、*Phorbia coarctata*)、サシチョウバエ(*Phlebotomus argentipes*)、ヤブカ(*Psorophora columbiae*)、ニンジンサビバエ(*Psila rosae*)、ブソロフォラ・ディスカラ(*Psorophora discolor*)、ブユ(*Prosimulium mixtum*)、ヨーロッパオウトウミバエ(*Rhagoletis cerasi*)、リンゴミバエ(*Rhagoletis pomonella*)、ニクバエ(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* sp.)、ブユ(*Simulium vittatum*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、ウシアブ(*Tabanus bovinus*)、アブ(*Tabanus atratus*、*Tabanus lineola*、および *Tabanus similis*)、ガガンボ(*Tipula oleracea* および *Tipula paludosa*)、

アザミウマ(総翅目(Thysanoptera))、例えば、ジクロモトリプス・コルベッチ(*Dichromothrips corbetti*)、ジクロモトリプス属の種(*Dichromothrips* spp.)、フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・トリチシ(*Frankliniella tritici*)、シルトスリップス・シトリ(*Scirtothrips citri*)、イネアザミウマ(*Thrips oryzae*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*) および ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、

10

20

30

40

50

シロアリ (等翅目(Isoptera))、例えば、カロテルメス・フラビコリス(*Calotermes flavicollis*)、ロイコテルメス・フラビペス(*Leucotermes flavipes*)、ヘテロテルムス・アウレウス(*Heterotermes aureus*)、レチクリテルメス・フラビペス(*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヴァルジニクス(*Reticulitermes virginicus*)、レチクリテルメス・ルシフグス(*Reticulitermes lucifugus*)、テルメス・ナタレンシス(*Termes natalensis*)、およびイエシロアリ(*Coptotermes formosanus*)、

ゴキブリ (網翅目(Blattaria - Blattodea))、例えば、チャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、モリチャバネゴキブリ(*Blattella asahinae*)、ワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、トビイロゴキブリ(*Periplaneta brunnea*)、クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、コワモンゴキブリ(*Periplaneta australasiae*)、およびトウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*)、

半翅類 (半翅目(Hemiptera))、例えば、カメムシ(*Acrosternum hilare*)、ナガカメムシ(*Blissus leucopterus*)、カスミカメムシ(*Cyrtopeltis notatus*)、アカホシカメムシ(*Dysdercus cingulatus*)、ホシカメムシ(*Dysdercus intermedius*)、キンカメムシ(*Eurygaster integriceps*)、ユスキスツス・インピクチベントリス(*Euschistus impictiventris*)、ヘリカメムシ(*Leptoglossus phyllopus*)、メクラカメムシ(*Lygus lineolaris*)、ミドリメクラガメ(*Lygus pratensis*)、ミナミアオカメムシ(*Nezara viridula*)、チビカメムシ(*Piesma quadrata*)、ソルベア・インストラリス(*Solubea insularis*)、チアンタ・ペルジトル(*Thyanta perditor*)、アシルトシフォン・オノブリキス(*Acyrtosiphon onobrychis*)、カサアブラムシ(*Adelges laricis*)、アフイデュラ・ナスツルチイ(*Aphidula nasturtii*)、クロアブラムシ(*Aphis fabae*)、イチゴネアブラムシ(*Aphis forbesi*)、リンゴアブラムシ(*Aphis pomi*)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、アフィス・グロツスラリア(*Aphis grossulariae*)、アフィス・シュネイデリ(*Aphis schneideri*)、アフィス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*)、ニワトコアブラムシ(*Aphis sambuci*)、エンドウヒゲナガアブラムシ(*Acyrtosiphon pisum*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(*Aulacorthum solani*)、シルバーリーフコナジラミ(*Bemisia argentifolii*)、アザミオマルアブラムシ(*Brachycaudus cardui*)、ムギワラギクオマルアブラムシ(*Brachycaudus helichrysi*)、ブラシカウダス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)、ブラシカウダス・プルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ダイコンアブラムシ(*Brevicoryne brassicae*)、カピトフォルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシッピー(*Cerosiphia gossypii*)、イチゴケナガアブラムシ(*Chaetosiphon fragaefolii*)、スグリトックリアブラムシ(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマニアナ(*Dreyfusia nordmanniana*)、ドレイフシア・ピセア(*Dreyfusia piceae*)、ジサフィス・ラディコラ(*Dysaphis radicola*)、ジサウラコルスム・シュードソラニ(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、オオバコアブラムシ(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、ジャガイモヒメヨコバイ(*Empoasca fabae*)、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus pruni*)、チシャミドリアブラムシ(*Hyperomyzus lactucae*)、ムギヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum avenae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフォン・ロサエ(*Macrosiphon rosae*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrararius*)、ムギウスイロアブラムシ(*Metopolophium dirhodum*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ミズス・アスカロニクス(*Myzus ascalonicus*)、ニワウメクロコブアブラムシ(*Myzus cerasi*)、カワリコブアブラムシ(*Myzus varians*)、レタスヒゲナガアブラムシ(*Nasonovia ribis-nigri*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、アブラムシ(*Pemphigus bursarius*)、クロフツノウンカ(*Perkinsiella saccharicida*)、ホップイボアブラムシ(*Phorodon humuli*)、リンゴキジラミ(*Psylla mali*)、ナシキジラミ(*Psylla piri*)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalosiphum ascalonicus*)、トウモロコシアブラムシ(*Rhopalosiphum maidis*)、ムギクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum padi*)、リンゴクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum insertum*)、サツパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サツパフィス・マリ(*Sappaphis mali*)、ムギミドリアブラムシ(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌジノサ(*Schizoneura lanuginosa*)、シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、オンシツコナジラミ(*Trialetrode*

10

20

30

40

50

s vaporariorum)、トキシプロテラ・オーランチアンド(*Toxoptera aurantii*and)、ブドウネアブラムシ(*Viteus vitifolii*)、トコジラミ(*Cimex lectularius*)、ネッタイトコジラミ(*Cimex hemipterus*)、レデュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種(*Triatoma* spp.)、およびアリルス・クリタツス(*Arilus critatus*)。

【 0 1 1 8 】

アリ、ミツバチ、スズメバチ、ハバチ (膜翅目(Hymenoptera))、例えば、カブラハバチ(*Athalia rosae*)、ハキリアリ(*Atta cephalotes*)、ハキリアリ(*Atta capiguara*)、ハキリアリ(*Atta cephalotes*)、ハキリアリ(*Atta laevigata*)、アッタ・ロブスタ(*Atta robusta*)、ハキリアリ(*Atta sexdens*)、テキサスハキリアリ(*Atta texana*)、シリアゲアリ属の種(*Crematogaster* spp.)、ホプロカンパ・ミヌタ(*Hoplocampa minuta*)、ホプロカンパ・テスツジネア(*Hoplocampa testudinea*)、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、アカカミアリ(*Solenopsis geminata*)、ヒアリ(*Solenopsis invicta*)、カミアリ(*Solenopsis richteri*)、ソレノプシス・キシロニ(*Solenopsis xyloni*)、アカシュウカクアリ(*Pogonomyrmex barbatus*)、シュウカクアリ(*Pogonomyrmex californicus*)、ツヤオオズアリ(*Pheidole megacephala*)、アリバチ(*Dasymutilla occidentalis*)、マルハナバチ属の種(*Bombus* spp.)、クロスズメバチ(*Vespula squamosa*)、クロスズメバチ(*Paravespula vulgaris*)、クロスズメバチ(*Paravespula pennsylvanica*)、スズメバチ(*Paravespula germanica*)、スズメバチ(*Dolichovespula maculata*)、スズメバチ(*Vespa crabro*)、アシナガバチ(*Polistes rubiginosa*)、オオアリ(*Camponotus floridanus*)、およびアルゼンチンアリ(*Linepithema humile*)、

10

20

コオロギ、バッタ、イナゴ (直翅目(Orthoptera))、例えば、ヨーロッパイエコオロギ(*Acheta domestica*)、ケラ(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、メラノプルス属のバッタ(*Melanoplus bivittatus*、*Melanoplus femurrubrum*、*Melanoplus mexicanus*、*Melanoplus sanguinipes*、*Melanoplus spretus*)、アカトビバッタ(*Nomadacris septemfasciata*)、アメリカイナゴ(*Schistocerca americana*)、サバクトビバッタ(*Schistocerca gregaria*)、モロッコトビバッタ(*Docostaurus maroccanus*)、クラズミウマ(*Tachycines asynamoros*)、ワタリバッタ(*Oedaleus senegalensis*)、ゾノゼルス・ヴァリエガツス(*Zonozerus variegatus*)、ヒエログリフス・ダガネンシス(*Hieroglyphus daganensis*)、バッタ(*Kraussaria angulifera*)、イナゴ(*Calliptamus italicus*)、オーストラリアトビバッタ(*Chortoicetes terminifera*)、およびアカトビバッタ(*Locustana pardalina*)、

30

クモ形綱、例えばクモ形類 (ダニ目(Acarina))、例えば、ヒメダニ科(*Argasidae*)、マダニ科(*Ixodidae*)およびヒゼンダニ科(*Sarcoptidae*)に属するもの、例えばアメリカキラマダニ(*Amblyomma americanum*)、マダニ(*Amblyomma variegatum*)、メキシコ湾岸マダニ(*Amblyomma maculatum*)、ヒメダニ(*Argas persicus*)、マダニ(*Boophilus annulatus*、*Boophilus decoloratus*、*Boophilus microplus*)、カクマダニ(*Dermacentor silvarum*、*Dermacentor andersoni*、*Dermacentor variabilis*)、ヒアロンマ・トルンカツム(*Hyalomma truncatum*)、マダニ(*Ixodes ricinus*)、マダニ(*Ixodes rubicundus*)、クロアシマダニ(*Ixodes scapularis*)、オーストラリア産マダニ(*Ixodes holocyclus*)、西部クロアシマダニ(*Ixodes pacificus*)、カズキダニ(*Ornithodoros moubata*、*Ornithodoros hermsi*、*Ornithodoros turicata*)、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)、ミミダニ(*Otobius megnini*)、ワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、ヒツジヒゼンダニ(*Psoroptes ovis*)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)、コイタマダニ(*Rhipicephalus appendiculatus*、*Rhipicephalus evertsi*)、ヒゼンダニ(*Sarcoptes scabiei*)、ならびにフシダニ属の種(*Eriophyidae* spp.)、例えば、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、ミカンサビダニ(*Phyllocoptrata oleivora*)、およびエリオフィエス・シェルドニ(*Eriophyes sheldoni*)；ホコリダニ属の種(*Tarsonemidae* spp.)、例えば、フィトネムス・パリズス(*Phytonemus pallidus*)、およびチャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*)；ヒメハダニ属の種(*Tenuipalpidae* spp.)、例えば、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*)；ハダニ属の種(*Tetranychidae* spp.)、例えば、ニセナミハダニ(*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ(*Tetra*

40

50

nychus kanzawai)、オウトウハダニ(Tetranychus pacificus)、ニセナミハダニ(Tetranychus telarius)、およびナミハダニ(Tetranychus urticae)、リンゴハダニ(Panonychus ulmi)、ミカンハダニ(Panonychus citri)、およびオリゴニクス・プラテンシス(Oligonychus pratensis)；真正クモ目(Araneida)、例えば、クロゴケグモ(Latrodectus mactans)、およびドクイトグモ(Loxosceles reclusa)、

ノミ(隠翅目(Siphonaptera))、例えば、ネコノミ(Ctenocephalides felis)、イヌノミ(Ctenocephalides canis)、ケオプスネズミノミ(Xenopsylla cheopis)、ヒトノミ(Pulex irritans)、スナノミ(Tunga penetrans)、およびヨーロッパネズミノミ(Nosopsyllus fasciatus)、

セイヨウシミ、マダラシミ(総尾目(Thysanura))、例えば、セイヨウシミ(Lepisma saccharina)、およびマダラシミ(Thermobia domestica)、

ムカデ(唇脚綱(Chilopoda))、例えばハウスムカデ(Scutigera coleoptrata)；

ヤスデ(倍脚綱(Diplopoda))、例えばナルセウス属の種(Narceus spp.)；

ハサミムシ(革翅目(Dermaptera))、例えばヨーロッパクギヌキハサミムシ(forficula auricularia)；

シラミ(シラミ目(Phthiraptera))、例えば、アタマジラミ(Pediculus humanus capitis)、コロモジラミ(Pediculus humanus corporis)、ケジラミ(Pthirus pubis)、ウシジラミ(Haematopinus eurysternus)、ブタジラミ(Haematopinus suis)、ウシホソジラミ(Linognathus vituli)、ウシハジラミ(Bovicola bovis)、ニワトリハジラミ(Menopon gallinae)、ニワトリオオハジラミ(Menacanthus stramineus)、およびケブカウシジラミ(Solenopotes capillatus)；

植物寄生性線虫、例えばネコブセンチュウ類のアレナリアネコブセンチュウ(Meloidogyne arenaria)、コロンビアネコブセンチュウ(Meloidogyne chitwoodi)、メロイドギネ・エキシグア(Meloidogyne exigua)、キタネコブセンチュウ(Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita)、ジャワネコブセンチュウ(Meloidogyne javanica)、および他のメロイドギネ(Meloidogyne)属の種；シストセンチュウ類のジャガイモシストセンチュウ(Globodera rostochiensis)、ジャガイモシロシストセンチュウ(Globodera pallida)、タバコシストセンチュウ(Globodera tabacum)および他のグロボデラ(Globodera)種；穀物シストセンチュウ(Heterodera avenae)、ダイズシストセンチュウ(Heterodera glycines)、テンサイシストセンチュウ(Heterodera schachtii)、クローバーシストセンチュウ(Heterodera trifolii)、および他のヘテロデラ(Heterodera)種；種子コブセンチュウ類のアンゲイナ・フネスタ(Anguina funesta)、コムギツブセンチュウ(Anguina tritici)および他のアンゲイナ(Anguina)種；クキおよびハセンチュウ類のイネシンガレセンチュウ(Aphelenchoides besseyi)、イチゴセンチュウ(Aphelenchoides fragariae)、ハガレセンチュウ(Aphelenchoides ritzemabosi)および他のアフエレンコイデス(Aphelenchoides)種；刺毛センチュウ類のベロノライムス・ロンギカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)および他のベロノライムス(Belonolaimus)種；マツセンチュウ類のマツノザイセンチュウ(Bursaphelenchus xylophilus)および他のブルサフェレンクス(Bursaphelenchus)種；ワセンチュウ類のクリコネマ(Criconema)種、クリコネメラ(Criconemella)種、

クリコネモイデス(Criconemoides)種およびメソクリコネマ(Mesocriconema)種；クキおよびリンケイセンチュウ類のイモグサレセンチュウ(Ditylenchus destructor)、ナミクキセンチュウ(Ditylenchus dipsaci)、キノコセンチュウ(Ditylenchus myceliophagus)および他のジチレンクス種；突錐センチュウ類のドリコドルス(Dolichodoros)種；ラセンセンチュウ類のナミラセンセンチュウ(Helicotylenchus dihystera)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス(Helicotylenchus multincinctus)および他のヘリコチレンクス種；ロチレンクス・ロボツス(Rotylenchus robustus)および他のロチレンクス種；鞘センチュウ類のヘミシクリオホラ(Hemicycliophora)種およびヘミクリコネモイデス(Hemicriconemoides)種；ヒルスマンニエラ(Hirshmanniella)種；ヤリセンチュウ類のホプロアィムス・コロンプス(Hoplolaimus columbus)、ホプロアィムス・ガレアツス(Hoplolaimus galeatus)および他のホプロアィムス(Hoplolaimus)種；ニセネコブセンチュウ類のナコブス・アベラン

植物寄生性線虫、例えばネコブセンチュウ類のアレナリアネコブセンチュウ(Meloidogyne arenaria)、コロンビアネコブセンチュウ(Meloidogyne chitwoodi)、メロイドギネ・エキシグア(Meloidogyne exigua)、キタネコブセンチュウ(Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita)、ジャワネコブセンチュウ(Meloidogyne javanica)、および他のメロイドギネ(Meloidogyne)属の種；シストセンチュウ類のジャガイモシストセンチュウ(Globodera rostochiensis)、ジャガイモシロシストセンチュウ(Globodera pallida)、タバコシストセンチュウ(Globodera tabacum)および他のグロボデラ(Globodera)種；穀物シストセンチュウ(Heterodera avenae)、ダイズシストセンチュウ(Heterodera glycines)、テンサイシストセンチュウ(Heterodera schachtii)、クローバーシストセンチュウ(Heterodera trifolii)、および他のヘテロデラ(Heterodera)種；種子コブセンチュウ類のアンゲイナ・フネスタ(Anguina funesta)、コムギツブセンチュウ(Anguina tritici)および他のアンゲイナ(Anguina)種；クキおよびハセンチュウ類のイネシンガレセンチュウ(Aphelenchoides besseyi)、イチゴセンチュウ(Aphelenchoides fragariae)、ハガレセンチュウ(Aphelenchoides ritzemabosi)および他のアフエレンコイデス(Aphelenchoides)種；刺毛センチュウ類のベロノライムス・ロンギカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)および他のベロノライムス(Belonolaimus)種；マツセンチュウ類のマツノザイセンチュウ(Bursaphelenchus xylophilus)および他のブルサフェレンクス(Bursaphelenchus)種；ワセンチュウ類のクリコネマ(Criconema)種、クリコネメラ(Criconemella)種、

クリコネモイデス(Criconemoides)種およびメソクリコネマ(Mesocriconema)種；クキおよびリンケイセンチュウ類のイモグサレセンチュウ(Ditylenchus destructor)、ナミクキセンチュウ(Ditylenchus dipsaci)、キノコセンチュウ(Ditylenchus myceliophagus)および他のジチレンクス種；突錐センチュウ類のドリコドルス(Dolichodoros)種；ラセンセンチュウ類のナミラセンセンチュウ(Helicotylenchus dihystera)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス(Helicotylenchus multincinctus)および他のヘリコチレンクス種；ロチレンクス・ロボツス(Rotylenchus robustus)および他のロチレンクス種；鞘センチュウ類のヘミシクリオホラ(Hemicycliophora)種およびヘミクリコネモイデス(Hemicriconemoides)種；ヒルスマンニエラ(Hirshmanniella)種；ヤリセンチュウ類のホプロアィムス・コロンプス(Hoplolaimus columbus)、ホプロアィムス・ガレアツス(Hoplolaimus galeatus)および他のホプロアィムス(Hoplolaimus)種；ニセネコブセンチュウ類のナコブス・アベラン

植物寄生性線虫、例えばネコブセンチュウ類のアレナリアネコブセンチュウ(Meloidogyne arenaria)、コロンビアネコブセンチュウ(Meloidogyne chitwoodi)、メロイドギネ・エキシグア(Meloidogyne exigua)、キタネコブセンチュウ(Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita)、ジャワネコブセンチュウ(Meloidogyne javanica)、および他のメロイドギネ(Meloidogyne)属の種；シストセンチュウ類のジャガイモシストセンチュウ(Globodera rostochiensis)、ジャガイモシロシストセンチュウ(Globodera pallida)、タバコシストセンチュウ(Globodera tabacum)および他のグロボデラ(Globodera)種；穀物シストセンチュウ(Heterodera avenae)、ダイズシストセンチュウ(Heterodera glycines)、テンサイシストセンチュウ(Heterodera schachtii)、クローバーシストセンチュウ(Heterodera trifolii)、および他のヘテロデラ(Heterodera)種；種子コブセンチュウ類のアンゲイナ・フネスタ(Anguina funesta)、コムギツブセンチュウ(Anguina tritici)および他のアンゲイナ(Anguina)種；クキおよびハセンチュウ類のイネシンガレセンチュウ(Aphelenchoides besseyi)、イチゴセンチュウ(Aphelenchoides fragariae)、ハガレセンチュウ(Aphelenchoides ritzemabosi)および他のアフエレンコイデス(Aphelenchoides)種；刺毛センチュウ類のベロノライムス・ロンギカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)および他のベロノライムス(Belonolaimus)種；マツセンチュウ類のマツノザイセンチュウ(Bursaphelenchus xylophilus)および他のブルサフェレンクス(Bursaphelenchus)種；ワセンチュウ類のクリコネマ(Criconema)種、クリコネメラ(Criconemella)種、

クリコネモイデス(Criconemoides)種およびメソクリコネマ(Mesocriconema)種；クキおよびリンケイセンチュウ類のイモグサレセンチュウ(Ditylenchus destructor)、ナミクキセンチュウ(Ditylenchus dipsaci)、キノコセンチュウ(Ditylenchus myceliophagus)および他のジチレンクス種；突錐センチュウ類のドリコドルス(Dolichodoros)種；ラセンセンチュウ類のナミラセンセンチュウ(Helicotylenchus dihystera)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス(Helicotylenchus multincinctus)および他のヘリコチレンクス種；ロチレンクス・ロボツス(Rotylenchus robustus)および他のロチレンクス種；鞘センチュウ類のヘミシクリオホラ(Hemicycliophora)種およびヘミクリコネモイデス(Hemicriconemoides)種；ヒルスマンニエラ(Hirshmanniella)種；ヤリセンチュウ類のホプロアィムス・コロンプス(Hoplolaimus columbus)、ホプロアィムス・ガレアツス(Hoplolaimus galeatus)および他のホプロアィムス(Hoplolaimus)種；ニセネコブセンチュウ類のナコブス・アベラン

10

20

30

40

50



ス(*Nacobbus aberrans*)および他のナコブス(*Nacobbus*)種；ハリセンチュウ類のロンギドルス・エロンガテス(*Longidorus elongates*)および他のロンギドルス種；ピンセンチュウ類のプラティレンクス(*Pratylenchus*)種；ネグサレセンチュウ類のブラキユルスネグサレセンチュウ(*Pratylenchus brachyurus*)、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・クルピタツス(*Pratylenchus curvatus*)、プラチレンクス・ゴオデイ(*Pratylenchus goodeyi*)、ムギネグサレセンチュウ(*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ(*Pratylenchus penetrans*)、ネグサレセンチュウ(*Pratylenchus scribneri*)、クルミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus vulnus*)、モロコシネグサレセンチュウ(*Pratylenchus zaeae*)および他のプラチレンクス(*Pratylenchus*)種；ラジナフェレンクス・ココフィルス(*Radinaphelenchus cocophilus*)および他のラジナフェレンクス(*Radina phelenchus*)種；ネモグリセンチュウ類のバナナネモグリセンチュウ(*Radopholus similis*)および他のラドホルス(*Radopholus*)種；ニセフクロセンチュウ類のロチレンクルス・レニフォルミス(*Rotylenchulus reniformis*)および他のロチレンクルス(*Rotylenchulus*)種；スクテロネマ(*Scutellonema*)種；ユミハリセンチュウ類のトリコドルス・プリミチプス(*Trichodorus primitivus*)および他のトリコドルス(*Trichodorus*)種；ヒメユミハリセンチュウ(*Paratrachodorus minor*)および他のパラトリコドルス(*Paratrachodorus*)種；イシユクセンチュウ類のナミイシユクセンチュウ(*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・ズビウス(*Tylenchorhynchus dubius*)、および他のチレンコリンクス(*Tylenchorhynchus*)種ならびにメルリニウス(*Merlinius*)種；ミカンセンチュウ類のミカンネセンチュウ(*Tylenchulus semipenetrans*)および他のチレンクルス種；オオハリセンチュウ類のアメリカオオハリセンチュウ(*Xiphinema americanum*)、ブドウオオハリセンチュウ(*Xiphinema index*)、キシフィネマ・ジベルシカウダツム(*Xiphinema diversicaudatum*)および他のキシフィネマ(*Xiphinema*)種；ならびに他の植物寄生性線虫種。

#### 【0119】

さらに、本発明の混合物は、好ましくは桿線虫目(*Rhabditida*)、特に桿線虫科(*Rhabditidae*) (例えばカエノラブディティス(*Caenorhabditis*)属の種)の線虫の防除に有用である。

#### 【0120】

本発明の混合物は、広範囲の植物病原菌類、特に子囊菌類(*Ascomycetes*)、担子菌類(*Basidiomycetes*)、不完全菌類(*Deuteromycetes*)および卵菌類(*Peronosporomycetes*) (*Oomycetes*と同義)に対して優れた活性を有する。その一部は浸透移行効果を有し、葉面殺菌剤、種子粉衣用殺菌剤、および土壌殺菌剤として農作物の保護に用いることができる。これらは、種子処理用としても使用することができる。

#### 【0121】

本発明の混合物は、様々な栽培植物、例えばコムギ、ライムギ、オオムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシ、シバ、バナナ、ワタ、ダイズ、コーヒー、サトウキビ、ブドウの木、果樹および観賞植物、ならびにキュウリ、マメ、トマト、ジャガイモおよびウリなどの野菜、ならびにこれらの植物の種子につく様々な菌類の防除において特に重要である。

#### 【0122】

本発明の混合物は、以下に挙げる植物病害の防除に特に適している。

#### 【0123】

- 野菜、ナタネ、テンサイおよび果実、ならびにイネにつくアルテルナリア属の種(*Alternaria species*)、例えば、ジャガイモおよびトマトにつくアルテルナリア・ソラニ(*A. solani*)またはアルテルナリア・アルテルナータ(*A. alternata*);
- テンサイおよび野菜につくアファノミセス属の種(*Aphanomyces species*);
- 禾穀類および野菜につくアスコキタ属の種(*Ascochyta species*);
- トウモロコシ、禾穀類、イネおよびシバにつくビポラリス属の種(*Bipolaris species*)およびドレクスレラ属の種(*Drechslera species*)、例えば、トウモロコシにつくドレクスレラ・マイデイス(*D. maydis*);
- 禾穀類につくブルメリア・グラミニス(*Blumeria graminis*) (うどん粉病);

- イチゴ、野菜、花きおよびブドウの木につくボトリチス・シネレア(*Botrytis cinerea*)(灰色カビ病);
- レタスにつくブレミア・ラクツカエ(*Bremia lactucae*);
- トウモロコシ、ダイズ、イネおよびテンサイにつくセルコスボラ属の種(*Cercospora species*);
- トウモロコシ、禾穀類、イネにつくコクリオボルス属の種(*Cochliobolus species*)、例えば、禾穀類につくコクリオボルス・サチブス(*Cochliobolus sativus*)、イネにつくコクリオボルス・ミヤベアヌス(*Cochliobolus miyabeanus*);
- ダイズおよびワタにつくコレトトリクム属の種(*Colletotricum species*);
- トウモロコシ、禾穀類、イネおよびシバにつくドレクスレラ属の種(*Drechslera species*)、ピレノホラ属の種(*Pyrenophora species*)、例えば、オオムギにつくドレクスレラ・テレス(*D. teres*)またはコムギにつくドレクスレラ・トリティチレペンチス(*D. tritici-repentis*);
- ファエオアクレモニウム・クラミドスポリウム(*Phaeoacremonium chlamydosporium*)、ファエオアクレモニウム・アレオフィラム(*Ph. Aleophilum*)およびフォルミチボラ・プンクタタ(*Formitipora punctata*)(異名フェリヌス・プンクタツス(*Phellinus punctatus*))によってブドウの木に発症するエスカ(*Esca*)病;
- トウモロコシにつくエキセロヒルム属の種(*Exserohilum species*);
- キュウリにつくエリシフェ・シコラセアルム(*Erysiphe cichoracearum*)およびスファエロテカ・フリギネア(*Sphaerotheca fuliginea*);
- 様々な植物につくフサリウム属の種(*Fusarium species*)およびパーチシリウム属の種(*Verticillium species*)、例えば、禾穀類につくフサリウム・グラミネアラム(*F. graminearum*)もしくはフサリウム・クルモルム(*F. culmorum*)、または多数の植物、例えばトマトにつくフサリウム・オキシスポルム(*F. oxysporum*);
- 禾穀類につくゲウマノマイセス・グラミニス(*Gaeumanomyces graminis*);
- 禾穀類およびイネにつくジベレラ属の種(*Gibberella species*)(例えば、イネにつくジベレラ・フジクロイ(*Gibberella fujikuroi*));
- イネにつくグレインステイニング複合菌(*Grainstaining complex*);
- トウモロコシおよびイネにつくヘルミントスポリウム属の種(*Helminthosporium species*);
- 禾穀類につくマイクロドキウム・ニパーレ(*Microdochium nivale*);
- 禾穀類、バナナおよびラッカセイにつくミコスファエレラ属の種(*Mycosphaerella species*)、例えば、コムギにつくミコスファエレラ・グラミニコーラ(*M. graminicola*)またはバナナにつくミコスファエレラ・フィジエンシス(*M. fijiensis*);
- キャベツおよび球根植物につくペロノスポラ属の種(*Peronospora species*)、例えば、キャベツにつくペロノスポラ・ブラシカエ(*P. brassicae*)またはタマネギにつくペロノスポラ・デストラクター(*P. destructor*);
- ダイズにつくファコプサラ・パキリジ(*Phakopsara pachyrhizi*)およびファコプサラ・メイボミアエ(*Phakopsara meibomiaae*);
- ダイズおよびヒマワリにつくホモプシス属の種(*Phomopsis species*);
- ジャガイモおよびトマトにつくフィトフトラ・インフェスタンス(*Phytophthora infestans*);
- 様々な植物につくフィトフトラ属の種(*Phytophthora species*)、例えば、ピーマンにつくフィトフトラ・カプシキ(*P. capsici*);
- ブドウの木につくプラスモパラ・ピチコーラ(*Plasmopara viticola*);
- リンゴにつくポドスファエラ・レウコトリカ(*Podosphaera leucotricha*);
- 禾穀類につくシュードセルコスボレラ・ヘルボトリコイデス(*Pseudocercospora herp otrichoides*);
- 様々な植物につくシュードペロノスポラ(*Pseudoperonospora*)、例えば、キュウリにつくシュードペロノスポラ・キュベンシス(*P. cubensis*)またはホップにつくシュードペロノ

スポラ・フミリ(*P. humili*);

-様々な植物につくブクキニア属の種(*Puccinia species*)、例えば、禾穀類につくブクキニア・トリティチナ(*P. tritricina*)、ブクキニア・ストリホルミス(*P. striiformis*)、ブクキニア・ホルデイ(*P. hordei*)もしくはブクキニア・グラミニス(*P. graminis*)、またはアスパラガスにつくブクキニア・アスパラギ(*P. asparagi*);

-イネにつくピリクラリア・オリザエ(*Pyricularia oryzae*)、コルチシウム・ササキイ(*Corticium sasakii*)、サロクラジウム・オリザエ(*Sarocladium oryzae*)、サロクラジウム・アテヌアツム(*S. attenuatum*)、エンチロマ・オリザエ(*Entyloma oryzae*);

-シバおよび禾穀類につくピリクラリア・グリセア(*Pyricularia grisea*);

-シバ、イネ、トウモロコシ、ワタ、ナタネ、ヒマワリ、テンサイ、野菜およびその他の植物につくピシウム属の種(*Pythium spp.*)、例えば、様々な植物につくピシウム・ウルティウム(*P. ultimum*)、シバにつくピシウム・アフアニデルマツム(*P. aphanidermatum*);

-ワタ、イネ、ジャガイモ、シバ、トウモロコシ、ナタネ、テンサイ、野菜および様々な植物につくリゾクトニア属の種(*Rhizoctonia species*)、例えば、ビートおよび様々な植物につくリゾクトニア・ソラニ(*R. solani*);

-オオムギ、ライムギおよびライコムギにつくリンコスפורウム・セカリス(*Rhynchosporium secalis*);

-ナタネおよびヒマワリにつくスクレロチニア属の種(*Sclerotinia species*);

-コムギにつくセプトリア・トリチシ(*Septoria tritici*)およびスタゴノスポラ・ノドラム(*Stagonospora nodorum*);

-ブドウの木につくエリシフェ(異名ウンシヌラ(*Uncinula*))・ネカトール(*Erysiphe necator*);

-トウモロコシおよびシバにつくセトスパエリア属の種(*Setosphaeria species*);

-トウモロコシにつくスファセロテカ・レイリニア(*Sphacelotheca reilinia*);

-ダイズおよびワタにつくチエパリオブシス属の種(*Thievaliopsis species*);

-禾穀類につくチレチア属の種(*Tilletia species*);

-禾穀類、トウモロコシおよびサトウキビにつくウスチラゴ属の種(*Ustilago species*)、例えば、トウモロコシにつくウスチラゴ・マイディス(*Ustilago maydis*);

-リンゴおよびセイヨウナシにつくベンツリア属の種(*Venturia species*) (赤カビ病)、例えば、リンゴにつくベンツリア・イネクアリス(*V. inaequalis*)。 30

#### 【 0 1 2 4 】

本発明の混合物は、材料(例えば木材、紙、顔料分散液、生地、織布)の保護および貯蔵される生産物の保護における有害菌類の防除にも好適である。木材の保護において、以下の有害菌: 子囊菌綱(*Ascomycetes*)、例えばオフィオストマ(*Ophiostoma*)属の種、セラトシスチス(*Ceratocystis*)属の種、オーレオバシジウム・プルランス(*Aureobasidium pullulans*)、スクレロフォマ(*Sclerophoma*)属の種、ケトミウム属(*Chaetomium*)の種、フミコラ(*Humicola*)属の種、ペトリエラ(*Petriella*)属の種、トリクルス(*Trichurus*)属の種等; 担子菌綱(*Basidiomycetes*)、例えばコニオフォラ(*Coniophora*)属の種、コリオルス(*Coriolus*)属の種、グロエオフィルム(*Gloeophyllum*)属の種、レンチヌス(*Lentinus*)属の種、ヒラタケ(*Pleurotus*)属の種、アナタケ(*Poria*)属の種、セルブラ(*Serpula*)属の種及びオシロイタケ(*Tyromyces*)属の種等; 不完全菌綱(*Deuteromycetes*)、例えばアスペルギルス(*Aspergillus*)属の種、クラドスポリウム(*Cladosporium*)属の種、ペニシリウム(*Penicillium*)属の種、トリコルマ(*Trichorma*)属の種、アルテルナリア(*Alternaria*)属の種、ペシロマイセス(*Paecilomyces*)属の種等; 並びに、接合菌綱(*Zygomycetes*)、例えばムコール(*Mucor*)属の種等に対して特別な注意が払われ、加えて、貯蔵される生産物及び収穫物の保護において、以下の酵母菌に注目する価値がある: カンジダ(*Candida*)属の種及びサッカロマイセス・セレビスエ(*Saccharomyces cerevisiae*)。 40

#### 【 0 1 2 5 】

本発明の混合物は、チョウ類(鱗翅目(*Lepidoptera*))、甲虫類(鞘翅目(*Coleoptera*))、ハエおよびカ(双翅目(*Diptera*))、アザミウマ(総翅目(*Thysanoptera*))、シロア 50

リ(等翅目(Isoptera))、ナンキンムシ、アブラムシ、ヨコバイ、コナジラミ、カイガラムシ、セミ(半翅目(Hemiptera))、アリ、ミツバチ、スズメバチ、ハバチ(膜翅目(Hymenoptera))、コオロギ、バッタ、イナゴ(直翅目(Orthoptera))、ならびにまたクモ形類、例えばクモ形綱(ダニ目(Acarina))に属する昆虫などの有害生物を効果的に駆除するのに特に適している。

【0126】

さらに、本発明の混合物は、好ましくは、クモ形綱、特にクモ形類(ダニ目(Acarina))およびより好ましくはダニ(テトラニクス属の種(Tetranychus spp))の防除に有用である。

【0127】

製剤

本発明による混合物は、慣用の製剤、例えば、液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、散剤、粉剤、ペースト剤および粒剤に変換することができる。使用剤形は、特定の意図される目的によって決まる；いずれの場合も、本発明による化合物の微細で均一な分散が確実になされるように選択されなければならない。

【0128】

従って、本発明は、補助剤と、本発明による少なくとも1種の式Iの化合物Iおよび少なくとも1種の化合物IIの混合物とを含む農薬組成物にも関する。

【0129】

農薬組成物は、殺有害生物有効量の殺有害生物剤混合物を含む。「有効量」という用語は、栽培植物につく有害生物の防除または資材の保護には十分であり、且つ処理植物に実質的な損害を与えない、本組成物または本混合物の量を意味する。かかる量は、広範囲で異なっていてよく、また防除対象の動物有害生物種、処理される栽培植物または資材、気候条件および使用される具体的な混合物などの様々な要因によって決まる。

【0130】

本発明による混合物は、慣用の種類の農薬組成物、例えば液剤、エマルジョン剤、懸濁剤、散粉剤、粉剤、ペースト剤、粒剤、圧縮剤、カプセル剤およびこれらの混合物に変換することができる。組成物種の例には、懸濁剤(例えばSC、OD、FS)、乳剤(例えばEC)、エマルジョン剤(例えばEW、EO、ES、ME)、カプセル剤(例えばCS、ZC)、ペースト剤、芳香剤、粉末水和剤もしくは散粉剤(例えばWP、SP、WS、DP、DS)、圧縮剤(例えばBR、TB、DT)、粒剤(例えばWG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫物質(例えばLN)ならびに植物繁殖材料(例えば種子)の処理用のゲル剤(例えばGF)がある。これらのおよび他の組成物種は、"Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 第6版, 2008年5月(CropLife International)中に定義されている。

【0131】

上記の組成物は、MolletおよびGrube-mannにより、Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001に記載されるような公知の方法；またはKnowlesにより、New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005に記載されるような公知の方法で調製される。

【0132】

好適な補助剤は、溶媒、液体担体、固体担体または充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、助剤、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、付着剤、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激物質、適合化剤、殺細菌剤、凍結防止剤、消泡剤、着色剤、粘着付与剤および結合剤である。

【0133】

好適な溶媒および液体担体は、水および有機溶媒(例えば中～高沸点の鉱油画分(例えばケロセン、ディーゼルオイル)；植物または動物由来の油；脂肪族、環状および芳香族炭化水素(例えば、トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン)；アルコール(例えばエタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノール)；グリコール；DMSO；ケトン(例えばシクロヘキサノン)；エステ

10

20

30

40

50

ル（例えば乳酸塩、炭酸塩、脂肪酸エステル、ガンマ-ブチロラクトン）；脂肪酸；ホスホン酸塩；アミン；アミド（例えばN-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミド）；およびこれらの混合物である。

【0134】

好適な固体担体または充填剤は、鉱物質土類(mineral earth)（例えば、シリケート、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰石、石灰、チョーク、粘土、ドロマイト、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム）；多糖（例えば、セルロース、デンプン）；肥料（例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素）；植物起源の製品（例えば、穀粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉）およびこれらの混合物である。

10

【0135】

好適な界面活性剤は、アニオン性、カチオン性、非イオン性および両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、およびこれらの混合物などの界面活性化合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、または助剤として使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, (2008)(国際版または北米版)に挙げられる。

【0136】

好適なアニオン性界面活性剤は、スルホン酸塩、硫酸塩、リン酸塩、カルボン酸塩のアルカリ塩、アルカリ土類塩またはアンモニウム塩およびそれらの混合物である。スルホン酸塩の例は、アルキルアリアルスルホネート、ジフェニルスルホネート、アルファ-オレフィンスルホネート、リグニンスルホネート、脂肪酸および油のスルホン酸塩、エトキシ化アルキルフェノールのスルホン酸塩、アルコキシ化アリアルフェノールのスルホン酸塩、縮合ナフタレンのスルホン酸塩、ドデシルベンゼンおよびトリデシルベンゼンのスルホン酸塩、ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホン酸塩、スルホスクシネートまたはスルホスクシナメートである。硫酸塩の例は、脂肪酸および油の硫酸塩、エトキシ化アルキルフェノールの硫酸塩、アルコールの硫酸塩、エトキシ化アルコールの硫酸塩、または脂肪酸エステルの硫酸塩である。リン酸塩の例は、リン酸エステルである。カルボン酸塩の例は、カルボン酸アルキル、およびアルコキシ化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレートである。

20

30

【0137】

好適な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミノキシド、エステル、糖ベースの界面活性剤、ポリマー性界面活性剤、およびそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1~50当量アルコキシ化されているアルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリアルフェノール、脂肪酸または脂肪酸エステルなどの化合物である。エチレンオキシドおよび/またはプロピレンオキシド（好ましくはエチレンオキシド）をアルコキシ化に用いることができる。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミドまたは脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステルまたはモノグリセリドである。糖ベースの界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロースおよびグルコースエステルまたは

40

【0138】

好適なカチオン性界面活性剤は、第4級界面活性剤、例えば、1または2個の疎水基を有する第4級アンモニウム化合物、または長鎖第1級アミンの塩である。好適な両性界面活性剤は、アルキルベタインおよびイミダゾリンである。好適なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシドとポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B型またはA-B-A型のブロックポリマー、またはアルコール、ポリエチレンオキシドおよびポリプロピレンオキシドを含むA-B-C型のブロックポリマーである。好適な高分子電解質は、ポリ酸またはポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸またはポリ酸櫛型ポリマーのアルカリ塩である

50

。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミンまたはポリエチレンアミンである。

【0139】

好適な助剤は、それ自体の殺有害生物活性は無視し得るか、またはそれ自体は殺有害生物活性を有さず、標的に対する化合物Iの生物学的性能を高める化合物である。例としては、界面活性剤、鉱物油または植物油、および他の補助剤がある。他の例は、Knowlesにより、Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, 第5章に挙げられている。

【0140】

好適な増粘剤は、多糖(例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース)、無機粘土(有機修飾粘土または無修飾粘土)、ポリカルボキシレート、およびシリケートである。

10

【0141】

好適な殺細菌剤は、プロノポールおよび、アルキルイソチアゾリノンおよびベンズイソチアゾリノンなどのイソチアゾリノン誘導体である。

【0142】

好適な凍結防止剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素およびグリセリンである。

【0143】

好適な消泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール、および脂肪酸の塩である。

【0144】

好適な着色剤(例えばレッド、ブルー、またはグリーンの着色剤)は、低水溶性の顔料および水溶性染料である。例は、無機着色剤(例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸鉄)および有機着色剤(例えば、アリザリン着色剤、アゾ着色剤およびフトロシアニン着色剤)である。

20

【0145】

好適な粘着付与剤および結合剤は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物学的ワックスまたは合成ワックス、およびセルロースエーテルである。

【0146】

本農薬組成物は、一般に、活性物質を0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%、および特に0.5~75重量%含む。本活性物質は、純度90%~100%、好ましくは95%~100%(NMRスペクトルによる)で用いられる。

30

【0147】

種子処理用の液剤(LS)、サスポエマルション剤(SE)、フロアブル剤(FS)、乾燥処理用粉剤(DS)、スラリー処理用粉末水和剤(WS)、粉末水溶剤(SS)、エマルション剤(ES)、乳剤(EC)およびゲル剤(GF)は、通常、植物繁殖材料(特に種子)の処理を目的として用いられる。当該組成物は、2~10倍希釈後、直ぐに使用可能な製剤において、0.01~60重量%、好ましくは0.1~40重量%の活性物質濃度を与える。施用は、播種前または播種中に行うことができる。化合物Iおよびその組成物を、それぞれ植物繁殖材料(とりわけ種子)に施用する方法は、繁殖材料の粉衣法(dressing)、コーティング法(coating)、ペレットリング法(pelleting)、散粉法(dusting)、浸漬法(soaking)および畝間施用法(in-furrow)を包含する。好ましくは、化合物Iまたはその組成物は、それぞれ、発芽が誘導されないような方法、例えば種子粉衣法(seed dressing)、種子ペレットリング法(seed pelleting)、種子コーティング法(seed coating)および種子散粉法(seed dusting)によって植物繁殖材料に施用される。

40

【0148】

植物保護において用いられる場合、施用される活性物質の量は、所望の効果の種類に応じて、1ヘクタール当たり0.001~2kg、好ましくは1ヘクタール当たり0.005~2kg、より好ましくは1ヘクタール当たり0.05~0.9kg、特に1ヘクタール当たり0.1~0.75kgである。

【0149】

50

例えば、種子の散粉 (dusting)、コーティング (coating) または灌注 (drenching) による植物繁殖材料 (例えば種子) の処理において、活性物質の量は、植物繁殖材料 (好ましくは種子) 100キログラム当たり、0.1~1000g、好ましくは1~1000g、より好ましくは1~100gおよび最も好ましくは5~100gが一般的に必要とされる。

【0150】

資材または保存製品の保護において使用される場合、施用される活性物質の量は、施用領域および所望の効果の種類によって決まる。資材の保護において慣習的に施用される量は、例えば、処理される資材1立法メートル当たり、活性物質0.001g~2kg、好ましくは0.005g~1kgである。

【0151】

本活性物質またはそれらを含む組成物には、プレミックスとして、各種の油、湿潤剤、助剤、肥料、または微量栄養素、およびさらなる殺有害生物剤 (例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、成長調節剤、毒性緩和剤) を加えることが可能であり、または、適切であれば使用直前に添加することもできる (タンク混合)。これらの製剤は、本発明による組成物と、1:100~100:1、好ましくは1:10~10:1の重量比で混合することができる。

10

【0152】

使用者は、本発明による組成物を、通常、予備調剤 (predosage) 装置、背負噴霧機、噴霧タンク、散布航空機、または灌漑システムから施用する。一般的に、本農薬組成物は、水、緩衝液および/またはさらなる補助剤によって所望の施用濃度にすぐに使用できるスプレー液または本発明による農薬組成物が得られる。通常、農業有効面積1ヘクタール当たり20~2000リットル、好ましくは50~400リットルのすぐに使用できるスプレー液が施用される。

20

【0153】

1つの実施形態によれば、本発明による組成物の個々の成分 (例えば、キットの各部分または二成分混合物または三成分混合物の各部分) は、使用者自身によって噴霧タンク中で混合され、適切であればさらなる補助剤を加えてもよい。

【0154】

さらなる実施形態において、本発明による組成物の個々の成分または部分的にプレミックスされた成分 (例えば、式Iの化合物Iと群Mから選択される化合物IIとを含む成分) のいずれかは、使用者によって噴霧タンク中で混合され、適切であれば、さらなる補助剤および添加剤を加えてもよい。

30

【0155】

さらなる実施形態において、本発明による組成物の個々の成分または部分的にプレミックスされた成分 (例えば、式Iの化合物Iと群Mから選択される化合物IIとを含む成分) のいずれかは、一緒に (例えば、タンクミックス後に) または連続的に施用することが可能であり、これは「in situ」混合物を作成することを意味している。

【0156】

施用例

本化合物Iおよび1種以上の化合物IIは、同時に (すなわち一緒にもしくは別々に) 施用してもよいし、または順次 (すなわち次々と) 施用することにより、例えば植物などの所望の場所上に「in situ」混合物を作成してもよく、別々の施用の場合、その順番は、一般的に防除手段の結果に何の影響も与えない。

40

【0157】

本発明の化合物は、そのまままたは組成物の形態で、昆虫、または昆虫の攻撃から保護すべき植物、植物繁殖材料 (例えば種子)、土壌、表面、資材もしくは部屋を殺虫有効量の本活性化化合物で処理することにより用いられる。施用は、植物、植物繁殖材料 (例えば種子)、土壌、表面、資材または部屋に昆虫が感染する前と後の両方に行うことができる。

【0158】

本発明は、動物有害生物および有害菌類を駆除する方法にも関し、該方法は、菌類およ

50

び/または動物有害生物、動物有害生物が成長しているもしくは成長し得る生息地、繁殖場所、食物供給源、植物、種子、土壌、領域、物質もしくは環境、または動物の攻撃もしくは侵入から保護すべき物質、植物、種子、土壌、表面もしくは空間と、殺有害生物有効量の本発明の混合物とを接触させることを含む。

【0159】

本発明の混合物で処理することができる植物は、すべての遺伝子改変植物または遺伝子組換え植物、例えば、育種（遺伝子工学的方法を含む）により除草剤または殺菌剤または殺虫剤の作用に耐性を有する作物、または既存植物と比較して改変された性質を有する植物（例えば従来育種方法および/または突然変異体の生成、または組換え手法により生産することができる）を含む。

10

【0160】

本発明の混合物の一部は浸透作用を有し、これにより食葉性有害生物に対する植物苗条の保護ならびに土壌有害生物に対する種子および根の処理に使用することができる。

【0161】

化合物IおよびIIの混合物または対応する製剤は、有害菌類および動物有害生物、またはそれらの生息地、またはそれらがいない状態にすべき植物、種子、土壌、領域、物質もしくは空間を、殺有害生物有効量の混合物または、分離施用の場合には殺有害生物有効量の化合物IおよびIIで処理することにより施用される。施用は、有害菌類および/または動物有害生物による侵入の前であってもよく、後であってもよい。

20

【0162】

本化合物Iおよび1種以上の化合物IIは、通常、500:1~1:100の重量比で、好ましくは20:1~1:50、特に5:1~1:20の重量比で施用される。所望の効果に応じて、本発明による混合物の施用量は、5g/ha~2000g/ha、好ましくは50~1500g/ha、特に50~750g/haである。

【0163】

通常、「相乗的に有効な量」は、1種以上の活性化合物Iおよび1種以上の活性化合物IIが、500:1~1:100、好ましくは20:1~1:50、特に5:1~1:20の重量比で施用されることを意味する。化合物の性質に依存して、化合物Iと化合物IIとの重量比は、100:1~1:100から始まり、好ましくは20:1~1:20、特に10:1~1:10に変動し得る。

30

【0164】

さらなる活性化合物は、所望される場合、化合物Iに対して20:1~1:20の比で混合される。

【0165】

本発明による混合物は接触および摂取のいずれによっても有効である。

【0166】

本発明の好ましい実施形態によれば、本発明による混合物は土壌施用により用いられる。土壌施用は、特に、アリ、シロアリ、コオロギまたはゴキブリに対する使用において都合がよい。

【0167】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、アリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、カ、コオロギ、バッタまたはゴキブリなどの非作物有害生物に対する使用のため、本発明の混合物は餌調製品に調製される。

40

【0168】

餌は、液状、固形または半固形の調製物（例えばゲル）であってよい。

【0169】

本発明の別の態様は、本混合物を調製する場合、純粋な本活性化合物IおよびIIを用いることが好ましく、これにさらなる活性化合物（例えば有害菌類に対する活性化合物もしくは除草活性を有する活性化合物）、または成長調節剤もしくは肥料を加えてもよい。

【0170】

本発明の組成物は、上記に挙げたもの以外にも、さらに他の活性成分を含み得る。例え

50



ば、殺菌剤、除草剤、肥料（例えば硝酸アンモニウム、尿素、炭酸カリウムおよび過リン酸塩）、植物毒性剤および植物成長調節剤ならびに毒性緩和剤である。これらの追加成分は、上述の組成物と順次使用するか、または組み合わせて使用することができるが、適切であれば、使用直前にのみ添加することもできる（タンク混合）。例えば、植物には、他の活性成分を用いて処理する前または後のいずれかに、本発明の組成物を散布することができる。

【0171】

本発明による混合物は、任意のおよびすべての成長段階（例えば、卵、幼生、蛹および成体）に施用することができる。有害生物は、その標的有害生物、その餌供給源、生息地、繁殖地またはその生息場所を、殺有害生物有効量の本発明の混合物または本混合物を含む組成物と接触させることにより防除することができる。

10

【0172】

「生息場所 (locus)」は、有害生物が成長しているか、または成育する可能性のある植物、種子、土壌、区域、資材または環境を意味する。

【0173】

一般に、「殺有害生物有効量」とは、成長に対する顕著な作用（ネクロシス、死滅、遅延、阻止、および除去、駆除の作用を含む）を得るために必要とされる本発明の混合物の量または本混合物を含む組成物の量、さもなければ、標的生物の発生および活動を低減するのに必要とされるそれらの量を意味する。殺有害生物有効量は、本発明で用いられる各種混合物および/または組成物により変動し得る。また混合物および/または組成物の殺有害生物有効量は、例えば、所望の殺有害生物作用および持続期間、天候、標的種、生息場所、施用様式などの一般的な条件等によっても変わるであろう。

20

【0174】

また、本発明の混合物またはこれらの混合物の組成物は、植物または該植物が成長している土壌もしくは水と接触させることを含む、昆虫、ダニ類または線虫による攻撃または侵入からの植物の保護に用いることもできる。

【0175】

本発明の混合物は、接触（土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物の各部分または動物の各部分を介した接触）、および摂取（餌または植物の各部分）の両方を介して、また栄養交換 (trophallaxis) および移送 (transfer) を介して効く。

30

【0176】

好ましい施用方法は、水塊 (water bodies) への施用、土壌、割れ目および隙間、牧草地、肥料の山 (manure piles)、下水道を介しての施用、水への施用、床上、壁への施用、または周囲への散布施用および餌による施用である。

【0177】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、アリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、カ、コオロギ、バッタまたはゴキブリなどの非作物有害生物に対する使用のため、本発明の混合物は餌調製品に調製される。

【0178】

餌は、液状、固形または半固形の調製物（例えばゲル）であってもよい。本組成物で使用される餌は、アリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、カ、コオロギ等またはゴキブリなどの昆虫がそれを食べるよう刺激するのに十分に誘引性のある製品である。この誘引物質は、当技術分野において容易に公知の摂食刺激物質あるいはパラフェロモンおよび/または性フェロモンから選択することができる。

40

【0179】

本発明の混合物およびその各組成物を用いて、昆虫によって伝搬される感染症（例えばマラリア、デング熱および黄熱病、リンパ管フィラリア症およびリーシュマニア症）を抑制する方法は、小屋および住居の表面の処理、空気噴霧、ならびにカーテン、テント、衣類、蚊帳、ツェツェパエ用捕獲具等の含浸も含む。繊維、織物、ニットウェア、不織布、ネット状資材またはホイルおよび防水布へ施用するための殺虫剤組成物は、好ましくは、

50

本発明の混合物を含み、場合により忌避剤と少なくとも1種の結合剤を含んでいる組成物を含む。

【0180】

本発明の混合物およびそれらを含む組成物は、木製材料(例えば木、板塀、枕木など)、および建物(例えば家、離れ家、工場など)だけでなく、建設資材、家具、皮革、繊維、ビニル製品、電線、およびケーブル等もアリおよび/またはシロアリから保護するため、ならびに作物またはヒトに害を及ぼすこと(例えば、有害生物が家屋や公共施設へ侵入する場合)からアリおよびシロアリを防除するために用いることができる。

【0181】

土壌処理の場合または有害生物の居場所もしくは巣へ施用する場合、活性成分の量は、100m<sup>2</sup>当たり0.0001~500g、好ましくは100m<sup>2</sup>当たり0.001~20gの範囲である。

10

【0182】

資材の保護における慣用の施用量は、例えば、処理される資材1m<sup>2</sup>当たり、活性化合物0.01g~1000g、望ましくは1m<sup>2</sup>当たり0.1g~50gである。

【0183】

資材の含浸において使用する殺虫剤組成物は、典型的には0.001~95重量%、好ましくは0.1~45重量%、さらに好ましくは1~25重量%の少なくとも1種の忌避剤および/または殺虫剤を含有する。

【0184】

餌組成物で使用する場合には、活性成分の典型的な含有量は、活性化合物0.0001重量%~15重量%、望ましくは0.001重量%~5重量%である。また、使用する本組成物は、他の添加剤、例えば、活性物質の溶媒、着香料、保存剤、染料または苦味剤を含んでいてもよい。その誘引性を特定の色、形状または質感により高めることもできる。

20

【0185】

スプレー剤組成物で使用する場合には、活性成分の混合物の含有量は、0.001~80重量%、好ましくは0.01~50重量%、最も好ましくは0.01~15重量%である。

【0186】

作物の処理で使用する場合、本発明の活性成分の混合物の施用量は、1ヘクタール当たり0.1g~4000g、望ましくは1ヘクタール当たり25g~600g、より望ましくは1ヘクタール当たり50g~500gの範囲であってよい。

30

【0187】

本発明の内容において、植物という用語は、植物全体、植物または植物繁殖材料の一部を指す。

【0188】

本発明の混合物およびこれらを含む組成物は、様々な栽培植物につく多数の昆虫の防除において特に重要である。

【0189】

本発明の混合物で処理し得る植物としては、全ての遺伝子組換え植物またはトランスジェニック植物、例えば、育種(遺伝子操作法を含む)により除草剤または殺菌剤または殺虫剤の作用に耐性である作物、または、例えば従来 of 育種方法および/または突然変異体作製、または組み換え方法によって作製することができる、既存の植物と比較して改変された特性を有する植物が挙げられる。

40

【0190】

「植物繁殖材料(plant propagation material)」という用語は、植物の繁殖力のある部分全て、例えば、種子や成長力のある植物材料(挿し木および塊茎(例えばジャガイモ)など)であって、植物の繁殖に使用することができるものを表すものと理解されたい。この用語は、種子、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎、苗条、芽および他の植物部分を包含する。また、発芽後もしくは土壌から出芽した後に移植される苗木および若木も包含され得る。これらの若木は移植の前に、浸漬または注入による全体処理または部分処理によって保護することもできる。

50

## 【0191】

「栽培植物」という用語は、育種、突然変異体作製法または遺伝子操作によって改変されている植物を含むものと理解されたい。遺伝子組換え植物は、組換えDNA技術の使用により、自然環境下においては交雑育種、突然変異または自然組換えによっては取得することが出来ないように遺伝物質を改変した植物である。典型的には、植物の特定の特性を改善するため、1種以上の遺伝子が、遺伝子組換え植物の遺伝物質に組み込まれている。

## 【0192】

「栽培植物」という用語は、従来の育種法または遺伝子操作法の結果として、特定のクラスの除草剤、例えばヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤；アセト乳酸合成酵素(ALS)阻害剤、例えばスルホニル尿素(例えば、US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照)またはイミダゾリノン(例えば、US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照)；エノールピルビルシキメート-3-ホスフェート合成酵素(EPSPS)阻害剤、例えばグリホサート(例えばWO 92/00377を参照)；グルタミン合成酵素(GS)阻害剤、例えばグルホシネート(例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246を参照)またはオキシニル除草剤(例えばUS 5,559,024を参照)の施用に対して耐性となっている植物も包含すると理解されたい。いくつかの栽培植物は、従来の育種法(突然変異体作製法)によって除草剤耐性となっており、例えば、イミダゾリノン(例えばイマザモックス)に耐性のあるClearfield(登録商標)ナッセイヨウアブラナ(Canola)がある。遺伝子操作法を用いて、ダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビートおよびアブラナなどの栽培植物に、グリホサートおよびグルホシネートなどの除草剤に対する耐性が付与されており、これらの一部はRoundupReady(登録商標)(グリホサート)およびLibertyLink(登録商標)(グルホシネート)という商品名で市販されている。

## 【0193】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技術を使用することにより、次に挙げるような1種以上の殺虫タンパク質を合成することができる植物も包含するものと理解されたい：特にバチルス属細菌(特にバチルス・スリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*))由来として知られているもの、例えば -エンドトキシン(ae-endotokines)、例えばCryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)またはCry9c；植物性殺虫タンパク質(VIP)、例えばVIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A；線虫にコロニーをつくる細菌の殺虫タンパク質、例えばフォトラブダス属の種(*Photorhabdus* spp.)またはゼノラブダス属の種(*Xenorhabdus* spp.)；動物によって産生される毒素、例えばサソリ毒、クモ毒、ハチ毒または他の昆虫特異的神経毒；菌類によって産生される毒素、例えばストレプトマイセス(*Streptomyces*)毒、植物レクチン(例えばエンドウレクチンもしくはオオムギレクチン)；アグルチニン；プロテイナーゼ阻害剤、例えばトリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン(patatin)、シスタチンまたはババイン阻害剤；リボソーム不活化タンパク質(RIP)、例えばリシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン(luffin)、サポリンまたはブリヨジン(bryodin)；ステロイド代謝酵素、例えば3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-IDP-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、エクジソン阻害剤またはHMG-CoA-レダクターゼ；イオンチャネル遮断薬、例えばナトリウムチャネルまたはカルシウムチャネル遮断薬；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体(ヘリコキニン(helicokinin)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、キチナーゼまたはグルカナーゼ。本発明においては、これらの殺虫タンパク質または毒素は、前毒素、ハイブリッドタンパク質、切断型タンパク質あるいは改変型タンパク質としても明らかに理解されよう。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新たな組合せによって特徴付けられる(例えば、WO 02/015701を参照)。かかる毒素、またはかかる毒素を合成することができる遺伝子組換え植物のさらなる例は、例えば、EP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、W

0 03/018810およびWO 03/052073に開示されている。かかる遺伝子組換え植物の作製法は当業者に一般的に公知であり、例えば上記の刊行物中に記載されている。遺伝子組換え植物に含まれるこれらの殺虫タンパク質は、これらのタンパク質を生成する植物に、昆虫の全ての分類群に由来する有害生物、特に甲虫類(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)および蝶類(鱗翅目)に対する耐性を与える。

【0194】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技術の使用により、細菌病原体、ウイルス病原体または真菌病原体に対する植物の抵抗性または耐性を高める1種以上のタンパク質を合成することができる植物も包含するものと理解されたい。かかるタンパク質の例には、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRタンパク質、例えばEP-A 0 392 225を参照)、植物病害抵抗性遺伝子(例えばフィトフトラ・インフェスタンス(*Phytophthora infestans*)に対して作用する抵抗性遺伝子を発現する、メキシコの野生ジャガイモであるソラヌム・ブルボカスタヌム(*Solanum bulbocastanum*)に由来する、ジャガイモ栽培品種)、またはT4-リゾチーム(例えば、これらのタンパク質を合成することができるジャガイモ栽培品種であって、火傷病菌(エルウィニア・アミロボラ(*Erwinia amylovora*))などの細菌に対する抵抗性が高められたもの)がある。かかる遺伝子組換え植物の作製法は当業者に一般的に公知であり、例えば上記の刊行物中に記載されている。

10

【0195】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技術の使用により、生産性(例えばバイオマス生産、穀物収率、デンプン含有量、油含有量もしくはタンパク質含有量)、干ばつ、塩分または他の成長を制限する環境要因に対する耐性、あるいはこれらの植物の有害生物および真菌病原体、細菌病原体またはウイルス病原体に対する耐性を高める1種以上のタンパク質を合成することができる植物も包含するものと理解されたい。

20

【0196】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技術の使用により、特にヒトまたは動物の栄養を改善することを目的とした、改変量の含有物または新たな含有物を含む植物(例えば、健康を促進する長鎖オメガ-3脂肪酸または不飽和オメガ-9脂肪酸を生産する油料作物(例えばNexera(登録商標)のアブラナ))も包含するものと理解されたい。

【0197】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技術の使用により、特に原料生産を改善することを目的とした、改変量の含有物または新たな含有物を含む植物(例えば増加量のアミロペクチンを生産するジャガイモ(例えばAmflora(登録商標)のジャガイモ))も包含するものと理解されたい。

30

【0198】

本発明の混合物の一部は浸透作用を有し、これにより食葉性有害生物に対する植物苗条の保護ならびに土壌有害生物に対する種子および根の処理に使用することができる。

【0199】

種子処理

従って、本発明による混合物は、昆虫有害生物(特に土壌中に生息している昆虫有害生物)から種子を保護し、生じる植物の根および苗条を土壌有害生物および食葉性昆虫から保護するための種子の処理に適している。

40

【0200】

上記の生じる植物の根および苗条の保護が好ましい。

【0201】

さらに好ましいのは、生じる植物の苗条の、刺吸型昆虫からの保護である。

【0202】

従って、本発明は、昆虫から(特に土壌昆虫から)種子を保護し、かつ昆虫から(特に土壌昆虫および食葉性昆虫から)苗木の根および苗条を保護する方法を含み、この方法は、播種前および/または前発芽後の種子を本発明による混合物と接触させることを含む。特に好ましいのは、植物の根および苗条を保護する方法、さらに好ましいのは、植物の苗

50

条を刺吸型昆虫から保護する方法、最も好ましいのは、植物の苗条をアブラムシから保護する方法である。

【0203】

「種子」という用語は、真正種子、種子片、吸枝、球茎、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、挿し木、切断した苗条などを含むがこれらに限定されない、あらゆる種類の種子および植物珠芽を包含し、好適な実施形態では、真正種子を意味する。

【0204】

種子処理という用語は、種子粉衣、種子コーティング、種子散粉、種子浸漬、および種子ペレット化などの当技術分野で公知のあらゆる好適な種子処理技術を包含する。

【0205】

本発明はまた、本活性化化合物でコーティングされた、または本活性化化合物を含む種子も包含する。「コーティングされたおよび/または含む」という用語は、一般的に、本活性成分の一部が多かれ少なかれ施用方法に応じて繁殖製品に浸透しうるが、本活性成分は大部分が施用時に繁殖材料の表面上にあることを意味する。当該繁殖製品を（再度）植え付ける場合、それは活性成分を吸収し得る。

【0206】

好適な種子は、穀物、根菜作物、油料作物、野菜、香辛料、観賞植物の種子、例えばデュラムおよび他のコムギ、オオムギ、オートムギ、ライムギ、トウモロコシ（飼料用トウモロコシおよび砂糖用トウモロコシ/スイートコーンおよびフィールドコーン）、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、アブラナ、カブ、テンサイ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、牧草、芝生、芝、飼料用の草、トマト、リーキ、カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ属の種、メロン、マメ、エンドウマメ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、ジャガイモなどの塊茎植物、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/テンジクアオイ、パンジーおよびインパチェンスの種子である。

【0207】

さらに、本発明による混合物は、育種（遺伝子操作法を含む）により除草剤または殺菌剤または殺虫剤の作用に耐性を示す植物から得られる種子の処理にも使用することができる。

【0208】

例えば、本活性混合物は、スルホニル尿素、イミダゾリノン、グルホシネート-アンモニウムまたはグリホセート-イソプロピルアンモニウムおよび同様の活性物質からなるグループに属する除草剤に耐性である植物（例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246を参照）(WO 92/00377) (EP-A-0257993、米国特許第5,013,659号) から得られる種子、または植物をある種の有害生物に対して耐性にするパチルス・チューリングエンシス毒素（Bt毒素）を産生する能力があるトランスジェニック作物（例えば、ワタ）(EP-A-0142924、EP-A-0193259)の種子の処理に用いることができる。

【0209】

さらに、本発明による混合物はまた、例えば伝統的な育種法および/または突然変異体の作製により、あるいは組換え法によって作製し得る、既存の植物と比較して改変された特徴を有する植物から得られる種子の処理にも使用することができる。例えば、植物中で合成されるデンプンを改変する目的の作物の組換え改変の多数の事例が記載されており（例えば、WO92/11376、WO92/14827、WO91/19806）、また、改変された脂肪酸組成を有するトランスジェニック作物についても多数の事例が記載されている（WO91/13972）。

【0210】

本混合物の種子処理施用は、植物の播種前および植物出芽の前に、種子に散布または散粉することによって行われる。

【0211】

種子の処理において、対応する製剤は、種子を有効量の本発明による混合物で処理することによって施用される。本明細書において、本活性化化合物の施用量は、通常、種子100k

10

20

30

40

50

gあたり0.1g～10kg、好ましくは種子100kgあたり1g～5kg、特に種子100kgあたり1g～2.5kgである。レタスなどの特定の作物については、この量はさらに高くなり得る。

【0212】

種子処理に特に有用な組成物は、例えば以下のものである。

【0213】

- A 液剤(SL、LS)
- D エマルション剤(EW、EO、ES)
- E 懸濁液剤(SC、OD、FS)
- F 顆粒水和剤および顆粒水溶剤(WG、SG)
- G 粉末水和剤および粉末水溶剤(WP、SP、WS)
- H ゲル剤(GF)
- I 粉剤(DP、DS)。

10

【0214】

通常の種子処理用の製剤としては、例えば、フロアブル剤(FS)、液剤(LS)、乾燥処理用粉剤(DS)、スラリー処理用粉末水和剤(WS)、粉末水溶剤(SS)、エマルション剤(ES)およびEC、ゲル剤(GF)が挙げられる。これらの製剤は希釈してまたは希釈しないで種子に施用することができる。種子への施用は、播種前に、種子に直接行うか、または種子を前発芽させた後に行う。

【0215】

好ましい実施形態では、FS剤が種子処理に用いられる。典型的には、FS剤は1～800g/lの活性成分、1～200g/lの界面活性剤、0～200g/lの凍結防止剤、0～400g/lの結合剤、0～200g/lの顔料、および1リットルまでの溶媒(好ましくは水)を含み得る。

20

【0216】

種子処理用の好ましい式Iの化合物のFS剤は、通常、0.1～80重量%(1～800g/l)の活性成分、0.1～20重量%(1～200g/l)の少なくとも1種の界面活性剤、例えば0.05～5重量%の湿潤剤および0.5～15重量%の分散剤、20重量%まで(例えば5～20重量%)の凍結防止剤、0～15重量%(例えば1～15重量%)の顔料および/または染料、0～40重量%(例えば1～40重量%)の結合剤(展着剤/粘着剤)、任意で5重量%まで(例えば0.1～5重量%)の増粘剤、任意で0.1～2%の消泡剤、および任意で殺生物剤のような防腐剤、酸化防止剤など(例えば、0.01～1重量%の量)、ならびに全量100重量%までの充填剤/賦形剤を含有する。

30

【0217】

種子処理用の製剤はさらに結合剤を含み、任意で着色剤を含んでもよい。

【0218】

結合剤は、処理後の種子への活性物質の付着を高めるために添加し得る。好適な結合剤はブロックコポリマーのEO/PO界面活性剤であるが、さらに、ポリビニルアルコール類、ポリビニルピロリドン類、ポリアクリレート類、ポリメタクリレート類、ポリブテン類、ポリイソブチレン類、ポリスチレン、ポリエチレンアミン類、ポリエチレンアミド類、ポリエチレンイミン類(Lupasol(登録商標)、Polymin(登録商標))、ポリエーテル類、ポリウレタン類、ポリビニルアセテート、チロースおよびこれらのポリマー由来のコポリマーも好適である。

40

【0219】

場合により、上記の製剤には着色剤をも含めることができる。種子処理製剤に好適な着色剤または染料は、以下のものである：ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112、C.I.ソルベントレッド1、ピグメントブルー15：4、ピグメントブルー15：3、ピグメントブルー15：2、ピグメントブルー15：1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48：2、ピグメントレッド48：1、ピグメントレッド57：1、ピグメントレッド53：1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレット10、ベーシックバイオ

50

レット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108。

【0220】

また本発明は、本発明による混合物を含む種子にも関する。化合物Iまたはその農業上  
有用な塩の量は、一般に、種子100kgあたり0.1g~10kg、好ましくは種子100kgあたり1gか  
ら5kg、特に種子100kgあたり1g~1000gの範囲で変化し得る。

【実施例】

【0221】

ここで本発明は、以下の実施例によってさらに詳細に説明される。

【0222】

式Iの化合物Iは、有機化学の標準的な方法に従って（例えば、WO 2010/100189に記載さ  
れる方法または実施例により）達成することができる。

【0223】

好ましい化合物Iの例の一部は、以下の表CE.1.1において、またさらに後続の表CE.1.1-  
D.1におけるそれらの物性データによって特性決定される。特性決定は、連結高速液体ク  
ロマトグラフィー/質量分析法(HPLC/MS)により、NMRにより、またはそれら化合物の融点  
によって行うことができる。

【0224】

化合物Iは、<sup>1</sup>H-NMR分光法によって特性決定した。シグナルは、テトラメチルシランに  
対するケミカルシフト(ppm)、その多重度およびその積分(所与の水素原子の相対数)によ  
って特性決定される。以下の略号は、シグナルの多重度を特性決定するために用いられる  
: M = 多重項、q = 四重項、t = 三重項、d = 二重項およびs = 一重項。

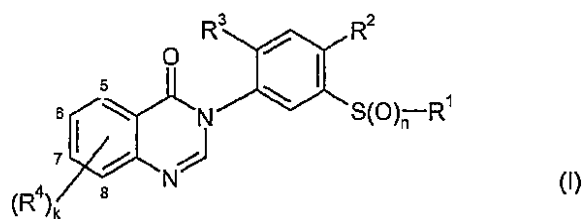
【0225】

また、本化合物Iは、LC-MS(高速液体クロマトグラフィー/質量分析(HPLC/MS))によっ  
ても特性決定した。式Iの化合物Iは、好ましくはHPLCによって特性決定され、これは分析RP  
-18カラム(Merck KGaA(ドイツ)製のChromolith Speed ROD)を使用し、40℃で操作して実  
施した。0.1%体積のトリフルオロ酢酸/水の混合物と0.1%体積のトリフルオロ酢酸とを  
含むアセトニトリルが移動相としての役割を果たした；流量：1.8mL/分、および注入量：  
2μlであった。

【0226】

本発明の、式(I)：

【化15】



【0227】

で表されるアリールキナゾリノン化合物Iの具体的な化合物例の一部は、本明細書中の以  
下の表CE.1に挙げられ、これらの各物性データは、後続の表CE-D.1に示される：

【表 3】

表 CE.I.1\*:

化合物	(R <sup>4</sup> ) <sub>k</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	n
CE.I.1.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	2
CE.I.2.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	n-プロピル	0
CE.I.3.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	n-プロピル	1
CE.I.4.	8-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.5.	8-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.6.	8-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.7.	8-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.8.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	3,4,4-トリフルオロ-3-ブテン-1-イル	0
CE.I.9.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	3,4,4-トリフルオロ-3-ブテン-1-イル	1
CE.I.10.	k = 0	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.11.	k = 0	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.12.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	シクロプロピルメチル	0
CE.I.13.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	シクロプロピルメチル	1
CE.I.14.	6-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.15.	6-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.16.	7-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.17.	7-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.18.	7-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.19.	7-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.20.	6-OCH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.21.	6-OCH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.22.	5-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.23.	5-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.24.	6-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.25.	6-CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.26.	5-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.27.	5-Cl	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.28.	k = 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.29.	k = 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.30.	6-F	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.31.	6-F	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.32.	6-CF <sub>3</sub> O	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.33.	6-CF <sub>3</sub> O	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1
CE.I.34.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	0
CE.I.35.	k = 0	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -	1

\*表 CE.I.1 のいくつかの化合物例は、表 C.I.1 中に本発明の好ましい化合物 I としても記載されている。

10

20

30



【表 4】

表 CE.I.1.-D.1:

化合物	物理化学データ: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz) $\delta$ または r.t. [分]/ $\text{M}^+$
CE.I.1.	3.13 分/ 400.05
CE.I.2.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.39\sim 8.36$ (m, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.84~7.77 (m, 2H), 7.58~7.54 (m, 1H), 7.28~7.25 (m, 1H), 7.17 (d, 1H, $J = 10.4$ Hz), 2.88~2.84 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 1.74~1.65 (m, 2H), 1.06 ~1.04 (m, 3H)
CE.I.3.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.37\sim 8.35$ (m, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, $J = 7.0$ Hz), 7.85~7.78 (m, 2H), 7.59~7.55 (m, 1H), 7.18 (d, 1H, $J = 10$ Hz), 2.86~2.72 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.94~1.73 (m, 2H), 1.25 (s, 3H)
CE.I.4.	$\text{CD}_3\text{OD}$ : $\delta = 8.19$ (s, 1H), 8.13~8.11 (m, 1H), 7.78 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.33 (d, 1H, $J = 10.8$ Hz), 3.73~3.66 (m, 2H), 2.64 (s, 3H), 2.56 (s, 3H)
CE.I.5.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.13$ (d, 1H, $J = 8$ Hz), 8.01 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.94 (s, 1H), 7.62 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.41~7.31 (m, 1H), 7.19~7.17 (m, 1H), 3.48~3.40 (m, 2H), 2.6 (s, 3H), 2.42 (s, 3H)
CE.I.6.	$\text{CD}_3\text{OD}$ : $\delta = 8.29$ (s, 1H), 8.24~8.21 (m, 1H), 7.99~7.97 (m, 1H), 7.80 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.58~7.54 (m, 1H), 7.35~7.32 (m, 1H), 3.73~3.66 (m, 2H), 2.56 (s, 3H)
CE.I.7.	$\text{CD}_3\text{OD}$ : $\delta = 8.36$ (s, 1H), 8.25~8.23 (m, 1H), 8.12 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 8.01~7.99 (m, 1H), 7.60~7.55 (m, 1H), 7.46~7.45 (m, 1H), 4.09~3.84 (m, 2H), 2.53 (s, 3H)
CE.I.8.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.31\sim 8.29$ (m, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.78~7.70 (m, 2H), 7.52~7.48 (m, 1H), 7.30~7.28 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.12~7.1 (d, 1H, $J = 10$ Hz), 3.01~2.98 (m, 2H), 2.61~2.50 (m, 2H), 2.41 (s, 3H)
CE.I.9.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.36$ (t, 1H, $J = 0.8$ Hz), 8.02 (d, 1H, $J = 0.8$ Hz), 8.00 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.61~7.56 (m, 1H), 7.23 (d, 1H, $J = 9.6$ Hz), 3.15~3.11 (m, 1H), 3.09~2.87 (m, 2H), 2.87~2.68 (m, 1H), 2.47 (s, 3H)
CE.I.10.	$\text{DMSO-d}_6$ : $\delta = 8.32$ (s, 1H), 8.21 (d, 1H, $J = 8$ Hz), 7.90~7.88 (m, 1H), 7.46~7.23 (m, 2H), 7.63~7.61 (m, 1H), 7.45~7.43 (m, 1H), 7.37 (dd, 1H, $J = 1$ Hz, 8Hz), 4.08~4.06 (m, 2H), 2.42 (s, 3H)
CE.I.11.	$\text{DMSO-d}_6$ : $\delta = 8.41$ (s, 1H), 8.22 (d, $J = 8$ Hz), 7.91 (dd, 1H, $J = 1.6$ Hz, 7.6 Hz), 7.89 (d, 1H, $J = 7.6$ Hz), 7.78~7.70 (m, 2H), 7.64~7.55 (m, 2H), 7.26~7.04 (m, 2H), 2.32 (s, 3H)
CE.I.12.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.14$ (d, 1H, $J = 9.2$ Hz), 7.79 (s, 1H), 7.59~7.54 (m, 2H), 7.35~7.13 (m, 1H), 7.08 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 6.91 (d, 1H, $J = 12.4$ Hz), 2.58 (d, 1H, $J = 6.8$ Hz), 2.24 (s, 3H), 0.82~0.80 (m, 1H), 0.39~0.34 (m, 2H), 0.04~0.03 (m, 2H)
CE.I.13.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.36\sim 8.34$ (m, 1H), 8.02~8.00 (m, 2H), 7.83~7.78 (m, 2H), 7.58 (t, 1H, $J = 5.6$ Hz), 7.17 (d, 1H, $J = 10.4$ Hz), 2.81~2.75 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.10~1.086 (m, 1H), 0.71~0.66 (m, 2H), 0.31~0.28 (m, 2H)
CE.I.14.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.25$ (d, 1H, $J = 2.4$ Hz), 7.910 (s, 1H), 7.707~7.647 (m, 2H), 7.51 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.16 (t, 1H, $J = 11.2$ Hz), 3.341~3.269 (m, 2H), 2.500 (s, 3H)
CE.I.15.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.24$ (d, 1H, $J = 2.8$ Hz), 8.010~7.923 (m, 1H), 7.921 (s, 1H), 7.724~7.663 (m, 2H), 7.206~7.181 (m, 1H), 3.478~3.404 (m, 2H), 2.425 (s, 3H)
CE.I.16.	$\text{CD}_3\text{OD}$ : $\delta = 8.25$ (d, 1H, $J = 8$ Hz), 7.97 (d, 1H, $J = 0.8$ Hz), 7.61~7.58 (m, 2H), 7.41~7.39 (m, 1H), 7.23~7.21 (m, 1H) 3.43~3.36 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 2.56 (s, 3H)

10

20

30

40

化合物	物理化学データ: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz) $\delta$ または r.t. [分]/ $\text{M}^+$
CE.I.17.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.24$ (d, 1H, $J = 8$ Hz), 8.09 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.99 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.42~7.39 (m, 1H), 7.26 (d, 1H, $J = 10.4$ Hz), 3.57~3.48 (m, 2H), 2.56 (s, 3H), 2.50 (s, 3H)
CE.I.18.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.22$ (d, 1H, $J = 7.6$ Hz), 7.93 (s, 1H), 7.71 (d, 1H, $J = 2$ Hz), 7.51 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.46~7.44 (m, 1H), 7.15 (d, 1H, $J = 10$ Hz), 3.34~3.27 (m, 2H), 2.5 (s, 3H)
CE.I.19.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.33$ (s, 1H), 8.27 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 8.10 (d, 1H, $J = 7.6$ Hz), 7.80 (d, 1H, $J = 2$ Hz), 7.64~7.62 (m, 1H), 7.45 (d, 1H, $J = 10.4$ Hz), 4.02~3.89 (m, 2H), 2.53 (s, 3H)
CE.I.20.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 7.92$ (d, 1H, $J = 1.2$ Hz), 7.92~7.72 (m, 2H), 7.60 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.44~7.41 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.23 (d, 1H, $J = 10.4$ Hz), 3.95 (s, 3H), 3.43~3.36 (m, 2H), 2.58 (s, 3H)
CE.I.21.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.10$ (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.93 (s, 1H), 7.75~7.07 (m, 2H), 7.45~7.42 (m, 1H), 7.27 (d, 1H, $J = 8.8$ Hz), 3.95 (s, 3H), 3.57~3.50 (m, 2H), 2.51 (s, 3H)
CE.I.22.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 7.95$ (s, 1H), 7.67~7.61 (m, 2H), 7.57 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.32 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.20 (d, 1H, $J = 10.4$ Hz), 3.41~3.34 (m, 2H), 2.87 (s, 3H), 2.56 (s, 3H)
CE.I.23.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.07$ ~8.05 (m, 1H), 7.95 (d, 1H, $J = 0.8$ Hz), 7.69~7.61 (m, 2H), 7.34~7.32 (m, 1H), 7.25~7.23 (m, 1H), 3.56~3.45 (m, 2H), 2.87 (s, 3H), 2.48 (s, 3H)
CE.I.24.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.14$ (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.69~7.62 (m, 2H), 7.58 (d, 1H, $J = 7.6$ Hz), 7.21 (d, 1H, $J = 10$ Hz), 3.41~3.34 (m, 2H), 2.56 (s, 3H), 2.52 (s, 3H)
CE.I.25.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.25$ (s, 1H), 8.14 (d, 2H, $J = 7.2$ Hz), 7.74~7.76 (m, 1H), 7.70~7.68 (m, 1H), 7.46~7.43 (m, 1H), 4.06~3.88 (m, 2H), 2.53 (s, 6H)
CE.I.26.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 7.99$ (d, 1H, $J = 0.8$ Hz), 7.67~7.66 (m, 2H), 7.61~7.56 (m, 2H), 7.22 (d, 1H, $J = 10$ Hz), 3.43~3.35 (m, 2H), 2.58 (s, 3H)
CE.I.27.	$\text{CDCl}_3$ : $\delta = 8.07$ (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 7.98 (d, 1H, $J = 0.8$ Hz), 7.70~7.69 (m, 2H), 7.59~7.56 (m, 1H), 7.25~7.23 (m, 1H), 2.49 (s, 3H)
CE.I.28.	3.62 分/ 365.05
CE.I.29.	2.75 分/ 380.90
CE.I.30.	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-d}_6$ ): $\delta$ 8.40 (s, 1 H), 7.94-7.80 (m, 4H), 7.49 (d, $J = 10.5$ Hz, 1H), 4.04 (q, $J_{\text{H-F}} = 10.2$ Hz, 2H), 2.49 (s, 3H)
CE.I.31.	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-d}_6$ ): $\delta$ 8.41 (s, 1 H), 8.13 (d, $J = 7.4$ Hz, 1H), 7.94-7.86 (m, 2H), 7.85-7.79 (m, 1H), 7.58 (d, $J = 10.7$ Hz, 1H), 4.28-4.02 (m, 2H), 2.50 (s, 3H)
CE.I.32.	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ 8.13 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.79 (d, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.65-7.60 (m, 2H), 7.20 (d, $J = 10.1$ Hz, 1H), 3.40 (q, $J_{\text{H-F}} = 9.4$ Hz, 2H), 2.55 (s, 3H)
CE.I.33.	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-d}_6$ ): $\delta$ 8.50 (s, 1 H), 8.16 (d, $J = 7.4$ Hz, 1H), 8.06 (broad s, 1H), 7.94 (broad s, 2H), 7.61 (d, $J = 10.7$ Hz, 1H), 4.33-4.02 (m, 2H), 2.50 (s, 3H).
CE.I.34.	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta = 8.28$ -8.31 (m, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.71-7.78 (m, 2H), 7.48-7.53 (m, 2H), 7.13-7.16 (m, 1H), 3.27-3.34 (m, 2H), 2.50 (s, 3H).
CE.I.35.	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta = 8.34$ -8.36 (m, 1H), 8.08 (d, 1H, $J = 7.2$ Hz), 8.02 (s, 1H), 7.48-7.53 (m, 2H), 7.79-7.87 (m, 2H), 7.56-7.6 (m, 1H), 7.24-7.26 (m, 1H), 3.47-3.55 (m, 2H), 2.49 (s, 3H).

10

20

30

40

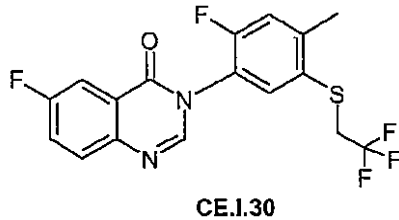
【 0 2 2 8 】

## S. 合成実施例

S.1 6-フルオロ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-2(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

50

## 【化16】



## 【0229】

1.1 3-アセトアミノ-4-フルオロ-6-メチル-フェニルスルホニルクロリド  
2-フルオロ-4-メチル-アニリン(250g、2mol)およびトリエチルアミン(202g、2mol)のジクロロメタン(2L)中溶液に、アセチルクロリド(156g、2mol)を滴加した。反応混合物を0で2時間攪拌し、続いて希塩酸で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して、2-フルオロ-4-メチル-アセトアニリドを粗製中間体(334g、87%)として得た。

10

## 【0230】

粗製2-フルオロ-4-メチル-アセトアニリド(546g、3.27mol)に、70 未満の温度にて攪拌しながらクロロスルホン酸(2000g、17.24mol)を加えた。70 の温度にて3時間攪拌し続けた。反応混合物を氷上に注ぎ、次いで酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して標題化合物(500g、57.8%)を得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  = 9.1 (d, 1H, J = 7.2 Hz), 7.39-7.52 (m, 1H), 7.14 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.72-2.78 (m, 3H), 2.2-2.3 (m, 3H)。

20

## 【0231】

1.2 3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロアニリン  
3-アセトアミノ-4-フルオロ-6-メチル-フェニルスルホニルクロリド(500g、1.89mol)を、酢酸(2L)に溶解させた。赤リン(100g、3.22mmol)およびヨウ素(10g、39mmol)をこの溶液に加え、混合物を3時間還流した。酢酸を減圧下で除去し、水を加え、残留物を酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して5-アセトアミノ-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオールを粗製中間体(270g、72%)として得た。

## 【0232】

粗製5-アセトアミノ-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオール(280g、1.41mol)を、水酸化カリウム(250g、4.46mol)の水中5(重量/重量)%溶液に加え、混合物を5時間還流した。得られた溶液を希塩酸でpH7に調整し、次いで酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して5-アミノ-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオールを粗製中間体(160g、88%)として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  = 7.18 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 6.66-6.74 (m, 2H), 3.2-3.67 (m, 2H), 3.03-3.14 (m, 1H), 2.10-2.15 (m, 3H)。

30

## 【0233】

水酸化カリウム(78.5g、1.4mol)、ヒドロキシメチルスルフィン酸ナトリウム(Rongalite(登録商標)、74.4g、0.63mol)および粗製5-アミノ-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオール(110g、0.7mol)のDMF(380mL)中溶液に、2,2,2-トリフルオロエチルヨージド(147.1g、0.704mol)を滴加した。反応混合物を室温にて2時間攪拌し、水に注ぎ入れ、次いで酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して標題化合物(176g、99%)を得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  = 6.84-6.89 (m, 1H), 6.7-6.78 (m 1H), 3.4-3.7 (m, 3H), 3.14-3.25 (m, 2H), 2.22-2.26 (m, 3H)。

40

## 【0234】

1.3 N-(2-ニトロ-5-フルオロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド  
3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリン(4.0g、16.7mmol)のDMF(100mL)中溶液に、2-ニトロ-5-フルオロ安息香酸(3.09g、16.7mmol)、トリ

50

エチルアミン(2.02g、20mmol)およびHATU(7.6g、20mmol)を加え、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、水(300mL)を加えて反応混合物を酢酸エチルで抽出した(100mLで3回)。有機相を水(100mL)およびブライン(100mL)で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過して減圧下に濃縮した。粗生成物を、酢酸エチル/シクロヘキサンの勾配で溶出するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、標題化合物(5.00g、74%)を黄色固体として得た。

【0235】

1.4 N-(2-アミノ-5-フルオロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド

N-(2-ニトロ-5-フルオロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(5.0g、12.3mmol)のエタノール(87mL)中懸濁液に、ラネーニッケル(1.0g)を加え、攪拌混合物を、室温にて一晩周囲圧力で水素化した。固体を濾別し、濾液を蒸発させて、中間体N-(2-アミノ-5-フルオロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(4.6g、99%)を白色固体として得た。

【0236】

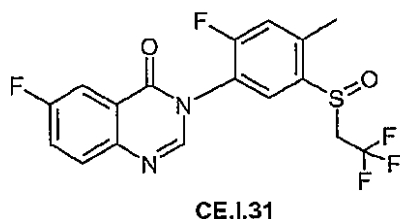
1.5 6-フルオロ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-2(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

N-(2-アミノ-5-フルオロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(4.0g、10.6mmol)、濃硫酸(0.24mL、4.5 mmol)および1,1,1-トリエトキシメタン(23g)の混合物を140 に加熱し、この温度で3時間攪拌した。混合物を室温まで冷却し、過剰の溶媒を減圧下に除去して、粗生成物を酢酸エチル/シクロヘキサンの勾配で溶出するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、標題化合物I-1(1.8g、44%)を白色固体として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 8.40 (s, 1 H), 7.94-7.80 (m, 4H), 7.49 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 4.04 (q, J<sub>H-F</sub> = 10.2 Hz, 2H), 2.49 (s, 3H)。

【0237】

S.2 6-フルオロ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-2(2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

【化17】



【0238】

6-フルオロ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-2(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オンI-1(1.0 g、2.59mmol)のクロロホルム(100mL)中溶液に、0 にて、m-クロロペルオキシ安息香酸(m-CPBA)(0.58g、2.59mmol、純度77%)を加え、反応混合物を0 にて3時間攪拌した。次いで、反応混合物をチオ硫酸ナトリウムの飽和溶液(100mL)および炭酸水素ナトリウムの飽和溶液(100mL)で洗浄した。有機相を分離し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過して減圧下に濃縮した。熱エタノールから再結晶させて標題化合物I-2(0.76g、73%)を白色固体として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 8.41 (s, 1 H), 8.13 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.94-7.86 (m, 2H), 7.85-7.79 (m, 1H), 7.58 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 4.28-4.02 (m, 2H), 2.50 (s, 3H)。

【0239】

S.3 6-トリフルオロメトキシ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-2(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

10

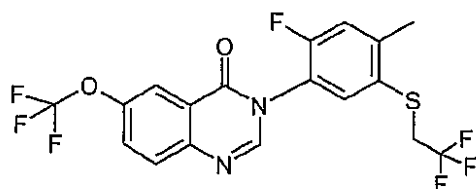
20

30

40

50

## 【化18】



CE.I.32

## 【0240】

10

3.1 N-(2-ニトロ-5-トリフルオロメトキシ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド

3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリン(3.0g、12.5mmol)のDMF(75mL)中溶液に、2-ニトロ-5-トリフルオロメトキシ安息香酸(3.15g、12.5mmol)、トリエチルアミン(1.5g、15mmol)およびHATU(5.7g、15mmol)を加え、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、水(300mL)を加え、反応混合物を酢酸エチルで抽出した(100mLで3回)。有機相を水(100mL)およびブライン(100mL)で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過して減圧下に濃縮した。粗生成物を、酢酸エチル/シクロヘキサンの勾配で溶出するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、標題化合物(4.10g、69%)を黄色固体として得た。

20

## 【0241】

3.2 N-(2-アミノ-5-トリフルオロメトキシ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド

N-(2-ニトロ-5-トリフルオロメトキシ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(4.1g、8.7mmol)のエタノール(61mL)中懸濁液に、ラネーニッケル(1.0g)を加え、攪拌混合物を、室温にて一晩周囲圧力で水素化した。固体を濾別し、濾液を蒸発させて、中間体N-(2-アミノ-5-フルオロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(3.0g、78%)を白色固体として得た。

## 【0242】

30

3.3 6-トリフルオロメトキシ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

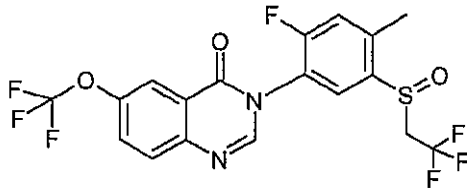
N-(2-アミノ-5-トリフルオロメトキシ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(3.0g、6.8mmol)、濃硫酸(0.15mL、2.8mmol)および1,1,1-トリエトキシメタン(15g)の混合物を140℃に加熱し、この温度で3時間攪拌した。混合物を室温まで冷却し、過剰の溶媒を減圧下に除去し、粗生成物を酢酸エチル/シクロヘキサンの勾配で溶出するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、標題化合物I-3(1.8g、59%)を白色固体として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.13 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.65-7.60 (m, 2H), 7.20 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 3.40 (q, J<sub>H-F</sub> = 9.4 Hz, 2H), 2.55 (s, 3H)。

40

## 【0243】

S.4 6-トリフルオロメトキシ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

## 【化19】



CE.I.33

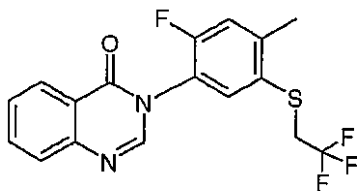
## 【0244】

6-トリフルオロメトキシ-3-[2-フルオロ-4-メチル-5-2(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン 1-3(1.5g、3.32mmol)のクロロホルム(128mL)中溶液に、0 にて、m-クロロペルオキシ安息香酸(m-CPBA)(0.74g、3.32mmol、純度77%)を加え、反応混合物を0 にて3時間攪拌した。次いで、反応混合物をチオ硫酸ナトリウムの飽和溶液(100mL)および炭酸水素ナトリウムの飽和溶液(100 mL)で洗浄した。有機相を分離し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過して減圧下に濃縮した。熱エタノールから再結晶させ、標題化合物1-4(0.4g、26%)を白色固体として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 8.50 (s, 1 H), 8.16 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.06 (broad s, 1H), 7.94 (broad s, 2H), 7.61 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 4.33-4.02 (m, 2H), 2.50 (s, 3H)。

## 【0245】

S.5 2-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-(4-オキソ-キナゾリン-3-イル)-5-フルオロ-トルオール

## 【化20】



CE.I.34

## 【0246】

5.1 3-アセトアミノ-4-フルオロ-6-メチル-フェニルスルホニルクロリド

2-フルオロ-4-メチル-アニリン(250g、2mol)およびトリエチルアミン(202g、2mol)のジクロロメタン(2L)中溶液に、アセチルクロリド(156g、2mol)を滴加した。反応混合物を0 にて2時間攪拌し、続いて希塩酸で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して、2-フルオロ-4-メチル-アセトアニリドを粗製中間体(334g、87%)として得た。

## 【0247】

粗製2-フルオロ-4-メチル-アセトアニリド(546g、3.27mol)に、クロロスルホン酸(2000g、17.24mol)を70 未満の温度で攪拌しながら加えた。70 の温度で3時間攪拌し続けた。反応混合物を氷上に注ぎ、次いで酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して標題化合物(500g、57.8%)を得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 9.1 (d, 1H, J = 7.2 Hz), 7.39-7.52 (m, 1H), 7.14 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.72-2.78 (m, 3H), 2.2-2.3 (m, 3H)。

## 【0248】

5.2 3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリン

3-アセトアミノ-4-フルオロ-6-メチル-フェニルスルホニルクロリド(500g、1.89mol)を、酢酸(2L)に溶解させた。赤リン(100g、3.22mmol)およびヨウ素(10g、39mmol)をこの溶液に加え、混合物を3時間還流した。酢酸を減圧下に除去し、水を加え、残留物を酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して、5-アセトアミノ

-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオールを粗製中間体(270g、72%)として得た。

【0249】

粗製5-アセトアミノ-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオール(280g、1.41mol)を、水酸化カリウム(250g、4.46mol)の水中5(重量/重量)%溶液に加え、混合物を5時間還流した。得られた溶液を希塩酸でpH7に調整し、次いで酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して5-アミノ-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオールを粗製中間体(160g、88%)として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): = 7.18 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 6.66-6.74 (m, 2H), 3.2-3.67 (m, 2H), 3.03-3.14 (m, 1H), 2.10-2.15 (m, 3H)。

【0250】

水酸化カリウム(78.5g、1.4 mol)、ヒドロキシメチルスルフィン酸ナトリウム(Rongalite(登録商標)、74.4g、0.63mol)および粗製5-アミノ-4-フルオロ-2-メチル-ベンゼンチオール(110g、0.7mol)のDMF(380mL)中溶液に、2,2,2-トリフルオロエチルヨージド(147.1g、0.704mol)を滴加した。反応混合物を室温にて2時間攪拌し、水に注ぎ入れ、次いで酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮して標題化合物(176g、99%)を得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): = 6.84-6.89 (m, 1H), 6.7-6.78 (m 1H), 3.4-3.7 (m, 3H), 3.14-3.25 (m, 2H), 2.22-2.26 (m, 3H)。

【0251】

5.3 N-(2-ニトロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド

3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリン(4.0g、16.7mmol)をDMF(100mL)に溶解させた。この溶液に、2-ニトロ安息香酸(2.79g、16.7mmol)およびトリエチルアミン(2.02g、20mmol)を加えた。0℃まで冷却した後、HATU(7.62g、20mmol)を1度に加え、得られた混合物を室温にて一晩攪拌した。反応混合物に水を加え、次いで酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーで精製し、標題化合物(5g、76.9%)を黄色固体として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): = 8.6 (d, 1H, J = 7.6 Hz), 8.2 (d, 1H, J = 8 Hz), 7.73-7.76 (m, 1H), 7.61-7.67 (m, 3H), 7.0 (s, 1H), 3.39-3.46 (m, 2H), 2.45 (s, 3H)。

【0252】

5.4 2-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-(4-オキソ-キナゾリン-3-イル)-5-フルオロ-トルオール

N-(2-ニトロ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(2.3g、5.9mmol)のエタノール(230mL)中懸濁液にラネーニッケル(0.8g)を加え、攪拌混合物を、室温にて一晩周囲圧力で水素化した。固体を濾別し、濾液を蒸発させて、中間体N-(2-アミノ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(2g、95%)を白色固体として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): = 9.79 (s, 1H), 7.75-7.71 (m, 2H), 7.16-7.24 (m, 2H), 6.72 (d, 1H, J = 8.4 Hz), 6.55 (t, 1H, J = 7.4 Hz), 6.44 (s, 2H), 3.79-3.87 (m, 2H), 2.38 (s, 3H)。

【0253】

アミンN-(2-アミノ-ベンゾイル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-メチル-6-フルオロ-アニリド(2.3g、6.4mmol)、濃硫酸(2mL)および1,1,1-トリエトキシメタン(100mL)の混合物を140℃まで加熱し、この温度で5時間攪拌した。この混合物を室温まで冷却し、過剰の溶媒を減圧下に除去し、粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーで精製し、標題化合物(1.4g、59%)をオフホワイトの固体として得た。融点: 145 - 147℃。

【0254】

S.6 2-(2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル)-4-(4-オキソ-キナゾリン-3-イル)-5-フルオロ-トルオール

10

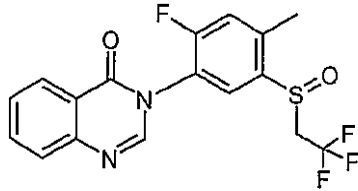
20

30

40

50

## 【化 2 1】



CE.I.35

## 【 0 2 5 5】

2-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-4-(4-オキソ-キナゾリン-3-イル)-5-フルオロ-トルオール(0.80g、1.96 mmol)をクロロホルム(20mL)中で溶解し、メタ-クロロペルオキシ安息香酸(0.466g、2.29mmol、純度85%)を氷冷下で加えた。反応混合物を氷浴温度にて1時間攪拌した。この溶液を、チオ硫酸ナトリウム水溶液と炭酸水素ナトリウム水溶液で連続的に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。過剰の溶媒を減圧下に除去した後、粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーで精製し、標題化合物(0.32g、42.9%)をオフホワイトの固体として得た。融点：184 - 186 。

10

## 【 0 2 5 6】

## B. 生物学

相乗作用は、二種以上の化合物の複合効果が各々の化合物の個別の効果を足し合わせたものよりも高くなる相互作用であると説明できる。二種類の混合パートナー(XとY)の間の防除率に関する相乗効果の存在は、Colby式(Colby, S. R., 1967, Calculating Synergistic and Antagonistic Responses in Herbicide Combinations, Weeds, 15, 20-22)を用いて計算可能である。

20

## 【数 1】

$$E = X + Y - \frac{XY}{100}$$

## 【 0 2 5 7】

認められる複合的な防除効果が予期される複合的な防除効果(E)よりも大きい場合、その複合効果は相乗的である。

30

## 【 0 2 5 8】

混合物または組成物同士の相乗作用または拮抗作用の分析が、Colbyの式を用いて判定された。

## 【 0 2 5 9】

## B.1 動物有害生物に対する殺有害生物活性

以下の試験が特定の有害生物に対する本発明の化合物、混合物または組成物の防除有効性を実証することができる。しかし、化合物、混合物または組成物によってもたらされる有害生物防除保護は、これらの種に限られない。場合によっては、本発明の化合物と他の無脊椎有害生物防除化合物または薬剤との組合せがある種の重要な無脊椎有害生物に対する相乗効果を呈することがわかっている。

40

## 【 0 2 6 0】

## 殺虫試験例B.1.1:

例えば、接触または浸透移行手段によるソラマメヒゲナガアブラムシ(Megoura viciae)の防除を評価するため、試験ユニットは、ソラマメのリーフディスクを入れた24ウェルのマイクロタイタープレートで構成される。

## 【 0 2 6 1】

化合物または混合物は、水を75%とDMSOを25%含有する溶液を使用して調合する。二度の反復試験において、様々な濃度に調合された化合物または混合物2.5 μlを、特注の微小噴霧器を使用してリーフディスクに噴霧する。

## 【 0 2 6 2】

50



これらの試験における実験用混合物の場合、それぞれが所望の濃度である同一体積の混合パートナー同士を混合する。

【0263】

施用後、リーフディスクを空気乾燥し、マイクロタイタープレートのウェル内のリーフディスク上にアブラムシ成虫を5~8匹置く。そして、アブラムシに処理したリーフディスクを吸汁させ、約 $23 \pm 1$  および約 $50 \pm 5\%RH$ (相対湿度)にて5日間培養する。アブラムシの致死率および繁殖率を目視判定する。

【0264】

殺虫試験例B.1.2:

例えば、接触または浸透移行手段によるムギクビレアブラムシ(ロパロシフム・パジ(*Rhopalosiphum padi*))の防除を評価するため、試験ユニットは、オオムギのリーフディスクを入れた96ウェルのマイクロタイタープレートで構成される。

10

【0265】

化合物または混合物は、水を75%とDMSOを25%含有する溶液を使用して調合する。二度の反復試験において、様々な濃度に調合された化合物または混合物 $2.5 \mu l$ を、特注の微小噴霧器を使用してリーフディスクに噴霧する。

【0266】

これらの試験における実験用混合物の場合、それぞれが所望の濃度である同一体積の混合パートナー同士を混合する。

【0267】

20

施用後、リーフディスクを空気乾燥し、マイクロタイタープレートのウェル内のリーフディスク上にアブラムシ成虫を5~8匹置く。そして、アブラムシに処理したリーフディスクを吸汁させ、約 $25 \pm 1$  および約 $80 \pm 5\%RH$ にて3から5日間培養する。アブラムシの致死率および繁殖率を目視判定する。

【0268】

殺虫試験例B.1.3:

例えば、浸透移行手段によるモモアカアブラムシ(ミズス・ペルシカエ(*Myzus persicae*))の防除を評価するため、試験ユニットは、人工膜下に液体人工食餌を入れた96ウェルのマイクロタイタープレートで構成される。

【0269】

30

化合物または混合物は、水を75%とDMSOを25%含有する溶液を使用して調合する。二度の反復試験において、様々な濃度に調合された化合物または混合物を、特注のピペッターを使用してアブラムシの食餌に注入する。

【0270】

これらの試験における実験用混合物の場合、それぞれが所望の濃度である同一体積の混合パートナー同士を混合する。

【0271】

施用後、マイクロタイタープレートのウェル内の人工膜上にアブラムシ成虫を5~8匹置く。そして、アブラムシに処理したアブラムシ食餌を吸汁させ、約 $23 \pm 1$  および約 $50 \pm 5\%RH$ にて3日間培養する。アブラムシの致死率および繁殖率を目視判定する。

40

【0272】

殺虫試験例B.1.4:

例えば、ワタミハナゾウムシ(アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*))の防除を評価するため、試験ユニットは、昆虫食餌とアントノムス・グランジスの卵20~30個を入れた24ウェルのマイクロタイタープレートで構成される。

【0273】

化合物または混合物は、水を75%とDMSOを25%含有する溶液を使用して調合する。二度の反復試験において、様々な濃度に調合された化合物または混合物 $20 \mu l$ を、特注の微小噴霧器を使用して昆虫食餌に噴霧する。

【0274】

50

これらの試験における実験用混合物の場合、それぞれが所望の濃度である同一体積の混合パートナー同士を混合する。

【0275】

施用後、マイクロタイタープレートを約 $23 \pm 1$  および約 $50 \pm 5\%RH$ にて5日間培養する。卵および幼虫の致死率を目視判定する。

【0276】

#### 殺虫試験例B.1.5:

例えば、チチュウカイミバエ(セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*))の防除を評価するため、試験ユニットは、昆虫食餌とセラチチス・カピタタの卵50~80個を入れた96ウェルのマイクロタイタープレートで構成される。

10

【0277】

化合物または混合物は、水を75%とDMSOを25%含有する溶液を使用して調合する。二度の反復試験において、様々な濃度に調合された化合物または混合物5 $\mu$ lを、特注の微小噴霧器を使用して昆虫食餌に噴霧する。

【0278】

これらの試験における実験用混合物の場合、それぞれが所望の濃度である同一体積の混合パートナー同士を混合する。

【0279】

施用後、マイクロタイタープレートを約 $28 \pm 1$  および約 $80 \pm 5\%RH$ にて5日間培養する。そして、卵および幼虫の致死率を目視判定する。

20

【0280】

#### 殺虫試験例B.1.6:

例えば、ニセアメリカタバコガ(ヘリオチス・ビレセンス(*Heliothis virescens*))の防除を評価するため、試験ユニットは、昆虫食餌とヘリオチス・ビレセンスの卵15~25個を入れた96ウェルのマイクロタイタープレートで構成される。

【0281】

化合物または混合物は、水を75%とDMSOを25%含有する溶液を使用して調合する。二度の反復試験において、様々な濃度に調合された化合物または混合物10 $\mu$ lを、特注の微小噴霧器を使用して昆虫食餌に噴霧する。

【0282】

これらの試験における実験用混合物の場合、それぞれが所望の濃度である同一体積の混合パートナー同士を混合する。

30

【0283】

施用後、マイクロタイタープレートを約 $28 \pm 1$  および約 $80 \pm 5\%RH$ にて5日間培養する。卵および幼虫の致死率を目視判定する。

【0284】

#### B.2 菌類に対する殺有害生物作用

以下の実験による式Iの化合物の混合物の殺菌作用:

本発明の化合物、混合物または組成物の特定の菌類に対する殺菌作用を実証し評価するために以下の試験を用いることができる。しかし、化合物、混合物または組成物によってもたらされる殺菌防除保護は、これらの菌類に限られない。場合によっては、本発明の化合物と他の殺菌化合物または薬剤との組合せがある種の重要な菌類に対する相乗効果を呈することがわかっている。

40

【0285】

#### B.2. 殺菌試験

特に明記されない限り、活性物質はジメチルスルホキシド(DMSO)中10000ppm濃度原液として別々に調合される。

【0286】

測定されたパラメータを、活性化合物を含まない対照値(100%)、および菌類を含まずかつ活性化合物を含まないブランクの値の増加率と比較し、それぞれの活性化合物における

50

病原菌の相対増殖度を%で判定した。パーセンテージを有効性に換算した。

【0287】

活性化化合物の混合物の予想される有効性は、Colbyの式[R.S. Colby, "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds 15, 20-22 (1967)]を用いて判定し、観察された有効性と比較した。

【0288】

殺菌試験例B.2.1:

レプトスパエリア・ノドルム(Leptosphaeria nodorum)(Leptno)によって引き起こされるコムギ斑点病に対する活性

原液を比率に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで移し、定められた濃度まで水で希釈した。次いで、水性バイオモルトまたは酵母-バクトペプトン-グリセリン溶液に懸濁させたレプトスパエリア・ノドルムの孢子懸濁液を添加した。プレートを温度18℃の水蒸気飽和チャンパーに入れた。植菌後7日目に吸光光度計を用いて405nmでMTPを測定した。

【表5】

活性化化合物/ 活性混合物	濃度 (ppm)	混合物	観察された 有効性	Colbyに従って 計算された 有効性 (%)	相乗作用 (%)
CE.I.31	63	-	19	57	
プロピネブ	4	-	57		
CE.I.31 プロピネブ	63 4	16:1	94	65	29

【0289】

殺菌試験例B.2.2:

マイクロタイタープレート試験におけるピリクラリア・オリザエ(Pyrior)によるイネイモチ病に対する活性

原液を所望の比率に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで移し、定められた濃度まで水で希釈した。次いで、水性バイオモルトまたは酵母-バクトペプトン-グリセリン溶液に懸濁させたピリクラリア・オリザエの孢子懸濁液を添加した。プレートを温度18℃の水蒸気飽和チャンパーに入れた。植菌後7日目に吸光光度計を用いて405nmでMTPを測定した。

【0290】

結果:

10

20

30

【表 6】

活性混合物中の 活性化化合物 (複数可)の比	濃度 [ppm]	混合物中の 化合物Iと 化合物IIとの比	観察された 有効性	Colbyに従って 計算された 有効性 (%)	相乗作用(%)
CE.I.31	63 4 1	- - -	16 11 8		
トリフロキシ ストロビン	0.016	-	26		
ピコキシストロビン	0.016	-	19		
ピラクロストロビン	0.004	-	32		
ボスカリド	16	-	8		
カルベンダジム	0.25	-	19		
シアゾファミド	1	-	10		
クロロタロニル	0.25	-	30		
CE.I.31 トリフロキシ ストロビン	4 0.016	250 : 1	60	34	26
CE.I.31 ピコキシストロビン	1 0.016	63 : 1	44	26	18
CE.I.31 ピラクロストロビン	1 0.004	250 : 1	59	38	21
CE.I.31 ボスカリド	63 16	4 : 1	67	22	45
CE.I.31 カルベンダジム	4 0.25	16 : 1	52	29	23
CE.I.31 シアゾファミド	63 1	63 : 1	54	25	29
CE.I.31 クロロタロニル	4 0.25	16 : 1	100	38	62

10

20

30

## 【 0 2 9 1 】

## 殺菌試験例B.2.3:

## セプトリア・トリチシ(Septtr)によって引き起こされるコムギの枯葉病に対する活性

原液を比率に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで移し、定められた濃度まで水で希釈した。次いで、水性バイオモルトまたは酵母-バクトペプトン-グリセリン溶液に懸濁させたセプトリア・トリチシの孢子懸濁液を添加した。プレートを温度18 の水蒸気飽和チャンパーに入れた。植菌後7日目に吸光光度計を用いて405nmでMTPを測定した。

【表 7】

活性混合物中の 活性化合物 (複数可)の比	濃度 [ppm]	混合物中の 化合物Iと 化合物IIとの比	観察された 有効性	Colbyに従って 計算された 有効性 (%)	相乗作用(%)
CE.I.31	63	-	19		
フルオキサストロビン	0.25	-	58		
フルキサピロキサド	0.063	-	58		
CE.I.31 フルオキサストロビン	63 0.25	250 : 1	97	66	31
CE.I.31 フルキサピロキサド	63 0.063	1000 : 1	90	66	24

10

## 【0292】

本発明による混合物の殺菌活性を評価可能な更なる生物試験を以下に記載する。

## 【0293】

## 殺菌試験例B.2.4:

マイクロタイタープレート試験における灰色カビ病菌ボトリチス・シネレア(Botrci)に対する活性

20

原液を比率に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで移し、定められた濃度まで水で希釈する。次いで、水性バイオモルト溶液に懸濁させたボトリチス・シネレアの孢子懸濁液を添加する。プレートを温度18 の水蒸気飽和チャンバーに入れる。植菌後7日目に吸光光度計を用いて405nmでMTPを測定する。

## 【0294】

## 殺菌試験例B.2.5:

マイクロタイタープレート試験における夏疫病アルテルナリア・ソラニ(Alteso)に対する活性

30

原液を比率に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで移し、定められた濃度まで水で希釈する。次いで、水性バイオモルト溶液に懸濁させたアルテルナリア・ソラニの孢子懸濁液を添加する。プレートを温度18 の水蒸気飽和チャンバーに入れる。植菌後7日目に吸光光度計を用いて405nmでMTPを測定する。

## 【0295】

## 殺菌試験例B.2.6:

マイクロタイタープレート試験におけるセプトリア・グリシネス(Septoria glycines)(Septgl)に対する活性

40

原液を比率に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで移し、定められた濃度まで水で希釈する。次いで、水性バイオモルト溶液に懸濁させたセプトリア・グリシネスの孢子懸濁液を添加する。プレートを温度18 の水蒸気飽和チャンバーに入れる。植菌後7日目に吸光光度計を用いて405nmでMTPを測定する。

## 【0296】

## 殺菌試験例B.2.7:

マイクロタイタープレート試験におけるコレトトリクム・トルンカツム(Colletotrichum truncatum)(Colltr)に対する活性

原液を比率に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで移し、定められた濃度まで水で希釈する。次いで、水性バイオモルト溶液に懸濁させたコレトトリクム・トルンカツムの孢子懸濁液を添加する。プレートを温度18 の水蒸気飽和チャンバーに入れる。植菌後7日目に吸光光度計を用いて405nmでMTPを測定する。

## 【0297】

50

殺菌試験例B.2.8:コクリオボルス・ミヤベアヌスによって引き起こされる褐点病の殺菌防除(保護的施用)

鉢植えのイネ苗の葉に、原液から調製した一定濃度の活性成分を含有する水性の懸濁液をしたたり落ちるまで噴霧した。植物を空気乾燥させた。翌日、植物にコクリオボルス・ミヤベアヌスの水性孢子懸濁液を植菌した。次いで試験植物をすぐに多湿チャンバーに移した。22~24 および100%に近い相対湿度で6日間置いた後、葉に対する菌類の攻撃の程度を、病変の葉面積の%として目視により評価した。

## 【0298】

更に、ここでは、殺菌試験の測定されたパラメータを活性化化合物を含まない対照値(100%)、および菌類を含まずかつ活性化化合物を含まないブランクの値の増加率と比較し、それぞれの活性化化合物における病原菌の相対増殖度を%で判定する。パーセンテージを有効性に換算される。有効性が0とは、病原菌の繁殖レベルが非処理対照群の繁殖レベルと一致することを意味し、有効性が100とは、病原菌が繁殖しないことを意味する。

10

## 【0299】

上記に説明したように、活性化化合物の混合物の予想される有効性は、Colbyの式[R.S. Colby, "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds 15, 20-22 (1967)]を用いて判定し、観察された有効性と比較される。

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2012/066963
---

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> INV. A01N43/72    A01N43/40    A01N43/50    A01N47/18    A01N43/54 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2010/100189 A1 (BASF SE [DE]; GROSS STEFFEN [DE]; KOERBER KARSTEN [DE]; DEYN WOLFGANG) 10 September 2010 (2010-09-10) page 5, line 26 - line 37; claims; tables A-C page 49, line 6 - line 29 page 51, line 1 - line 13 page 56, line 30 - line 36 page 63, line 1 - page 67, line 36 page 69, line 1 - line 34 page 80, line 24 - page 82, line 2 -----	1-32
A	US 3 907 995 A (YABUTANI KUNIHIRO ET AL) 23 September 1975 (1975-09-23) claims; examples -----	1-32
A	US 3 755 581 A (JANIAK S) 28 August 1973 (1973-08-28) claims; examples -----	1-32
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search  25 October 2013		Date of mailing of the international search report  06/11/2013
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  Butkowskyj-Walkiw, T

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2012/066963

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2010100189	A1	10-09-2010	
		AR 075717 A1	20-04-2011
		AU 2010220293 A1	22-09-2011
		CA 2751836 A1	10-09-2010
		CN 102341376 A	01-02-2012
		CR 20110458 A	21-09-2011
		EP 2403837 A1	11-01-2012
		JP 2012519662 A	30-08-2012
		KR 20110123790 A	15-11-2011
		TW 201034573 A	01-10-2010
		US 2012053052 A1	01-03-2012
		UY 32471 A	31-08-2010
		WO 2010100189 A1	10-09-2010
-----			
US 3907995	A	23-09-1975	NONE
-----			
US 3755581	A	28-08-1973	
		AT 290202 B	25-05-1971
		BE 728973 A	26-08-1969
		CH 490801 A	31-05-1970
		DE 1908097 A1	11-09-1969
		DK 125304 B	05-02-1973
		FR 2002672 A1	31-10-1969
		GB 1245537 A	08-09-1971
		IE 32653 B1	17-10-1973
		IT 955011 B	29-09-1973
		NL 6903002 A	29-08-1969
		US 3755581 A	28-08-1973
-----			



## フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 0 1 N 47/24 (2006.01)	A 0 1 N 47/24	G
A 0 1 N 47/18 (2006.01)	A 0 1 N 47/18	1 0 1 C
A 0 1 N 43/50 (2006.01)	A 0 1 N 43/50	M
A 0 1 N 37/34 (2006.01)	A 0 1 N 37/34	1 0 4
A 0 1 N 43/88 (2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 1 D
A 0 1 N 43/56 (2006.01)	A 0 1 N 43/88	
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	A 0 1 N 43/56	C
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	
	A 0 1 P 7/04	

(81) 指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, T M), 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, R S, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, 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, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, H U, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI , NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN

(74) 代理人 100111741

弁理士 田中 夏夫

(74) 代理人 100169971

弁理士 菊田 尚子

(74) 代理人 100180932

弁理士 和田 洋子

(72) 発明者 カイザー, フローリアン

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, シュベルツェンシュトラーセ 9

(72) 発明者 グロス, シュテッフエン

ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 7 ルートヴィヒスハーフェン, マリー-ユハッチ アレー 2 0 1

(72) 発明者 ハーデン, エゴン

ドイツ連邦共和国 6 7 3 4 6 シュパイヤー, マウルブロンナー ホーフ 2 4

(72) 発明者 ナリー, アラン

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 1 マンハイム, 1 2 - 1 3, キュー 3

F ターム(参考) 4H011 AA01 AC01 AC04 BA01 BA06 BB06 BB09 BB10 BB13 BB16

BC07 DA13 DA15 DC05 DD03 DD04 DE15 DF04

## 【要約の続き】

保護し、特に種子も保護する方法、およびその使用に関する。

【選択図】なし