

(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2020-510670

(P2020-510670A)

(43) 公表日 令和2年4月9日(2020.4.9)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
CO7D 413/04 (2006.01)	CO7D 413/04 CSP	4CO63
CO7D 413/14 (2006.01)	CO7D 413/14	4CO65
CO7D 417/06 (2006.01)	CO7D 417/06	4HO11
CO7D 471/04 (2006.01)	CO7D 471/04 1O2	
AO1P 3/00 (2006.01)	AO1P 3/00	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 140 頁) 最終頁に続く

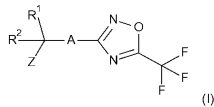
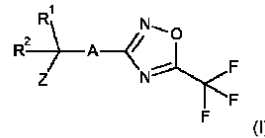
(21) 出願番号 特願2019-547632 (P2019-547632)	(71) 出願人 519295993 シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー スイス 4058 バーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 67
(86) (22) 出願日 平成30年3月1日 (2018.3.1)	
(85) 翻訳文提出日 令和1年11月5日 (2019.11.5)	
(86) 国際出願番号 PCT/EP2018/055042	
(87) 国際公開番号 W02018/158365	
(87) 国際公開日 平成30年9月7日 (2018.9.7)	(74) 代理人 100094569 弁理士 田中 伸一郎
(31) 優先権主張番号 201711043196	(74) 代理人 100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(32) 優先日 平成29年12月1日 (2017.12.1)	(74) 代理人 100109070 弁理士 須田 洋之
(33) 優先権主張国・地域又は機関 インド (IN)	(74) 代理人 100119013 弁理士 山崎 一夫
(31) 優先権主張番号 17159202.5	(74) 代理人 100123777 弁理士 市川 さつき
(32) 優先日 平成29年3月3日 (2017.3.3)	
(33) 優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁 (EP)	

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺微生物オキサジアゾール誘導体

(57) 【要約】

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

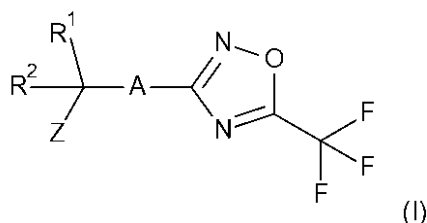


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】

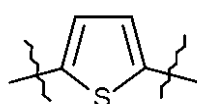


10

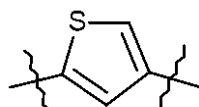
(式中、

A は、A - 1、A - 2 又は A - 3 から選択され；

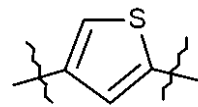
【化 2】



(A-1)



(A-2)



(A-3)

20

R^1 及び R^2 は独立して、水素、メチル、エチル、フルオロ、シアノ、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し；及び

Z は、 Z^1 、 Z^2 又は Z^3 から選択され；ここで、

Z^1 は、1 個の環窒素を含有する 4 ~ 6 員非芳香族ヘテロシクリル環を表し、ここで、前記ヘテロシクリルは、N、O、S、C(O) 及び S(O)₂ から独立して選択される、1 若しくは 2 個の追加の環員を任意選択により含み、但し、前記ヘテロシクリル環は、O 及び S から選択される 2 個の隣接原子を含有することができず、又は前記ヘテロシクリルは、1 個の追加の環員 N R^3 を任意選択により含み、ここで、前記ヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、 R^4 から選択される、1 若しくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、前記ヘテロシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合しており；

30

R^3 は、水素、ヒドロキシ、アミノ、ホルミル、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 C_{1-3} アルキルカルボニル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル、N - C_{1-3} アルキルアミノカルボニル、N, N - ジ C_{1-3} アルキルアミノカルボニル、N - C_{1-3} アルコキシアミノカルボニル、N - C_{1-3} アルキル - N - C_{1-3} アルコキシ - アミノカルボニル、 C_{1-2} アルキルスルホニル、N - C_{1-2} アルキルアミノスルホニル、N, N - ジ C_{1-2} アルキルアミノスルホニル、 C_{1-2} アルキルジカルボニル、 C_{1-2} アルコキシジカルボニル、N - C_{1-2} アルキルアミノジカルボニル若しくは N, N - ジ C_{1-2} アルキルアミノジカルボニルを表し；

R^4 は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N - メチルアミノ又は N, N - ジメチルアミノを表し；

40

Z^2 は、1 個の環窒素を含有する 5 若しくは 6 員ヘテロアリアル環を表し、ここで、前記ヘテロアリアルは、O、S、若しくは N から独立して選択される 1、2 若しくは 3 個の追加の環員を任意選択により含み、並びに、ここで、前記ヘテロアリアルは、 R^5 から選択される 1 若しくは 2 個の置換基、 R^6 から選択される 1 個の置換基、又は R^5 から選択される 1 個の置換基及び R^6 から選択される 1 個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、前記ヘテロアリアルは、環窒素によって前記分子の残部に結合しており；

R^5 は、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_3 .

50

C_4 アルキニルオキシ、シアノ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} ハロアルキル、ヒドロキシ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、 N 、 N -ジメチルアミノ、 C_{1-3} アルコキシカルボニル C_{1-2} アルキル、 C_{1-3} アルキルカルボニルオキシ C_{1-2} アルキル、 N - C_{1-3} アルキルアミノカルボニル C_{1-2} アルキル、 N 、 N -ジ C_{1-3} アルキルアミノカルボニル C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルホニル、 C_{1-3} アルキルカルボニル、 C_{1-3} アルキルジカルボニル、 C_{1-3} アルコキシジカルボニル、 N - C_{1-3} アルキルアミノジカルボニル、若しくは N 、 N -ジ C_{1-3} アルキルアミノジカルボニルを表すか；又は

R^5 は $-C(O)N(R^a)(R^b)$ を表し、ここで：

R^a は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{3-4} ハロアルケニル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-3} アルキル、 C_{2-3} ハロアルコキシ、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-4} アルキニルオキシ、 N - C_{1-3} アルキルアミノ、若しくは N 、 N -ジ C_{1-2} アルキルアミノを表すか；又は

R^a は、 C_{3-5} シクロアルキル、 C_{3-5} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-2} アルキル、ヘテロシクリルを表し、ここで、前記ヘテロシクリル部分は、 N 、 O 若しくは S から独立して選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環であり、但し、前記ヘテロシクリルは、 O 及び S から選択される2個の隣接原子、ヘテロアリアル若しくはヘテロアリアル C_{1-2} アルキルを含有することができず、ここで、前記ヘテロアリアル部分は、 N 、 O 及び S から個別に選択される1、2、3、若しくは4個のヘテロ原子を含む5若しくは6員芳香族環であり；ここで、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクリル若しくはヘテロアリアルは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、アシル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、若しくは N 、 N -ジメチルアミノから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、 R^a がシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、 $C(O)$ 若しくは $S(O)_2$ から選択される1個の基を任意選択により含有し；並びに

R^b は、水素、メチル、エチル、プロピル、プロパ-2-エニル、プロパ-2-イニル、シクロプロピル、若しくはシクロプロピルメチルを表すか；又は

R^a 及び R^b は、それらが共有している窒素原子と一緒に、ハロゲン、メチル、エチル若しくはメトキシから選択される1若しくは2個の基によって任意選択により置換されているアゼチジニル、ピロリジニル、イソオキサゾリジニル、モルホリノ、ピペラジン-4-イル、若しくはピペリジニル環を形成するか；又は

R^5 は、 $-C(O)O-R^c$ を表し、ここで：

R^c は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} アルケニル、 C_{3-5} アルキニル、 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{3-4} ハロアルケニル、 N 、 N -ジ C_{1-3} アルキルアミノ C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-4} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、フェニル、ヘテロシクリルを表し、ここで、前記ヘテロシクリル部分は、 O 、 S 及び N から独立して選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4~6員非芳香族環であり、但し、前記ヘテロシクリルは、 O 及び S から選択される2個の隣接原子、ヘテロアリアルを含有することができず、ここで、前記ヘテロアリアル部分は、 N 、 O 及び S から個別に選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員芳香族環であり；並びに、ここで、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクリル若しくはヘテロアリアルは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、メチルカルボニル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、若しくは N 、 N -ジメチルアミノから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、 R^c がシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、 $C(O)$ 若しくは $S(O)_2$ から選択される1個の基を任意選択により含有するか；又は

R^5 は、 $-N(R^d)(R^e)$ 若しくは $-C_{1-2}$ アルキル- $N(R^d)(R^e)$ を表し、ここで、

R^d は、 C_{1-3} アルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、メチルカルボニル、メト

10

20

30

40

50

キシカルボニル、N - メチルアミノカルボニル、N , N - ジメチルアミノカルボニル、N - メトキシアミノカルボニル、N - メチル - N - メトキシ - アミノカルボニル、メチルスルホニル、N - メチルアミノスルホニル、N , N - ジメチルアミノスルホニル、メチルジカルボニル、N - メチルアミノジカルボニル、若しくはN , N - ジメチルアミノジカルボニルを表し；及び

R^eは、水素、メチル、エチル、若しくはプロピルを表すか；又は

R^d及びR^eは、それらが共有している窒素原子と一緒にあって、ハロゲン、メチル、エチル若しくはメトキシから選択される1若しくは2個基によって任意選択により置換されているアゼチジニル、ピロリジニル、イソオキサゾリジニル、モルホリノ、ピペラジン - 4 - イル、若しくはピペリジニル環を形成するか；又は

R⁵は - CH = N (R^f) を表し、ここで、R^fは、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケノキシ、若しくはC₂₋₄アルキノキシを表し；

R⁶は、C₃₋₆シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルを表し、ここで、前記ヘテロアリアル部分は、N、O及びSから個別に選択される1、2、3、若しくは4個のヘテロ原子、ヘテロシクリルを含む5若しくは6員芳香族環であり；ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、O及びSから個別に選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4 ~ 6員非芳香族環であり、並びに、ここで、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、アシル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N , N - ジメチルアミノから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、R⁶がシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、C (O) 若しくはS (O)₂から選択される1個の基を任意選択により含有し；

並びに

Z³は、1個の窒素を含有する7 ~ 9員の飽和の、部分飽和の、若しくは芳香族の縮合環又は飽和のスピロ環式環系であるヘテロビシクリルを表し、ここで、前記ヘテロビシクリルは、N、O、S、C (O) 及びS (O)₂から独立して選択される1若しくは2個の追加の環員を任意選択により含み、但し、前記ヘテロビシクリルは、O及びSから選択される2個の隣接原子を含有することができず、ここで、前記ヘテロビシクリルは、R⁷から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、前記ヘテロビシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合しており；並びに

R⁷は、シアノ、フルオロ、クロロ、アミノ、ヒドロキシ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N , N - ジメチルアミノ、ホルミル、メチルカルボニル、メトキシカルボニル、N - メチルアミノカルボニル、又はN , N - ジメチルアミノカルボニルである)

又はその塩若しくはN - オキシド。

【請求項2】

AがA - 1である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹及びR²が水素である、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

Zが、

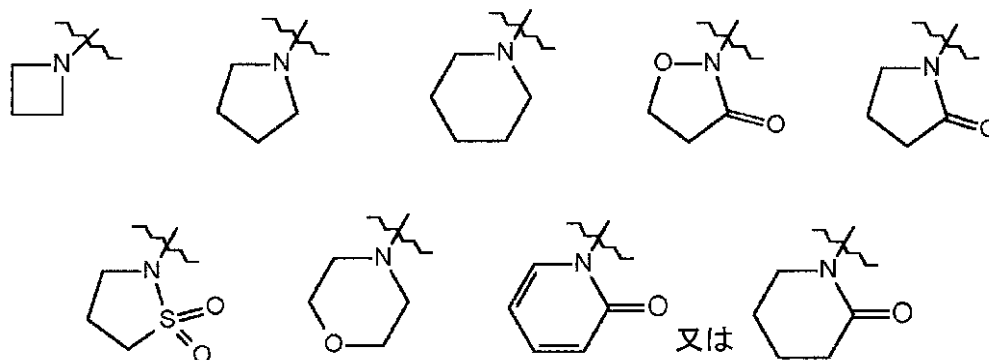
10

20

30

40

【化 3】



10

から選択される Z^1 であり、

ここで、 Z^1 が、同一であっても異なってもよい、 R^4 から選択される、1 若しくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されている、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

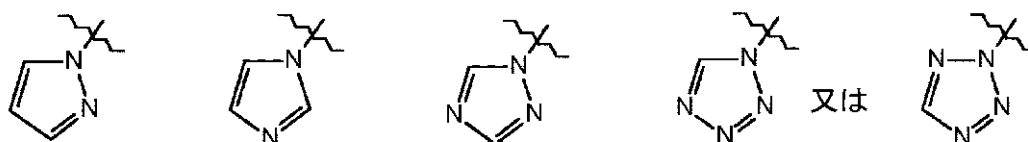
R^4 がメチル又はエチルから選択される、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

Z が、

20

【化 4】



から選択される Z^2 であり、

ここで、 Z^2 が、 R^5 から選択される 1 若しくは 2 個の置換基、 R^6 から選択される 1 個の置換基、又は R^5 から選択される 1 個の置換基及び R^6 から選択される 1 個の置換基によって任意選択により置換されている、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

30

【請求項 7】

R^5 が、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-2} ハロアルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、 N, N -ジメチルアミノ、 $-C(O)O-R^c$ (ここで、 R^c は C_{1-4} アルキルである) 及び $C(O)N(R^a)(R^b)$ (ここで、 R^a は、水素、 C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシから選択され、 R^b は、水素又はメチルから選択される) から独立して選択され；及び

R^6 が、同一であっても異なってもよい、ヒドロシル、メチル、メトキシ、シアノ、フルオロ、クロロ若しくはプロモから選択される、1 若しくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されているフェニルである、請求項 6 に記載の化合物。

40

【請求項 8】

R^5 が、アミノ、シアノ、クロロ、フルオロ、ホルミル、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、メトキシメチル、 N, N -ジメチルアミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル又は n -プロポキシカルボニルから選択され；及び

R^6 が、同一であっても異なってもよい、フルオロ、クロロ若しくはプロモから選択される、1 若しくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されているフェニルである、請求項 7 に記載の化合物。

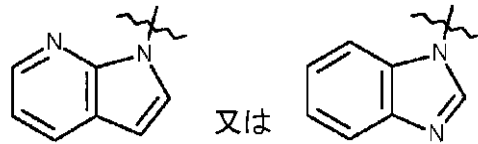
【請求項 9】

Z^2 が、 R^5 から選択される 1 若しくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されている、請求項 6 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

50

Zが、
【化5】



から選択される Z^3 であり、

ここで、 Z^3 が、 R^7 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項11】

R^7 が、ヒドロキシル、メトキシ、メチル、シアノ、フルオロ又はクロロから選択される、請求項10に記載の化合物。

【請求項12】

殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項1～11のいずれか一項に記載の式(I)の化合物を含む農芸化学組成物。

【請求項13】

少なくとも1種の追加の有効成分及び/又は農芸化学的に許容可能な希釈剤又はキャリアをさらに含む、請求項12に記載の組成物。

20

【請求項14】

植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除又は予防する方法であって、殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項1～11のいずれか一項に記載の式(I)の化合物、又は有効成分としてこの化合物を含む組成物が、前記植物、その一部又はその生息地に適用される方法。

【請求項15】

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

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

30

本発明は、例えば、特に殺菌・殺カビ活性といった殺微生物活性を有する有効成分としての殺微生物オキサジアゾール誘導体に関する。本発明はまた、少なくとも1種のオキサジアゾール誘導体を含む農芸化学組成物、これらの化合物の調製プロセス、及び、農業又は園芸における、植物、収穫された食品作物、種子又は非生体材料に対する特に真菌といった植物病原性微生物による外寄生を防除若しくは予防するためのオキサジアゾール誘導体又は組成物の使用に関する。

【背景技術】

【0002】

国際公開第2015/185485号には、植物病原性真菌を駆除するための置換オキサジアゾールの使用が記載されている。

40

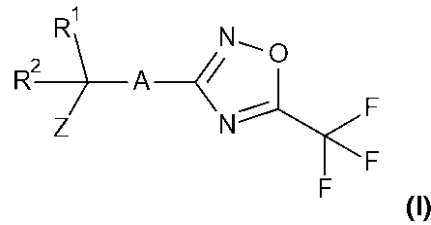
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明によれば、式(I)の化合物：

【化1】

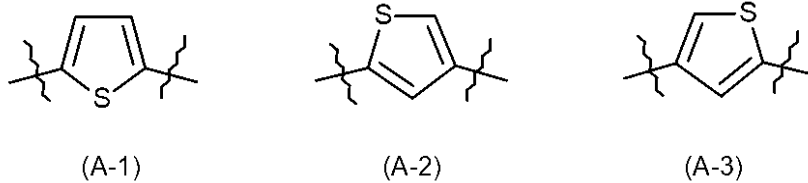


(式中、

Aは、A - 1、A - 2又はA - 3から選択され；

10

【化2】



R^1 及び R^2 は独立して、水素、メチル、エチル、フルオロ、シアノ、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し；及び

Zは、 Z^1 、 Z^2 又は Z^3 から選択され；ここで、

20

Z^1 は、1個の環窒素を含有する4～6員非芳香族ヘテロシクリル環を表し、ここで、ヘテロシクリルは、N、O、S、C(O)及びS(O)₂から独立して選択される1若しくは2個の追加の環員を任意選択により含み、但し、ヘテロシクリル環は、O及びSから選択される2個の隣接原子を含有することができず、又はヘテロシクリル環は、1個の追加の環員NR³を任意選択により含み、ここで、ヘテロシクリル環は、同一であっても異なってもよい、 R^4 から選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロシクリル環は、環窒素によって分子の残部に結合しており；

R^3 は、水素、ヒドロキシ、アミノ、ホルミル、C₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルコキシ、C₁₋₃アルキルカルボニル、C₁₋₃アルコキシカルボニル、N - C₁₋₃アルキルアミノカルボニル、N, N - ジC₁₋₃アルキルアミノカルボニル、N - C₁₋₃アルコキシアミノカルボニル、N - C₁₋₃アルキル - N - C₁₋₃アルコキシ - アミノカルボニル、C₁₋₂アルキルスルホニル、N - C₁₋₂アルキルアミノスルホニル、N, N - ジC₁₋₂アルキルアミノスルホニル、C₁₋₂アルキルジカルボニル、C₁₋₂アルコキシジカルボニル、N - C₁₋₂アルキルアミノジカルボニル若しくはN, N - ジC₁₋₂アルキルアミノジカルボニルを表し；

30

R^4 は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N - メチルアミノ又はN, N - ジメチルアミノを表し；

Z^2 は、1個の環窒素を含有する5若しくは6員ヘテロアリール環を表し、ここで、ヘテロアリールは、O、S、若しくはNから独立して選択される1、2若しくは3個の追加の環員を任意選択により含み、並びに、ここで、ヘテロアリールは、 R^5 から選択される1若しくは2個の置換基、 R^6 から選択される1個の置換基、又は R^5 から選択される1個の置換基及び R^6 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロアリールは、環窒素によって分子の残部に結合しており；

40

R^5 は、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₃₋₄アルケニル、C₃₋₄アルキニル、C₃₋₄アルケニルオキシ、C₃₋₄アルキニルオキシ、シアノC₁₋₂アルキル、C₁₋₂ハロアルキル、ヒドロキシC₁₋₂アルキル、C₁₋₂アルコキシC₁₋₂アルキル、C₁₋₂アルコキシC₁₋₂アルコキシC₁₋₂アルキル、N, N - ジメチルアミノ、C₁₋₃アルコキシカルボニルC₁₋₂アルキル、C₁₋₃アルキルカルボニルオキシC₁₋₂アルキル、N - C₁₋₃アルキルアミノカルボニルC₁₋₂アルキル、N

50

, N - ジ C₁₋₃アルキルアミノカルボニル C₁₋₂アルキル、C₁₋₂アルキルスルホニル、C₁₋₃アルキルカルボニル、C₁₋₃アルキルジカルボニル、C₁₋₃アルコキシジカルボニル、N - C₁₋₃アルキルアミノジカルボニル、若しくは N, N - ジ C₁₋₃アルキルアミノジカルボニルを表すか；又は

R⁵は - C(O)N(R^a)(R^b)を表し、ここで：

R^aは、水素、C₁₋₆アルキル、C₃₋₄アルケニル、C₃₋₄アルキニル、C₁₋₃ハロアルキル、C₃₋₄ハロアルケニル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₂アルコキシ C₁₋₃アルキル、C₂₋₃ハロアルコキシ、C₃₋₄アルケニルオキシ、C₃₋₄アルキニルオキシ、N - C₁₋₃アルキルアミノ、若しくは N, N - ジ C₁₋₂アルキルアミノを表すか；又は

R^aは、C₃₋₅シクロアルキル、C₃₋₅シクロアルキル C₁₋₂アルキル、フェニル、フェニル C₁₋₂アルキル、ヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリル部分は、N、O若しくは S から独立して選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 6 員非芳香族環であり、但し、ヘテロシクリルは、O 及び S から選択される 2 個の隣接原子、ヘテロアリール若しくはヘテロアリール C₁₋₂アルキルを含有することができず、ここで、ヘテロアリール部分は、N、O 及び S から個別に選択される 1、2、3、若しくは 4 個のヘテロ原子を含む 5 若しくは 6 員芳香族環であり；ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクリル若しくはヘテロアリールは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、アシル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、若しくは N, N - ジメチルアミノから選択される、1 若しくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、R^aがシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、C(O)若しくは S(O)₂から選択される 1 個の基を任意選択により含有し；並びに

R^bは、水素、メチル、エチル、プロピル、プロパ - 2 - エニル、プロパ - 2 - イニル、シクロプロピル、若しくはシクロプロピルメチルを表すか；又は

R^a及び R^bは、それらが共有している窒素原子と一緒にあって、ハロゲン、メチル、エチル若しくはメトキシから選択される 1 若しくは 2 個の基によって任意選択により置換されているアゼチジニル、ピロリジニル、イソオキサゾリジニル、モルホリノ、ピペラジン - 4 - イル、若しくはピペリジニル環を形成するか；又は

R⁵は、- C(O)O - R^cを表し、ここで：

R^cは、水素、C₁₋₆アルキル、C₃₋₅アルケニル、C₃₋₅アルキニル、C₁₋₃ハロアルキル、C₃₋₄ハロアルケニル、N, N - ジ C₁₋₃アルキルアミノ C₁₋₃アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₄シクロアルキル C₁₋₂アルキル、フェニル、ヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリル部分は、O、S 及び N から独立して選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 6 員非芳香族環であり、但し、ヘテロシクリルは、O 及び S から選択される 2 個の隣接原子、ヘテロアリールを含有することができず、ここで、ヘテロアリール部分は、N、O 及び S から個別に選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 若しくは 6 員芳香族環であり；並びに、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクリル若しくはヘテロアリールは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、メチルカルボニル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、若しくは N, N - ジメチルアミノから選択される、1 若しくは 2 個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、R^cがシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、C(O)若しくは S(O)₂から選択される 1 個の基を任意選択により含有するか；又は

R⁵は、- N(R^d)(R^e)若しくは - C₁₋₂アルキル - N(R^d)(R^e)を表し、ここで、

R^dは、C₁₋₃アルキル、C₃₋₄アルケニル、C₃₋₄アルキニル、メチルカルボニル、メトキシカルボニル、N - メチルアミノカルボニル、N, N - ジメチルアミノカルボニル、N - メトキシアミノカルボニル、N - メチル - N - メトキシ - アミノカルボニル、メチルスルホニル、N - メチルアミノスルホニル、N, N - ジメチルアミノスルホニル、メチルジカルボニル、N - メチルアミノジカルボニル、若しくは N, N - ジメチルアミノジカルボ

10

20

30

40

50

ニルを表し；及び

R^e は、水素、メチル、エチル、若しくはプロピルを表すか；又は

R^d 及び R^e は、それらが共有している窒素原子と一緒にあって、ハロゲン、メチル、エチル若しくはメトキシから選択される1若しくは2個基によって任意選択により置換されているアセチジニル、ピロリジニル、イソオキサゾリジニル、モルホリノ、ピペラジン-4-イル、若しくはピペリジニル環を形成するか；又は

R^5 は $-CH=N(R^f)$ を表し、ここで、 R^f は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケノキシ、若しくは C_{2-4} アルキノキシを表し；

R^6 は、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルを表し、ここで、ヘテロアリアル部分は、N、O及びSから個別に選択される1、2、3、若しくは4個のヘテロ原子、ヘテロシクリルを含む5若しくは6員芳香族環であり；ここで、ヘテロシクリル部分は、N、O及びSから個別に選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4～6員非芳香族環であり、並びに、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、アシル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N、N-ジメチルアミノから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、 R^6 がシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、 $C(O)$ 若しくは $S(O)_2$ から選択される1個の基を任意選択により含有し；

並びに

Z^3 は、1個の窒素を含有する7～9員の飽和の、部分飽和の、若しくは芳香族の縮合環又は飽和のスピロ環式環系であるヘテロビシクリルを表し、ここで、ヘテロビシクリルは、N、O、S、 $C(O)$ 及び $S(O)_2$ から独立して選択される1若しくは2個の追加の環員を任意選択により含み、但し、ヘテロビシクリルは、O及びSから選択される2個の隣接原子を含有することができず、ここで、ヘテロビシクリルは、 R^7 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロビシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合しており；並びに

R^7 は、シアノ、フルオロ、クロロ、アミノ、ヒドロキシ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N、N-ジメチルアミノ、ホルミル、メチルカルボニル、メトキシカルボニル、N-メチルアミノカルボニル、又はN、N-ジメチルアミノカルボニルである)；

又はその塩若しくはN-オキシドが提供される。

【0004】

意外なことに、式(I)の新規な化合物が、實際上、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る非常に有利なレベルの生物学的活性を有することが見出された。

【発明を実施するための形態】

【0005】

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

【0006】

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

【0007】

本発明の第4の態様によれば、殺菌・殺力比剤としての式(I)の化合物の使用が提供される。本発明のこの特定の態様によれば、使用は、手術若しくは治療によるヒト若しくは動物の身体の処置法を除いていてもよい。

【0008】

10

20

30

40

50

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

【0009】

本明細書において用いられるところ、シアノは -CN 基を意味する。

【0010】

本明細書において用いられるところ、「ヒドロキシル」又は「ヒドロキシ」という用語は -OH 基を意味する。

【0011】

本明細書において用いられるところ、アミノは -NH₂ 基を意味する。

10

【0012】

本明細書において用いられるところ、アシルは -C(O)CH₃ 基を意味する。

【0013】

本明細書において用いられるところ、ホルミルは -C(O)H 基を意味する。

【0014】

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

20

【0015】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄アルコキシ」という用語は、式 -OR_x のラジカルを指し、ここで、R_xは、一般に上記において定義されているC₁₋₄アルキルラジカルである。C₁₋₃アルコキシ及びC₁₋₂アルコキシという用語は相応に解釈されるべきである。C₁₋₄アルコキシの例としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ及びt-ブトキシが挙げられる。

30

【0016】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₃ハロアルキル」という用語は、1個以上の同一若しくは異なるハロゲン原子によって置換されている、一般に上記において定義されているC₁₋₃アルキルラジカルを指す。C₁₋₃ハロアルキルの例としては、これらに限定されないが、フルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、及び3,3,3-トリフルオロプロピルが挙げられる。

【0017】

本明細書において用いられるところ、「C₂₋₆アルケニル」という用語は、炭素及び水素原子のみからなり、(E)配置又は(Z)配置のいずれかのものであり得る少なくとも1つの二重結合を含み、2～6個の炭素原子を有し、単結合によって分子の残りの部分に結合された直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖ラジカル基を指す。C₃₋₆アルケニル、C₃₋₅アルケニル、C₂₋₄アルケニル及びC₂₋₃アルケニルは相応に解釈されるべきである。C₂₋₆アルケニルの例としては、これらに限定されないが、プロパ-1-エニル、アリル（プロパ-2-エニル）、及びブタ-1-エニルが挙げられる。

40

【0018】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₆ハロアルケニル」という用語は、1個以上の同一若しくは異なるハロゲン原子によって置換されている、一般に上記において定義されているC₃₋₆アルケニルラジカルを指す。C₃₋₄ハロアルケニルは相応に解釈されるべきである。

50

【 0 0 1 9 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{2-4} アルケノキシ」という用語は、式 $-OR_x$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{2-4} アルケニルラジカルである。

【 0 0 2 0 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{2-6} アルキニル」という用語は、炭素及び水素原子のみからなり、少なくとも1つの三重結合を含み、2～6個の炭素原子を有し、かつ単結合によって分子の残りの部分に結合された直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖ラジカル基を指す。 C_{3-5} アルキニル及び C_{2-4} アルキニルは相応に解釈されるべきである。 C_{2-6} アルキニルの例としては、これらに限定されないが、プロパ-1-イニル、プロパルギル(プロパ-2-イニル)が挙げられる。

10

【 0 0 2 1 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{2-4} アルキノキシ」という用語は、式 $-OR_x$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{2-4} アルキニルラジカルである。

【 0 0 2 2 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アルキル」という用語は、式 R_y-O-R_x- のラジカルを指し、ここで、 R_y は、一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルラジカルであり、及び R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキレンラジカルである。

20

【 0 0 2 3 】

本明細書において用いられるところ、「ヒドロキシ C_{1-4} アルキル」という用語は、1個以上のヒドロキシ基によって置換された、一般に上記において定義されている C_{1-4} アルキルラジカルを指す。「ヒドロキシ C_{1-2} アルキル」という用語は、相応に解釈されるべきである。

【 0 0 2 4 】

本明細書において用いられるところ、「シアノ C_{1-2} アルキル」という用語は、1個以上のシアノ基によって置換された、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキルラジカルを指す。

30

【 0 0 2 5 】

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

【 0 0 2 6 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-3} アルキルジカルボニル」という用語は、式 $-[C(O)]_2R_x$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

【 0 0 2 7 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-3} アルキルカルボニルオキシ C_{1-2} アルキル」という用語は、式 $R_yC(O)OR_x-$ のラジカルを指し、ここで、 R_y は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルであり、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキレンラジカルである。

40

【 0 0 2 8 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル」という用語は、式 $R_xOR_yOR_z-$ のラジカルを指し、ここで、 R_y 及び R_z は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキレンラジカルであり、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキルラジカルである。

【 0 0 2 9 】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-3} アルコキシアミノカルボニル」という用語は、式 $R_xONHC(O)-$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定

50

義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

【0030】

本明細書において用いられるところ、「 $N - C_{1-3}$ アルキル - $N - C_{1-3}$ アルコキシ - アミノカルボニル」という用語は、式 $(R_x)(R_xO)NHC(O) -$ のラジカルを指し、ここで、各 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

【0031】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-3} アルコキシカルボニル」という用語は、式 $R_xOC(O) -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

【0032】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-3} アルコキシカルボニル C_{1-2} アルキル」という用語は、式 $R_xOC(O)R_y -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルであり、 R_y は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキレンラジカルである。

10

【0033】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-3} アルコキシジカルボニル」という用語は、式 $R_xO[C(O)]_2 -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。 C_{1-2} アルコキシジカルボニルという用語は、相応に解釈されるべきである。

【0034】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-2} アルキルスルホニル」という用語は、式 $R_xS(O)_2 -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキルラジカルである。

20

【0035】

本明細書において用いられるところ、「 $N - C_{1-3}$ アルキルアミノ」という用語は、式 $R_xNH -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

【0036】

本明細書において用いられるところ、「 $N, N - ジ C_{1-2}$ アルキルアミノ」という用語は、式 $R_x(R_x)N -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキルラジカルである。

30

【0037】

本明細書において用いられるところ、「 $N - C_{1-2}$ アルキルアミノスルホニル」という用語は、式 $R_xNHS(O)_2 -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキルラジカルである。

【0038】

本明細書において用いられるところ、「 $N, N - ジ C_{1-2}$ アルキルアミノスルホニル」という用語は、式 $R_x(R_x)NS(O)_2 -$ のラジカルを指し、ここで、各 R_x は独立して、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキルラジカルである。

【0039】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-3} アルキルアミノカルボニル」という用語は、式 $R_xNHC(O) -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

40

【0040】

本明細書において用いられるところ、「 $N, N - ジ C_{1-3}$ アルキルアミノカルボニル」という用語は、式 $(R_x)R_xNHC(O) -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は独立して、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

【0041】

本明細書において用いられるところ、「 $N - C_{1-3}$ アルキルアミノジカルボニル」という用語は、式 $R_xNH[C(O)]_2 -$ のラジカルを指し、ここで、 R_x は、一般に上記に

50

において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。

【0042】

本明細書において用いられるところ、「 N, N -ジ C_{1-3} アルキルアミノジカルボニル」という用語は、式 $(R_x) R_x NH [C(O)]_2$ - のラジカルを指し、ここで、各 R_x は独立して、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルである。 N, N -ジ C_{1-2} アルキルアミノジカルボニルという用語は、相応に解釈されるべきである。

【0043】

本明細書において用いられるところ、「 N, N -ジ C_{1-3} アルキルアミノカルボニル C_{1-2} アルキル」という用語は、式 $(R_x) R_x NHC(O) R_y$ - のラジカルを指し、ここで、各 R_x は独立して、一般に上記において定義されている C_{1-3} アルキルラジカルであり、 R_y は、一般に上記において定義されている C_{1-2} アルキレンラジカルである。

10

【0044】

本明細書において用いられるところ、「 C_{3-6} シクロアルキル」という用語は、飽和若しくは部分不飽和であり、3～6個の炭素原子を含有する、安定した、単環式環ラジカルを指す。 C_{3-5} シクロアルキル及び C_3 シクロアルキルは、相応に解釈されるべきである。 C_{3-6} シクロアルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロペンテン-1-イル、シクロペンテン-3-イル、及びシクロヘキセン-3-イルが挙げられる。

【0045】

本明細書において用いられるところ、「 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-2} アルキル」という用語は、上記において定義されている C_{1-2} アルキレンラジカルによって分子の残部に結合している、上記において定義されている C_{3-6} シクロアルキル環を指す。 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピルメチル及びシクロブチルエチルが挙げられる。

20

【0046】

本明細書において用いられるところ、「フェニル C_{1-2} アルキル」という用語は、上記に定義されている C_{1-2} アルキレンラジカルによって分子の残部に結合しているフェニル環を指す。フェニル C_{1-2} アルキルの例としては、これらに限定されないが、ベンジルが挙げられる。

【0047】

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

30

【0048】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリール C_{1-2} アルキル」という用語は通常、上記に定義されている C_{1-2} アルキレンラジカルによって分子の残部に結合している上記に定義されているヘテロアリールを指す。

40

【0049】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリル」又は「複素環式」という用語は通常、窒素、酸素及び硫黄から個々に選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む安定な飽和又は部分飽和の4～6員非芳香族単環式環を指す。ヘテロシクリルラジカルは、炭素原子又はヘテロ原子を介して分子の残部に結合していてもよい。ヘテロシクリルの例としては、これらに限定されないが、アセチジニル、オキセタニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル、ペペリジニル、ピペラジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、及びモルホリニルが挙げられる。

50

【0050】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリル」又は「ヘテロシクリック」という用語は、窒素、酸素及び硫黄から個別に選択される1若しくは2個の追加の環員を含む、1個の窒素を含有する、7～9員の飽和の、部分飽和の又は芳香族の縮合環又は飽和の、安定したスピロ環式環ラジカルを指す。ヘテロシクリルラジカルは、窒素原子を介して分子の残部に結合している。ヘテロシクリルの例としては、これらに限定されないが、ピロピリジン、ベンズイミダゾールが挙げられる。

【0051】

式(I)の化合物中に1個以上の不斉炭素原子の存在が可能であるとは、その化合物がキラル異性形態、すなわち、鏡像異性形態又はジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、単結合に係る回転の制限によってアストロブ異性体が生じ得る。式(I)は、すべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含む。同様に、式(I)は、存在する場合、すべての可能性のある互変異性体(ラクタム-ラクチム互変異性及びケト-エノール互変異性を含む)を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

10

【0052】

各事例において、本発明に係る式(I)の化合物は、遊離形態、N-オキッドとしての酸化型、共有結合的に水和した形態、又は、例えば農業経済学的に使用可能な又は農芸化学的に許容可能な塩形態といった塩形態である。

20

【0053】

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

【0054】

以下のリストは、本発明に係る式(I)の化合物に関して、置換基A(A-1、A-2、A-3)、R¹、R²、Z(Z¹、Z²、Z³などの)、R³、R⁴、R⁵(R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、R^fなどの)、R⁶及びR⁷について、好ましい定義を含めて、定義を提供する。これらの置換基の任意の1つについて、以下に与えられる定義のいずれかが、本明細書において下に又は別の場所で与えられる任意の他の置換基の定義と組み合わせられてもよい。

30

【0055】

Aは、A-1、A-2、及びA-3から選択される。A-1は2,5-チエニル基を表し、A-2は2,4-チエニル基を表し、A-3は3,5-チエニル基を表す。好ましくは、AはA-1である。

【0056】

R¹及びR²は独立して、水素、メチル、エチル、フルオロ、シアノ、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表す。好ましくは、R¹及びR²は独立して、水素又はメチルを表し、より好ましくはR¹及びR²は両方とも水素を表す。

40

【0057】

Zは、Z¹、Z²、及びZ³から選択される。

【0058】

Z¹は、1個の窒素を含有する4、5若しくは6員非芳香族ヘテロシクリル環を表し、ここで、ヘテロシクリルは、N、O、S、C(O)及びS(O)₂から独立して選択される1若しくは2個の追加の環員を任意選択により含み、但し、ヘテロシクリルは、O及びSから選択される2個の隣接原子を含有することができず、又はヘテロシクリルは、1個の追加の環員NR³を任意選択により含み、ここで、ヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、R⁴から選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロシクリルは、環窒素によって分子の残

50

部に結合している。

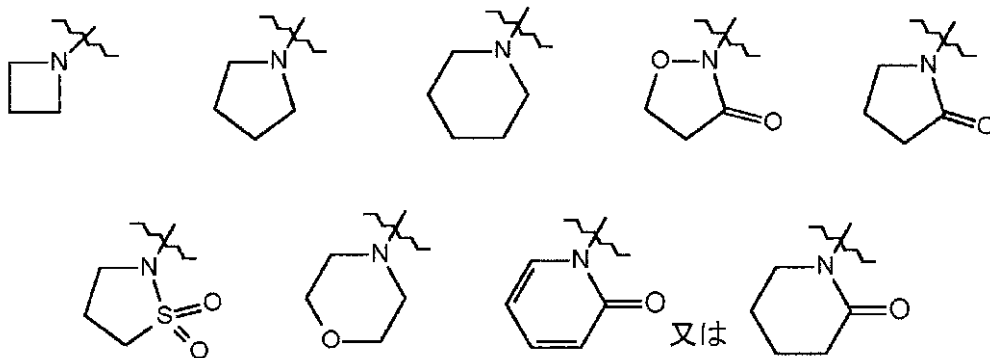
【0059】

好ましくは、 Z^1 は、1個の環窒素を含有する4、5若しくは6員非芳香族ヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリルは、N、O、S、C(O)又はS(O)₂(特に、O又はC(O))から独立して選択される1個の追加の環員を任意選択により含み、ここで、ヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、 R^4 から選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合している。

【0060】

より好ましくは、 Z^1 は、

【化3】



から選択され、ここで、 Z^1 は、同一であっても異なってもよい、 R^4 から選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されている。

【0061】

本発明の特定の実施形態において、 Z^1 は、 R^4 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている。

【0062】

R^3 は、水素、ヒドロキシ、アミノ、ホルミル、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 C_{1-3} アルキルカルボニル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル、N- C_{1-3} アルキルアミノカルボニル、N,N-ジ C_{1-3} アルキルアミノカルボニル、N- C_{1-3} アルコキシアミノカルボニル、N- C_{1-3} アルキル-N- C_{1-3} アルコキシ-アミノカルボニル、 C_{1-2} アルキルスルホニル、N- C_{1-2} アルキルアミノスルホニル、N,N-ジ C_{1-2} アルキルアミノスルホニル、 C_{1-2} アルキルジカルボニル、 C_{1-2} アルコキシジカルボニル、N- C_{1-2} アルキルアミノジカルボニル又はN,N-ジ C_{1-2} アルキルアミノジカルボニルを表す。

【0063】

R^4 は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N-メチルアミノ又はN,N-ジメチルアミノを表す。好ましくは、 R^4 は、メチル又はエチルから選択される。

【0064】

Z^2 は、1個の環窒素を含有する5若しくは6員ヘテロアリアル環を表し、ここで、ヘテロアリアルは、O、S、又はNから独立して選択される1、2若しくは3個の追加の環員を任意選択により含み、並びに、ここで、ヘテロアリアルは、 R^5 から選択される1若しくは2個の置換基、 R^6 から選択される1個の置換基、又は R^5 から選択される1個の置換基及び R^6 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロアリアルは、環窒素によって分子の残部に結合している；

【0065】

本発明の特定の好ましい実施形態において、 Z^2 は、 R^5 から選択される1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、最も好ましくは R^5 から選択される単一の置換基によって任意選択により置換されている。

10

20

30

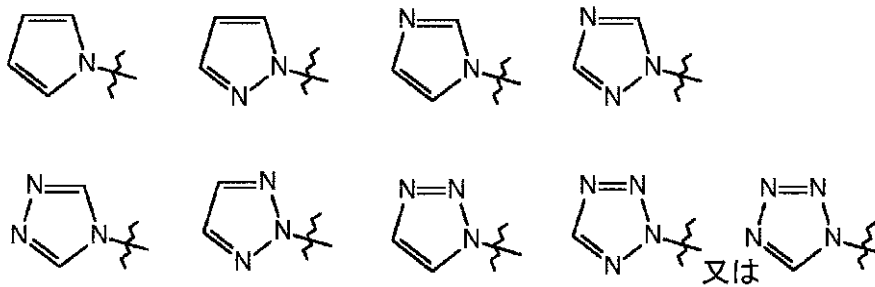
40

50

【0066】

好ましくは、 Z^2 は、

【化4】



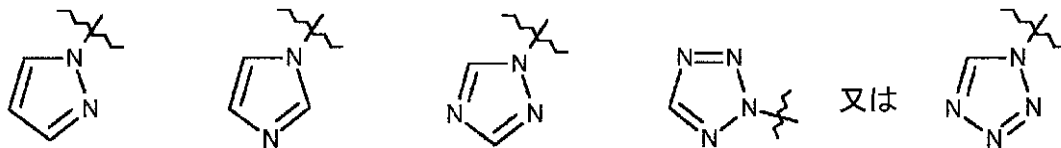
10

から選択され、ここで、 Z^2 は、 R^5 から選択される1若しくは2個の置換基、 R^6 から選択される1個の置換基、又は R^5 から選択される1個の置換基及び R^6 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている。

【0067】

より好ましくは、 Z^2 は、

【化5】



20

から選択され、ここで、 Z^2 は、 R^5 から選択される1若しくは2個の置換基、 R^6 から選択される1個の置換基、又は R^5 から選択される1個の置換基及び R^6 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている。

【0068】

R^5 は、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-4} アルキニルオキシ、シアノ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} ハロアルキル、ヒドロキシ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、 N 、 N -ジメチルアミノ、 C_{1-3} アルコキシカルボニル C_{1-2} アルキル、 C_{1-3} アルキルカルボニルオキシ C_{1-2} アルキル、 N - C_{1-3} アルキルアミノカルボニル C_{1-2} アルキル、 N 、 N -ジ C_{1-3} アルキルアミノカルボニル C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルホニル、 C_{1-3} アルキルカルボニル、 C_{1-3} アルキルジカルボニル、 C_{1-3} アルコキシジカルボニル、 N - C_{1-3} アルキルアミノジカルボニル、若しくは N 、 N -ジ C_{1-3} アルキルアミノジカルボニルを表すか；又は

30

R^5 は、 $-C(O)N(R^a)(R^b)$ を表し、ここで：

R^a は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{3-4} ハロアルケニル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-3} アルキル、 C_{2-3} ハロアルコキシ、 C_{3-4} アルケニルオキシ、 C_{3-4} アルキニルオキシ、 N - C_{1-3} アルキルアミノ、若しくは N 、 N -ジ C_{1-2} アルキルアミノを表すか；又は

40

R^a は、 C_{3-5} シクロアルキル、 C_{3-5} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、フェニル、フェニル C_{1-2} アルキル、ヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリル部分は、 N 、 O 若しくは S から独立して選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4～6員非芳香族環であり、但し、ヘテロシクリルは、 O 及び S から選択される2個の隣接原子、ヘテロアリアル若しくはヘテロアリアル C_{1-2} アルキルを含有することができず、ここで、ヘテロアリアル部分は、 N 、 O 及び S から個別に選択される1、2、3、若しくは4個のヘテロ原子を含む5若しくは6員芳香族環であり；ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクリル若しくはヘテロアリアルは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、ア

50

ミノ、ホルミル、アシル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、若しくはN, N - ジメチルアミノから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、 R^a がシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、 $C(O)$ 若しくは $S(O)_2$ から選択される1個の基を任意選択により含有し；並びに

R^b は、水素、メチル、エチル、プロピル、プロパ - 2 - エニル、プロパ - 2 - イニル、シクロプロピル、若しくはシクロプロピルメチルを表すか；又は

R^a 及び R^b は、それらが共有している窒素原子と一緒にあって、ハロゲン、メチル、エチル若しくはメトキシから選択される1若しくは2個の基によって任意選択により置換されているアゼチジニル、ピロリジニル若しくはピペリジニル環を形成するか；又は

R^5 は、 $-C(O)O-R^c$ を表し、ここで：

R^c は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} アルケニル、 C_{3-5} アルキニル、 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{3-4} ハロアルケニル、N, N - ジ C_{1-3} アルキルアミノ C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-4} シクロアルキル C_{1-2} アルキル、フェニル、ヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリル部分は、O、S及びNから独立して選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4～6員非芳香族環であり、但し、ヘテロシクリルは、O及びSから選択される2個の隣接原子、ヘテロアリアルを含有することができず、ここで、ヘテロアリアル部分は、N、O及びSから個別に選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員芳香族環であり；並びに、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクリル若しくはヘテロアリアルは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、メチルカルボニル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、若しくはN, N - ジメチルアミノから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、 R^c がシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、 $C(O)$ 若しくは $S(O)_2$ から選択される1個の基を任意選択により含有するか；又は

R^5 は、 $-N(R^d)(R^e)$ 若しくは $-C_{1-2}$ アルキル $-N(R^d)(R^e)$ を表し、ここで、

R^d は、 C_{1-3} アルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、メチルカルボニル、メトキシカルボニル、N - メチルアミノカルボニル、N, N - ジメチルアミノカルボニル、N - メトキシアミノカルボニル、N - メチル - N - メトキシ - アミノカルボニル、メチルスルホニル、N - メチルアミノスルホニル、N, N - ジメチルアミノスルホニル、メチルジカルボニル、N - メチルアミノジカルボニル、若しくはN, N - ジメチルアミノジカルボニルを表し；及び

R^e は、水素、メチル、エチル、若しくはプロピルを表すか；又は

R^5 は $-CH=N(R^f)$ を表し、ここで、 R^f は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケノキシ、若しくは C_{2-4} アルキノキシを表し；

R^6 は、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルを表し、ここで、ヘテロアリアル部分は、N、O及びSから個別に選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子、ヘテロシクリルを含む5若しくは6員芳香族環であり；ここで、ヘテロシクリル部分は、N、O及びSから個別に選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4～6員非芳香族環であり、並びに、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、アミノ、ホルミル、アシル、シアノ、ハロゲン、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N, N - ジメチルアミノから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで、 R^6 がシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表す場合、これらの環状物は、 $C(O)$ 若しくは $S(O)_2$ から選択される1個の基を任意選択により含有する。

【0069】

好ましくは、 R^5 は独立して、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-2} ハロアルキル、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、N, N - ジメチルアミノ、 $-C(O)O-R^c$ （式中、 R^c は C_{1-4} アルキルであ

10

20

30

40

50

る)及び - C(O)N(R^a)(R^b) (式中、R^aは、水素、C₁₋₄アルキル若しくはC₁₋₄アルコキシから選択され、R^bは、水素若しくはメチルから選択される)から選択され、R⁶は、同一であっても異なってもよい、ヒドロキシル、メチル、メトキシ、シアノ、フルオロ、クロロ若しくはプロモから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されているフェニルである。

【0070】

より好ましくは、R⁵は、アミノ、シアノ、クロロ、フルオロ、ホルミル、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、メトキシメチル、N,N-ジメチルアミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル若しくはn-プロポキシカルボニル;又は-C(O)N(R^a)(R^b) (式中、R^aは、水素、メチル若しくはメトキシから選択され、R^bは、水素若しくはメチルから選択される)から選択され、R⁶は、同一であっても異なってもよい、フルオロ、クロロ若しくはプロモから選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されているフェニルである。

10

【0071】

Z³は、1個の窒素を含有する7~9員の飽和の、部分飽和の、若しくは芳香族の縮合環又は飽和のスピロ環式環系であるヘテロビシクリルを表し、ここで、ヘテロビシクリルは、N、O、S、C(O)及びS(O)₂から独立して選択される1若しくは2個の追加の環員を任意選択により含み、但し、ヘテロビシクリルは、O及びSから選択される2個の隣接原子を含有することができず、ここで、ヘテロビシクリルは、R⁷から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロビシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合しており;

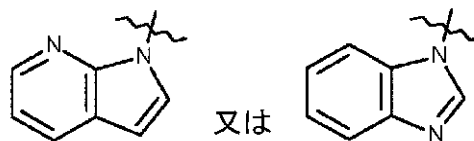
20

好ましくは、Z³は、1個の窒素を含有する9員の飽和の、部分飽和の、若しくは芳香族の縮合環系であるヘテロビシクリルを表し、ここで、ヘテロビシクリルは、N、O、及びSから独立して選択される1個の追加の環員を任意選択により含み、ここで、ヘテロビシクリルは、R⁷から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロビシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合している。

【0072】

より好ましくは、Z³は、

【化6】



30

から選択され、ここで、Z³は、R⁷から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている。

【0073】

R⁷は、シアノ、フルオロ、クロロ、アミノ、ヒドロキシ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N,N-ジメチルアミノ、ホルミル、メチルカルボニル、メトキシカルボニル、N-メチルアミノカルボニル、又はN,N-ジメチルアミノカルボニルである。好ましくは、R⁷は、ヒドロキシル、メトキシ、メチル、シアノ、フルオロ又はクロロから選択される。

40

【0074】

好ましくは、式(I)に係る化合物は、表T1(以下)に列挙されている化合物1.1~1.190から選択される。

【0075】

好ましくは、本発明の式(I)に係る化合物において、

AはA-1であり;

R¹は水素であり、R²は水素又はメチルであり;

ZはZ¹であり、ここで、Z¹は、1個の環窒素を含有する4、5若しくは6員非芳香族

50

ヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリルは、N、O、S、C(O)若しくはS(O)₂(特にO若しくはC(O))から独立して選択される1個の追加の環員を任意選択により含み、ここで、ヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、R⁴から選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロシクリル環は、環窒素によって分子の残部に結合しており；並びに

R⁴は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、N-メチルアミノ又はN,N-ジメチルアミノを表す。

【0076】

より好ましくは、

AはA-1であり；

R¹及びR²は水素であり；

ZはZ¹であり、ここで、Z¹は、1個の環窒素を含有する4、5若しくは6員非芳香族ヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリルは、N、O、S、C(O)若しくはS(O)₂(特にO若しくはC(O))から独立して選択される1個の追加の環員を任意選択により含み、ここで、ヘテロシクリルは、同一であっても異なってもよい、R⁴から選択される、1若しくは2個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロシクリル環は、環窒素によって分子の残部に結合しており；並びに

R⁴は、メチル又はエチルを表す。

【0077】

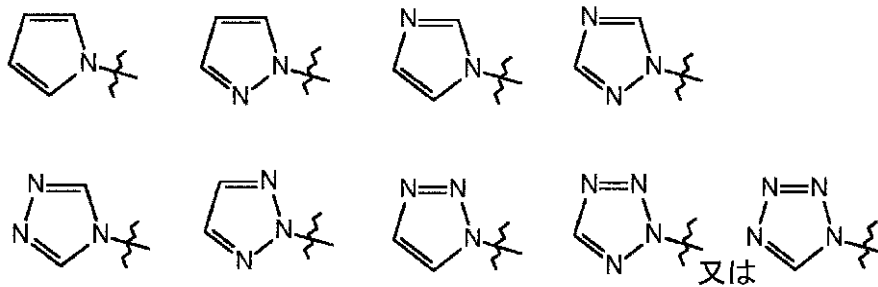
好ましくは、本発明の式(I)に係る化合物において、

AはA-1であり；

R¹は水素であり、R²は、水素又はメチルであり；及び

ZはZ²であり、ここで、Z²は、

【化7】



から選択され、ここで、Z²は、R⁵から選択される1若しくは2個の置換基、R⁶から選択される1個の置換基、又はR⁵から選択される1個の置換基及びR⁶から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている。

【0078】

より好ましくは、

AはA-1であり；

R¹及びR²は水素であり；及び

ZはZ²であり、ここで、Z²は、

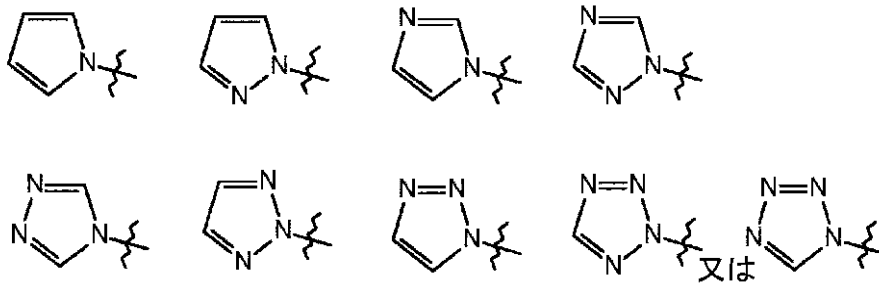
10

20

30

40

【化 8】



10

から選択され、ここで、 Z^2 は、 R^5 から選択される1若しくは2個の置換基又は R^6 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている。

【0079】

好ましくは、本発明の式(I)に係る化合物において、

AはA-1であり；

R^1 は水素であり、 R^2 は、水素又はメチルであり；及び

Zは Z^3 であり、ここで、 Z^3 は、1個の窒素を含有する9員の飽和の、部分飽和の、若しくは芳香族の縮合環系であるヘテロビシクリルを表し、ここで、ヘテロビシクリルは、N、O及びSから独立して選択される1個の追加の環員を任意選択により含み、ここで、ヘテロビシクリルは、 R^7 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロビシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合している；

20

【0080】

より好ましくは、

AはA-1であり；

R^1 及び R^2 は水素であり；

Zは Z^3 であり、ここで、 Z^3 は、1個の窒素を含有する9員の飽和の、部分飽和の、若しくは芳香族の縮合環系であるヘテロビシクリルを表し、ここで、ヘテロビシクリルは、N、O及びSから独立して選択される1個の追加の環員を任意選択により含み、ここで、ヘテロビシクリルは、 R^7 から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されており、並びに、ここで更に、ヘテロビシクリルは、環窒素によって分子の残部に結合しており；

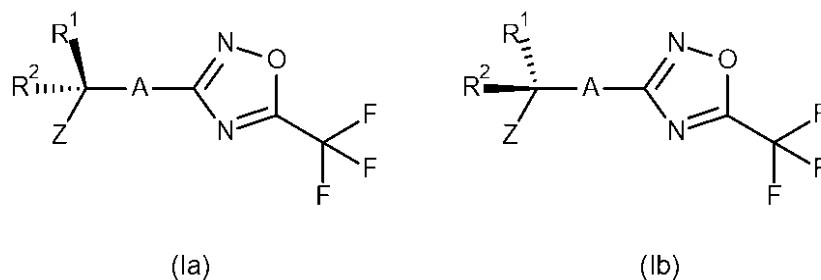
30

R^7 は、ヒドロキシル、メトキシ、メチル、シアノ、フルオロ又はクロロから選択される。

【0081】

本発明の化合物は、 R^1 及び R^2 が異なる置換基である、式(Ia)又は式(Ib)で表されるような式(I)の化合物の鏡像異性体であってもよい。

【化 9】



40

【0082】

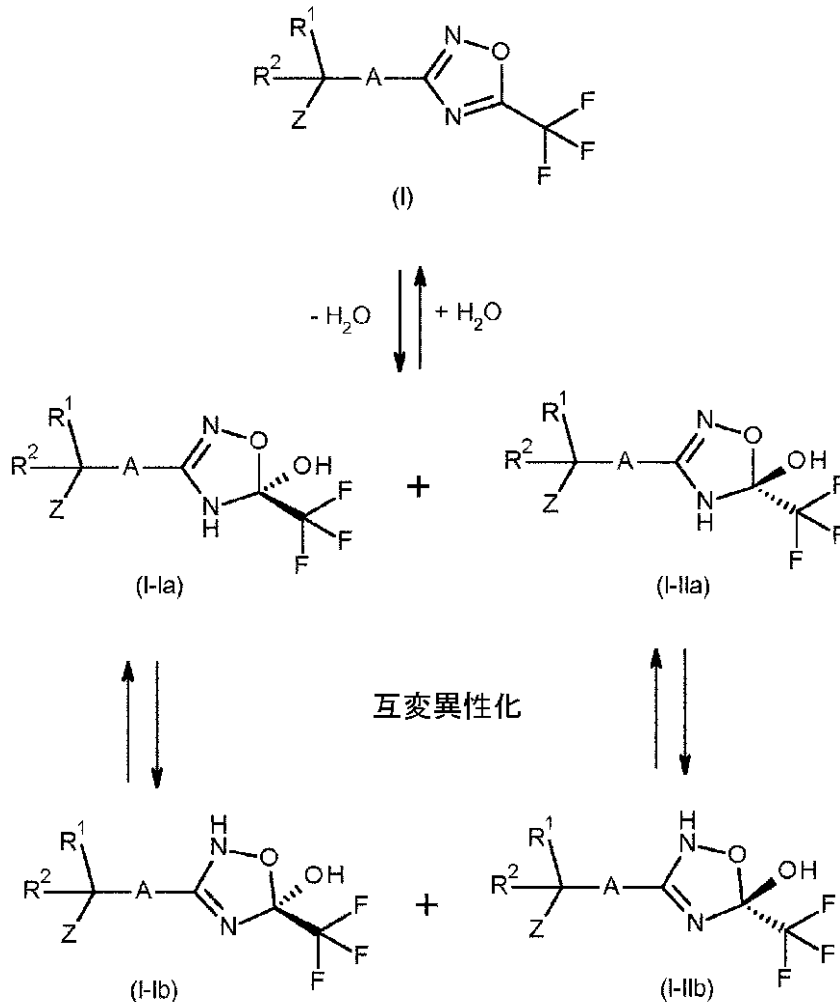
水性媒体中にある場合、本発明に係る式(I)の化合物は、対応する共有結合的な水和形態(すなわち、 CF_3 -オキサジアゾールモチーフで式(I-Ib)及び式(I-II

50

b)) の化合物として互変異性形態で存在し得る以下に示されている式 (I - I a) 及び式 (I - I I a) の化合物) との可逆的な平衡で存在し得ることが理解される。この動的平衡は、式 (I) の化合物の生物学的活性に重要であり得る。本発明の式 (I) の化合物に関連する、A (A - 1、A - 2、A - 3)、R¹、R²、Z (Z¹、Z²、Z³などの)、R³、R⁴、R⁵ (R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、R^fなどの)、R⁶及びR⁷の呼称は、一般に式 (I - I a)、式 (I - I b)、式 (I - I I a)、及び式 (I - I I b) の化合物に適用され、同様に表 1 . 1 ~ 1 . 3、表 2 . 1 及び 2 . 2 に、又は表 T 1 (以下) に列挙されている本発明に係る化合物 1 . 1 ~ 1 . 1 9 0 に表されるような、A (A - 1、A - 2、A - 3)、R¹、R²、Z (Z¹、Z²、Z³などの)、R³、R⁴、R⁵ (R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、R^fなどの)、R⁶及びR⁷の組み合わせの具体的な開示にも適用される。

10

【化 1 0】



20

30

【 0 0 8 3】

本発明の化合物は、以下のスキーム 1 ~ 1 0 において示されるように製造することができる、それらのスキームにおいて、特に明記しない限り、各可変要素の定義は、式 (I) の化合物について上記において定義されているとおりである。

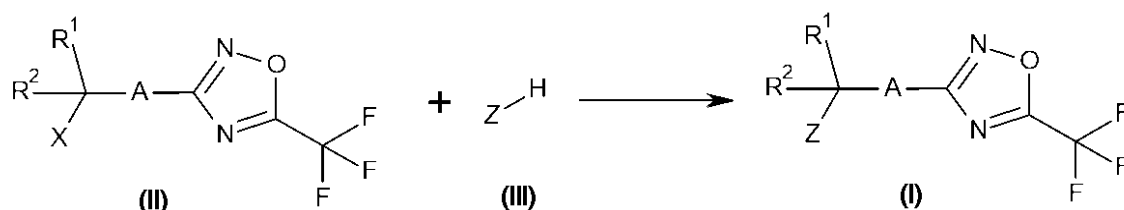
40

【 0 0 8 4】

式 (I) の化合物は、25 ~ 110 の温度で好適な溶媒 (例えば、ジメチルアセトアミド、テトラヒドロフラン、2 - メチルテトラヒドロフラン、アセトン、トルエン、又はアセトニトリル) 中で塩基 (例えば、トリエチルアミン、N, N - ジ - イソプロピルエチルアミン、K₂CO₃、NaHCO₃、Na₂CO₃、Cs₂CO₃、又はNaH) の存在下で、式 (I I I) の化合物での処理によって、式 (I I) の化合物 (式中、Xは、OSO₂CH₃、Cl、Br、又はIである) から調製することができる。いくつかの場合には、より良好な反応実績は、触媒 (例えば、Bu₄NHSO₄、Bu₄NBr、Bu₄NI、Na

50

I、又は4-ジメチルアミノピリジン)及びマイクロ波照射の使用から得られ得る。更に、式(I)の化合物は、式(III)の化合物での処理の前に、例えばメタンスルホニルクロリド(ClSO₂Me)を使用することによって、-OHを-OSO₂CH₃基などの、改善された脱離基へ変換するプロセスを介して、式(III)の化合物及び式(I)の化合物(式中、XはOHである)を伴うカップリング変換によって場合により得ることができる。関連する例については、国際公開第2013/132253号、国際公開第2017/118689号、及びGarcia, M.ら Org. Biomol. Chem. (2004), 11, 1633を参照のこと。この反応はスキーム1に示されている。
【化11】



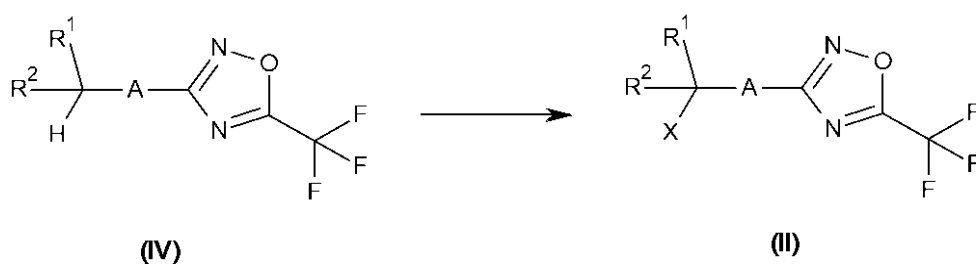
10

スキーム1

【0085】

式(I)の化合物(式中、Xは、ハロゲン、好ましくはCl又はBrである)は、紫外線の存在下で55 ~ 100 の温度で、テトラクロロメタンなどの、好適な溶媒中でハロゲン源(例えば、N-ブロモスクシンイミド(NBS)又はN-クロロスクシンイミド(NCS))及びラジカル開始剤(例えば、(PhCO₂)₂又はアゾビスイソブチロニトリル(AIBN))での処理によって式(IV)の化合物から調製することができる。関連する例については、Liu, S.ら Synthesis (2001), 14, 2078、国際公開第2017/118689号、及びKompella, A.ら Org. Proc. Res. Dev. (2012), 16, 1794を参照のこと。この反応はスキーム2に示されている。
【化12】

20



30

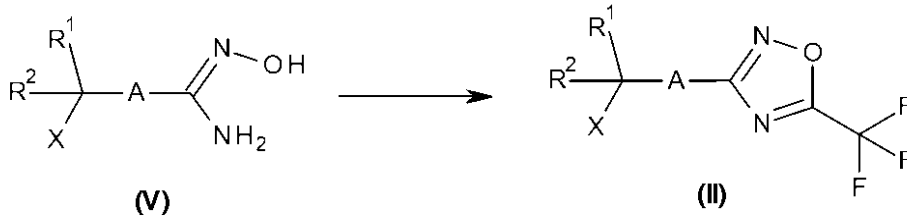
スキーム2

【0086】

あるいは、式(I)の化合物(式中、Xは、水素、OH、Cl、Br、又はIである)は、0 ~ 75 の温度で、好適な溶媒(例えば、酢酸エチル、テトラヒドロフラン、2-メチルテトラヒドロフラン、又はエタノール)中で塩基(ピリジン又は4-ジメチルアミノピリジン)の存在下で無水トリフルオロ酢酸又はトリフルオロアセチルハライド(トリフルオロアセチルフルオリド、トリフルオロアセチルクロリド及びトリフルオロアセチルプロミドなどの)での処理によって式(V)の化合物から調製することができる。関連する例については、国際公開第2003/028729号、国際公開第2017/055473号、及び国際公開第2010/045251号を参照のこと。この反応はスキーム3に示されている。

40

【化13】



スキーム3

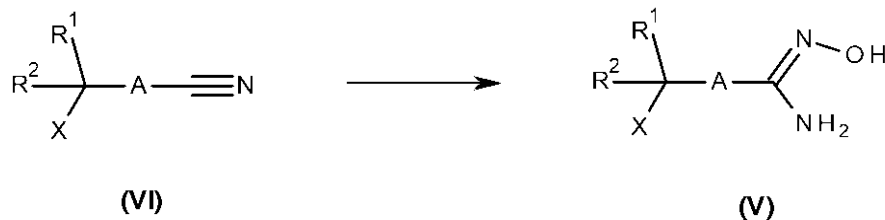
【0087】

10

式(V)の化合物(式中、Xは、水素、OH、又はハロゲンである)は、0 ~ 80の温度で、メタノール又はエタノールなどの、好適な溶媒中で、トリエチルアミン又は炭酸カリウムなどの、塩基の存在下で、水中のヒドロキシルアミン塩酸塩又はヒドロキシルアミン溶液での処理によって式(VI)の化合物から調製することができる。いくつかの場合には、より良好な反応実績は、触媒(例えば、8-ヒドロキシキノリン)の使用から得られ得る。関連する例については、Kitamura, S.ら Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268、国際公開第2017/055473号及び国際公開第2013/066838号を参照のこと。この反応はスキーム4に示されている。

【化14】

20



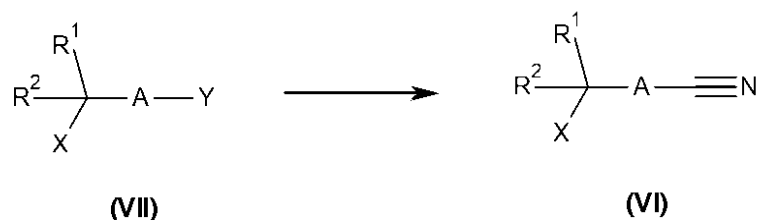
スキーム4

【0088】

30

式(VI)の化合物は、100 ~ 120の高温で好適な溶媒(例えば、ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン)中で、Pd(0)/Zn(CN)₂又はCuCNなどの、好適なシアン化物試薬との金属促進反応によって式(VII)の化合物(式中、Yは、Cl、Br又はIである)から調製することができる。関連する例については、米国特許出願公開第2007/0155739号明細書及び国際公開第2009/022746号を参照のこと。この反応はスキーム5に示されている。

【化15】



40

スキーム5

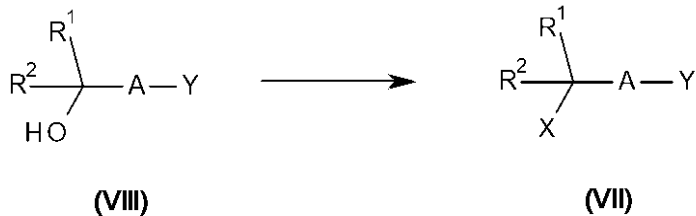
【0089】

式(VII)の化合物(式中、Xは、Cl、Br、I又はOSO₂Meであり、Yは、Cl、Br、I又はCNである)は、商業的に入手可能であるか、又は、0 ~ 100の温度で好適な溶媒(例えば、ジクロロメタン)中で、酸源(例えば、塩酸、臭化水素酸、若しくはヨウ化水素酸)での、又はトリフェニルホスフィンの存在下でのハロゲン源(例えば、CCl₃Br、CCl₄若しくはI₂)での、又はメタンスルホニルクロリド(C

50

1 SO₂Me)での処理によって、式(VIII)の化合物から調製することができる。関連する例については、Liu, H. *ら* Bioorg. Med. Chem. (2008), 16, 10013、国際公開第2014/020350号及びKompella, A. *ら* Bioorg. Med. Chem. Lett. (2001), 13161を参照のこと。式(VIII)の化合物は、商業的に入手可能であるか又は公知の方法を用いて調製される。この反応はスキーム6に示されている。

【化16】



10

スキーム6

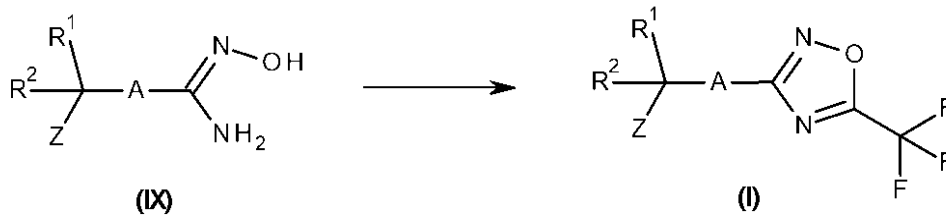
【0090】

あるいは、式(I)の化合物は、0 ~ 75 の温度で、好適な溶媒(例えば、酢酸エチル、テトラヒドロフラン、2-メチルテトラヒドロフラン、又はエタノール)中で塩基(例えば、ピリジン又は4-ジメチルアミノピリジン)の存在下で無水トリフルオロ酢酸又はトリフルオロアセチルハライド(トリフルオロアセチルフルオリド、トリフルオロアセチルクロリド及びトリフルオロアセチルブロミドなどの)での処理によって式(IX)の化合物から調製することができる。関連する例については、国際公開第2003/028729号、国際公開第2017/118689号、及び国際公開第2010/045251号を参照のこと。この反応はスキーム7に示されている。

20

30

【化17】



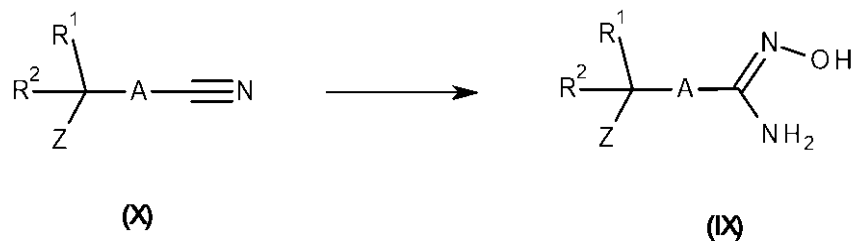
スキーム7

【0091】

式(IX)の化合物は、0 ~ 100 の温度で、メタノール又はエタノールなどの、好適な溶媒中で、トリエチルアミン又はK₂CO₃などの、塩基の存在下で、水中のヒドロキシルアミン塩酸塩又はヒドロキシルアミン溶液での処理によって式(X)の化合物から調製することができる。いくつかの場合には、より良好な反応実績は、触媒(例えば、8-ヒドロキシキノリン)の使用から得られ得る。関連する例については、Kitamura, S. *ら* Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268及び国際公開第2013/066838号を参照のこと。この反応はスキーム8に示されている。

40

【化18】



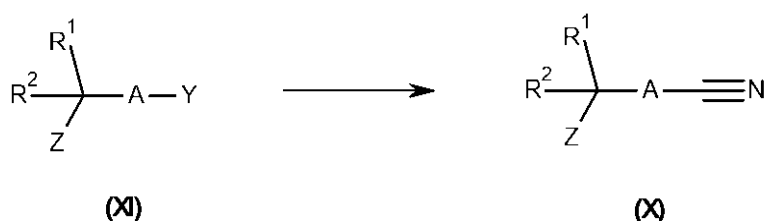
スキーム8

50

【0092】

式(X)の化合物は、80 ~ 120 の高温で好適な溶媒(例えば、ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン)中で、Pd(0)/Zn(CN)₂又はCuCNなどの、好適なシアン化物試薬での金属促進反応によって、式(XI)の化合物(式中、Yは、Cl、Br又はIである)から調製することができる。関連する例については、米国特許出願公開第2007/0155739号明細書、国際公開第2017/118689号、及び国際公開第2009/022746号を参照のこと。この反応はスキーム9に示されている。

【化19】



10

スキーム9

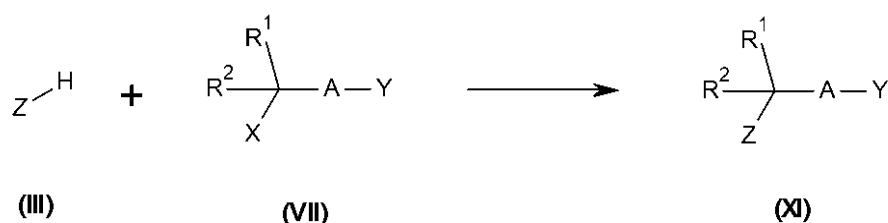
【0093】

式(XI)の化合物(式中、Yは、CN、Cl、Br、又はIである)は、25 ~ 110 の温度で好適な溶媒(例えば、ジメチルアセトアミド、テトラヒドロフラン、2-メチルテトラヒドロフラン、アセトン、トルエン、又はアセトニトリル)中で塩基(例えば、トリエチルアミン、N,N-ジ-イソプロピルエチルアミン、K₂CO₃、NaHCO₃、Na₂CO₃、Cs₂CO₃、又はNaH)の存在下で、式(III)の化合物での処理によって式(VII)の化合物(式中、Xは、OSO₂CH₃、Cl、Br、又はIである)から調製することができる。いくつかの場合には、より良好な反応実績は、触媒(例えば、Bu₄NHSO₄、Bu₄NBr、Bu₄NI、NaI、又は4-ジメチルアミノピリジン)及びマイクロ波照射の使用から得られ得る。更に、式(XI)の化合物は、式(III)の化合物での処理の前に、例えばメタンスルホニルクロリド(ClSO₂Me)を使用することによって、-OHを-OSO₂CH₃基などの、改善された脱離基へ変換するプロセスを介して、式(III)の化合物及び式(VII)の化合物(式中、XはOHである)を伴うカップリング変換によって場合により得ることができる。式(III)の化合物は、商業的に入手可能であるか、又は公知の方法を用いて調製される。関連する例については、国際公開第2013/132253号、国際公開第2017/118689号、及びGarcia, M.ら Org. Biomol. Chem. (2004), 11, 1633を参照のこと。この反応はスキーム10に示されている。

20

30

【化20】



40

スキーム10

【0094】

既に表示されるように、意外なことに、本発明の式(I)の化合物が、實際上、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る非常に有利なレベルの生物学的活性を有することがここで見出された。

【0095】

式(I)の化合物は、農業部門及び関連する使用分野において、例えば、植物有害生物

50

又は非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物若しくは生物の防除に係る有効成分として用いられることが可能である。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性、及び、環境に対して安全であることにより際だって優れたものである。これらはきわめて有用な治療的特性、予防的特性及び浸透移行特性を有すると共に、数多くの栽培植物の保護に用いられ得る。式(Ⅰ)の化合物は、有用な植物の異なる作物の植物又は植物の一部(果実、花、葉、茎、塊茎、根)に生じる有害生物を阻害又は駆除するために、他方では、同時に、後に成長する植物のこれらの部位をも例えば植物病原性微生物から保護するために用いられることが可能である。

【0096】

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

10

【0097】

式(Ⅰ)の化合物を殺菌・殺カビ剤として用いることも可能である。「殺菌・殺カビ剤」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖を防除し、変性させ、又は、防止する化合物を意味する。「殺菌・殺カビ的に有効な量」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖に効果をもたらすことが可能である、このような化合物又はこのような化合物の組み合わせの量を意味する。防除又は変性効果は、死滅、遅滞等などの自然の発育からの逸脱のすべてを含み、予防は、真菌による感染を予防するための植物におけるバリア又は他の防御形成を含む。

20

【0098】

土壤中で発生する真菌性感染症、並びに、植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊茎若しくは穀粒などの種子又は植物挿穂といった植物繁殖体を処理する粉衣剤として式(Ⅰ)の化合物を用いることも可能であり得る。この繁殖体は、植え付け前に式(Ⅰ)の化合物を含む組成物で処理することが可能である：例えば、種子は、播種される前に粉衣されることが可能である。式(Ⅰ)の活性化合物はまた、種子を液体配合物中に含浸させるか、又は、種子を固体配合物でコーティングすることにより穀粒に適用(コーティング)することが可能である。組成物はまた、繁殖体が植え付けられる際に植え付け箇所に適用が可能であり、例えば、播種の最中において蒔き溝に適用が可能である。本発明はまた、このような植物繁殖体の処理方法、及び、このようにして処理された植物繁殖体にも関する。

30

【0099】

さらに、式(Ⅰ)化合物は、例えば、木材及び木材系工業用製品を含む工業用材料の保護、食品保管、衛生管理といった関連する分野における真菌の防除に用いられることが可能である。

【0100】

加えて、本発明は、例えば材木、壁板及び塗料といった非生体材料を真菌による作用から保護するために用いられることが可能である。

【0101】

式(Ⅰ)の化合物は、例えば、病害に係る真菌及び真菌媒介物、並びに、植物病原性バクテリア及びウイルスに対して効果的である。これらの病害に係る真菌及び真菌媒介物、並びに、植物病原性バクテリア及びウイルスは、例えば以下のとおりである。

40

【0102】

アブシジアコリムピフェラ(*Absidia corymbifera*)、アルテルナリア属の一種(*Alternaria spp.*)、アフアノミセス属の一種(*Aphanomyces spp.*)、アスコキタ属の一種(*Ascochyta spp.*)、*A. フラバス*(*A. flavus*)、*A. フミガーツス*(*A. fumigatus*)、*A. ニズランス*(*A. nidulans*)、*A. ニガー*(*A. niger*)、*A. テルス*(*A. terreus*)を含むアスペルギルス属の一種(*Aspergillus spp.*)、*A.*

50

.ブルランス (*A. pullulans*) を含むアウレオバシジウム属の一種 (*Aureobasidium* spp.)、ブラストミセスデルマチチデイス (*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス (*Blumeria graminis*)、プレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*)、*B. ドチデア* (*B. dothidea*)、*B. オブツサ* (*B. obtusa*) のボトリオスファエリア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、*B. シネレア* (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、*C. アルビカンス* (*C. albicans*)、*C. グラブラータ* (*C. glabrata*)、*C. クルセイ* (*C. krusei*)、*C. ルシタニエ* (*C. lusitaniae*)、*C. パラプシロシス* (*C. parapsilosis*)、*C. トロピカリス* (*C. tropicalis*) のカンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、セファロアスクスフラグラン (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp.)、*C. アラキジコラ* (*C. arachidicola*) を含むセルコスボラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスボリジウムベルソナツム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスポリウム属の一種 (*Cladosporium* spp.)、クラビセプスプルプレア (*Claviceps purpurea*)、コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp.)、*C. ムサエ* (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、クリプトコッカスネオフォルマン (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp.)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp.)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp.)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp.)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp.)、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、*E. シコラセアルム* (*E. cichoracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、ユーチパラタ (*Eutyphalata*)、*F. クルモルム* (*F. culmorum*)、*F. グラミネアルム* (*F. graminearum*)、*F. ラングセチエ* (*F. langsethiae*)、*F. モニリホルメ* (*F. moniliforme*)、*F. オキシスポルム* (*F. oxysporum*)、*F. プロリフェラツム* (*F. proliferatum*)、*F. スブグルチナンス* (*F. subglutinans*)、*F. ソラニ* (*F. solani*) を含むフザリウム属の一種 (*Fusarium* spp.)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、ギベレラフジクroi (*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムムサルム (*Gloeosporium musarum*)、グロメラシングレート (*Glomerella cingulate*)、ガイグナルディアビドウェリイ (*Guignardia bidwellii*)、ギムノスポランギウムジュニベリ-ヴィルギニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、ヘルミントスポリウム属の一種 (*Helminthosporium* spp.)、ヘミレイア属の一種 (*Hemileia* spp.)、*H. カプストラツム* (*H. capsulatum*) を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、レプトグラフィウムリンデルギ (*Leptographium lindbergi*)、レveilラタウリカ (*Leveillula taurica*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、マイクロスポルム属の一種 (*Microsporum* spp.)、モニリニア属の一種 (*Monilinia* spp.)、ムコール属の一種 (*Mucor* spp.)、コムギ葉枯病菌 (*M. graminicola*)、*M. ポミ* (*M. pomi*) を含むミコスファエレラ属の一種 (*Mycosphaerella* spp.)、オンコバシジウムテオプロマエオン (*Oncobasidi*

um theobromaen)、オフィオストマピセエ(*Ophiostoma piceae*)、パラコジディオイデス属の一種(*Paracoccidioides* spp)、*P. デジタルム*(*P. digitatum*)、*P. イタリアム*(*P. italicum*)を含むペニシリウム属の一種(*Penicillium* spp.)、ペトリエリジウム属の一種(*Petriellidium* spp)、*P. メイディス*(*P. maydis*)、*P. フィリピンシス*(*P. philippinensis*)及び*P. ソルギ*(*P. sorghi*)を含むペロノスクレロスボラ属の一種(*Peronosclerospora* spp.)、ペロノスポラ属の一種(*Peronospora* spp)、コムギふ枯病菌(*Phaeosphaeria nodorum*)、ファコブソラパチリジ(*Phakopsora pachyrhizi*)、フェリヌスイグニアルス(*Phellinus igniarius*)、フィアロフォラ属の一種(*Phialophora* spp)、フォーマ属の一種(*Phoma* spp)、ホモプシスビティコーラ(*Phomopsis viticola*)、*P. インフェスタンス*(*P. infestans*)を含むフィトフトラ属の一種(*Phytophthora* spp.)、*P. ハルステジイ*(*P. halstedii*)、*P. ビチコラ*(*P. viticola*)を含むプラスマパラ属の一種(*Plasmopara* spp.)、プレオスポラ属の一種(*Pleospora* spp.)、リンゴうどんこ病菌(*P. leucotricha*)を含むポドスファエラ属の一種(*Podosphaera* spp.)、ポリミキサグラミニス(*Polymyxa graminis*)、ポリミキサベタエ(*Polymyxa betae*)、シュードセルコスボレラヘルボトリコイド(*Pseudocercospora rella herpotrichoides*)、シュードモナス属の一種(*Pseudomonas* spp)、*P. クベンシス*(*P. cubensis*)、*P. フムリ*(*P. humuli*)を含むシュードペロノスポラ属の一種(*Pseudoperonospora* spp.)、シュードベジザトラケイフィラ(*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. ホルデイ*(*P. hordei*)、*P. レコンディタ*(*P. recondita*)、*P. ストリイホルミス*(*P. striiformis*)、*P. トリチシナ*(*P. triticina*)を含むプッシニア属の一種(*Puccinia* spp.)、ピレノベジザ属の一種(*Pyrenopeziza* spp)、ピレノフォラ属の一種(*Pyrenophora* spp)、イネいもち病菌(*P. oryzae*)を含むピリクラーリア属の一種(*Pyricularia* spp.)、*P. ウルチムム*(*P. ultimum*)を含むピシウム属の一種(*Pythium* spp.)、ラムラリア属の一種(*Ramularia* spp)、リゾクトニア属の一種(*Rhizoctonia* spp)、リゾムコールプシルス(*Rhizomucor pusillus*)、リゾプスアリズス(*Rhizopus arrhizus*)、リンコスפורウム属の一種(*Rhynchosporium* spp)、*S. アピオスペルムム*(*S. apiospermum*)及び*S. プロリフィカンス*(*S. proliferans*)を含むセドスפורウム属の一種(*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムポミ(*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニア属の一種(*Sclerotinia* spp)、スクレロチウム属の一種(*Sclerotium* spp)、*S. ノドルム*(*S. nodorum*)、*S. トリティシ*(*S. tritici*)を含むセプトリア属の一種(*Septoria* spp)、スファエロテカマクラリス(*Sphaerotheca macularis*)、スファエロテカフスカ(*Sphaerotheca fusca*) (スファエロテカフリギネア(*Sphaerotheca fuliginea*))、スポロトリクス属の一種(*Sporothrix* spp)、スタゴノスポラノドルム(*Stagonospora nodorum*)、ステムフィリウム属の一種(*Stemphylium* spp.)、ステレウムヒルスツム(*Stereum hirsutum*)、タナテホルスクメリス(*Thanatephorus cucumeris*)、チエラビオプシスバシコラ(*Thielaviopsis basicola*)、チレチア属の一種(*Tilletia* spp)、*T. ハルジアヌム*(*T. harzianum*)、*T. シュードコニンギイ*(*T. pseudokoningii*)、*T. ヴィリデ*

10

20

30

40

50

(*T. viride*) を含むトリコデルマ属の一種 (*Trichoderma* spp.)、トリコフィトン属の一種 (*Trichophyton* spp.)、チフラ属の一種 (*Typhula* spp.)、ウンシヌラネカトル (*Uncinula necator*)、ウロシスチス (*Urocystis* spp.)、ウスチラゴ属の一種 (*Ustilago* spp.)、*V. inaequalis* を含むベンチュリア属の一種 (*Venturia* spp.)、ベルチシリウム属の一種 (*Verticillium* spp.) 及びキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp.)。

【0103】

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

10

【0104】

本発明の範囲内においては、保護されるべき標的作物及び/又は有用な植物は、典型的には、例えばブラックベリー、ブルーベリー、クランベリー、ラズベリー及びイチゴといった液果植物；例えばオオムギ、トウモロコシ (コーン)、キビ、カラスムギ、イネ、ライ麦、モロコシ属 (*sorghum*) ライコムギ及びコムギといった穀類；例えば綿、亜麻、アサ、ジュート及びサイザルといった繊維植物；例えば糖質及び飼料ビート、コーヒー、ホップ、マスタード、アブラナ (カノーラ)、ケシ、サトウキビ、ヒマワリ、チャ及びタバコといった農作物；例えばリンゴ、アンズ、アボカド、バナナ、サクランボ、柑橘類、ネクタリン、モモ、セイヨウナシ及びセイヨウスモモといった果樹；例えばバミューダグラス、イチゴツナギ、ベントグラス、センチピードグラス、ウシノケグサ、ライグラス、アメリカシバ及びノシバといった草；バジル、ルリジサ、チャイブ、コリアンダー、ラベンダー、ラベージ、ミント、オレガノ、パセリ、ローズマリー、セージ及びタイムなどのハーブ；例えばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ及びダイズ、インゲンマメといったマメ科植物；例えばアーモンド、カシュー、落花生、ヘーゼルナッツ、ピーナッツ、ペカン、ピスタチオ及びクルミといった堅果；例えばアブラヤシといったヤシ；例えば花、低木及び高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブ及びゴムといった他の高木；例えばアスパラガス、ナス、ブロッコリ、キャベツ、ニンジン、キュウリ、ニンニク、レタス、ペポカボチャ、メロン、オクラ、タマネギ、コショウ、ジャガイモ、カボチャ、ダイオウ、ハウレンソウ及びトマトといった野菜；並びに、例えばブドウといったつる植物などの多年生及び1年生作物を含む。

20

30

【0105】

「有用な植物」という用語は、従来の交配又は遺伝子操作方法によって、プロモキシニルのような除草剤、又は、ある分類の除草剤 (例えば、HPPD 抑制剤、ALS 抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロン及びトリフロキシスルフロン、EPSPS (5-エノール-ピロピル-シキメート-3-リン酸塩-シターゼ) 抑制剤、GS (グルタミンシンターゼ) 抑制剤又はPPO (プロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ) 抑制剤など) に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来の交配方法 (突然変異誘発) によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield (登録商標) 夏ナタネ (カノーラ) である。遺伝子操作方法によって除草剤又はあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名Roundup Ready (登録商標)、Hercules I (登録商標) 及びLiberty Link (登録商標) で市販されているグリホサート-及びグルホシネート-耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

40

【0106】

「有用な植物」という用語は、トキシン-産生バクテリア、特にバチルス属 (*Bacillus*) の由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を有する、組換えDNA技術を用いることで形質転換された有用な植物を含むとも理解されるべきである。

【0107】

このような植物の例は、Yield Guard (登録商標) (CryIA(b) トキシン

50

を発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Root worm (登録商標) (Cry I I I B (b 1) トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Plus (登録商標) (Cry I A (b) 及びCry I I I B (b 1) トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Star link (登録商標) (Cry 9 (c) トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Herculex I (登録商標) (Cry I F (a 2) トキシン及び酵素ホスフィノトリシンN - アセチルトランスフェラーゼ (P A T) を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種) ; NuCOTN 33B (登録商標) (Cry I A (c) トキシンを発現する綿品種) ; Bollgard I (登録商標) (Cry I A (c) トキシンを発現する綿品種) ; Bollgard II (登録商標) (Cry I A (c) 及びCry I I A (b) トキシンを発現する綿品種) ; V I P C O T (登録商標) (V I P トキシンを発現する綿品種) ; New Leaf (登録商標) (Cry I I I A トキシンを発現するジャガイモ品種) ; Nature Gard (登録商標) Agrisure (登録商標) G T Advantage (G A 2 1 グリホサート - 耐性形質) 、 Agrisure (登録商標) C B Advantage (B t 1 1 コーン穿孔性害虫 (C B) 形質) 、 Agrisure (登録商標) R W (コーンルートワーム形質) 及びProtecta (登録商標) である。

10

20

30

40

50

【0108】

「作物」という用語は、例えば、トキシン - 産生バクテリア、特にバチルス属 (Bacillus) のバクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を有するよう、組換えDNA技術を用いることで形質転換された作物植物も含むと理解されるべきである。

【0109】

かかる形質転換植物によって発現されることが可能であるトキシンとしては、例えば、セレウス菌 (Bacillus cereus) 又はバチルスポピリエ (Bacillus popilliae) 由来の殺虫性タンパク質；又は、例えばCry 1 A b、Cry 1 A c、Cry 1 F、Cry 1 F a 2、Cry 2 A b、Cry 3 A、Cry 3 B b 1 若しくはCry 9 Cといった - エンドトキシンなどのバチルスチューリングエンシス (Bacillus thuringiensis) 由来の殺虫性タンパク質、又は、例えばVip 1、Vip 2、Vip 3 若しくはVip 3 Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip) ；又は、フォトラブダスルミネセンス (Photobacterium luminescens)、ゼノラブダスネマトフィルス (Xenorhabdus nematophilus) などの、例えばフォトラブダス属の一種 (Photobacterium spp.) 若しくはゼノラブダス属の一種 (Xenorhabdus spp.) といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質；サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ (wasps) トキシン及び他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン；ストレプトミセス (Streptomyces) トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチン又はマツユキソウレクチンなどの植物レクチン；アグルチニン；トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パパイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤；リシン、トウモロコシ - R I P、アブリン、ルフイン、サボリン又はブリオジンなどのリボソーム - 不活性化タンパク質 (R I P) ；3 - ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド - U D P - グリコシル - トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン抑制剤、H M G - C O A - レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウム又はカルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

【0110】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry 1 A b、Cry 1 A c、Cry 1 F、Cry 1 F a 2、Cry 2 A b、Cry 3 A、Cry 3 B b 1 若しくはCry 9 Cといった - エンドトキシン、又は、例えばVip 1、Vip 2、Vip 3 若しくはVip 3 A

といった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip) とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシン及び修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される (例えば、国際公開第02/15701号を参照のこと)。例えば切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、Cry3A055の場合には、カテプシン-G-認識配列がCry3Aトキシンに挿入される (国際公開第03/018810号を参照のこと)。

【0111】

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

【0112】

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

【0113】

形質転換植物に含有されるトキシンは、有害な昆虫に対する耐性を植物に付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれかのものであることが可能であるが、特に、甲虫 (鞘翅目)、双翅昆虫 (双翅目) 及び蝶 (鱗翅目) に通例見出される。

【0114】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含有する形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は: YieldGard (登録商標) (Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Rootworm (登録商標) (Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Plus (登録商標) (Cry1Ab及びCry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Starlink (登録商標) (Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種); Herculex I (登録商標) (Cry1Fa2トキシン及び酵素ホスフィトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種); NuCOTN 33B (登録商標) (Cry1Acトキシンを発現する綿品種); Bollgard I (登録商標) (Cry1Acトキシンを発現する綿品種); Bollgard II (登録商標) (Cry1Ac及びCry2Abトキシンを発現する綿品種); VipCot (登録商標) (Vip3A及びCry1Abトキシンを発現する綿品種); NewLeaf (登録商標) (Cry3Aトキシンを発現するジャガイモ品種); NatureGard (登録商標)、Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート-耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11コーン穿孔性害虫 (CB) 形質) 及びProtecta (登録商標) である。

【0115】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである:

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 Bt11 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。切断型 Cry1Ab トキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (Ostrinia nubi

10

20

30

40

50

lalis)及びセサミアノグリオイデス(Sesamia nonagrioides)に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ(Zea mays)。Bt11トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

【0116】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France製Bt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Abトキシンのトランスジェニック発現によって、アワノメイガ(ヨーロッパアワノメイガ(Ostrinia nubilalis)及びセサミアノグリオイデス(Sesamia nonagrioides)に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ(Zea mays)。Bt176トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

10

【0117】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France製MIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。修飾Cry3Aトキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテプシン-Gタンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾されたCry3A055である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第03/018810号に記載されている。

20

【0118】

4. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製MON863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON863は、Cry3Bb1トキシンを発現し、一定の鞘翅目昆虫に対する耐性を有する。

【0119】

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

30

【0120】

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

【0121】

7. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製NK603xMON810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子操作品種NK603及びMON810を交配させることによる従来交配型ハイブリッドトウモロコシ品種からなる。NK603xMON810トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種(Agrobacterium sp.)の菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSをトランスジェニック発現し、これにより、除草剤Roundup(登録商標)(グリホサートを含む)に対する耐性が付与され、また、バチルスチューリングエンシス(Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)から得られるCry1Abトキシンをトランスジェニック発現し、これにより、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

40

【0122】

式(I)の化合物を含む本発明に係る式(I)の化合物(化合物1.1~1.190の

50

いずれか1種など)は、植物病原性病、特に大豆植物に関して植物病原性真菌(ファコブソラパチリジ(*Phakopsora pachyrhizi*)などの)を駆除するか又は予防するのに使用され得る。

【0123】

特に、形質転換大豆植物は、トキシン、例えば、デルタ-エンドトキシン、例えばCry1Ac(Cry1Ac Btタンパク質)などの殺虫性タンパク質を発現する。従って、これには、イベントMON87701(米国特許第8,049,071号明細書並びに関連出願及び特許、並びに国際公開第2014/170327号(例えば、段落[008]Intacta RR2 PRO™大豆への言及を参照のこと)を参照のこと)、イベントMON87751(米国特許出願公開第2014/0373191号明細書)又はイベントDAS-81419(米国特許第8632978号明細書並びに関連出願及び特許)を含む形質転換大豆植物が挙げられ得る。

10

【0124】

他の形質転換大豆植物は、イベントSYHT0H2-HPPD耐性(米国特許出願公開第2014/0201860号明細書並びに関連出願及び特許)、イベントMON89788-グリホサート耐性(米国特許第7,632,985号明細書並びに関連出願及び特許)、イベントMON87708-ジカンバ耐性(米国特許出願公開第2011/0067134号明細書並びに関連出願及び特許)、イベントDP-356043-5-グリホサート及びALS耐性(米国特許出願公開第2010/0184079号明細書並びに関連出願及び特許)、イベントA2704-12-グルホシネート耐性(米国特許出願公開第2008/0320616号明細書並びに関連出願及び特許)、イベントDP-305423-1-ALS耐性(米国特許出願公開第2008/0312082号明細書並びに関連出願及び特許)、イベントA5547-127-グルホシネート耐性(米国特許出願公開第2008/0196127号明細書並びに関連出願及び特許)、イベントDAS-40278-9-2,4-ジクロロフェノキシ酢酸及びアリアルオキシフェノキシプロピオネートに対する耐性(国際公開第2011/022469号、国際公開第2011/022470号、国際公開第2011/022471号、並びに関連出願及び特許を参照のこと)、イベント127-ALS耐性(国際公開第2010/080829号並びに関連出願及び特許)、イベントGTS40-3-2-グリホサート耐性、イベントDAS-68416-4-2,4-ジクロロフェノキシ酢酸及びグルホシネート耐性、イベントFG72-グリホサート及びイソキサフルトール耐性、イベントBPS-CV127-9-ALS耐性及びGU262-グルホシネート耐性又はイベントSYHT04R-HPPD耐性を含んでもよい。

20

30

【0125】

特定の状況下で、本発明に係る式(I)の化合物は、植物病原性病、特に大豆植物(特に、上記のような形質転換大豆植物のいずれか)についての植物病原性真菌(ファコブソラパチリジ(*Phakopsora pachyrhizi*)などの)を駆除するか又は予防するのに使用される場合に、有効成分間の相乗的相互作用を示し得る。

【0126】

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

40

【0127】

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

【0128】

「植物繁殖体」という用語は、その増殖に用いられることが可能である種子などの植物の生殖部、及び、挿し木若しくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子(厳密な意味で)、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎及び植物の部分が挙げられ得る。発芽後若しくは土壌から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物

50

及び若芽もまた挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全又は部分的な処置によって保護されてもよい。好ましくは、「植物繁殖体」は種子を表すと理解される。

【0129】

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

10

【0130】

例えば農業に用いられる好適なキャリア及び補助剤は、固体又は液体であることが可能であり、配合技術において有用な物質であり、例えば天然若しくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダ又は肥料である。このようなキャリアは、例えば国際公開第97/33890号に記載されている。

【0131】

懸濁液濃縮物は、活性な化合物の微細な固体粒子が懸濁した水性配合物である。このような配合物は沈降防止剤及び分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤、並びに、消泡剤及び結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用においては、これらの濃縮物は水中で希釈され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。有効成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

20

【0132】

水和剤は、水又は他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された有効成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フーラー土、カオリンクレイ、シリカ及び他の易湿性の有機若しくは無機固形分が挙げられる。水和剤は通常、5%~95%の有効成分と少量の湿潤剤、分散剤又は乳化剤とを含有する。

【0133】

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

30

【0134】

粒状配合物は押出物及び比較的粗大な粒子の両方を含み、通常は、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウム及び他の有機若しくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常5%~25%の有効成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシン及び他の石油留分などの表面活性剤、若しくは、植物油；並びに、又は、デキストリン、膠若しくは合成樹脂などの展着剤を含んでいてもよい。

40

【0135】

50

粉剤は、有効成分と、分散剤及びキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末並びに他の有機及び無機固形分などの微細固形分との易流動性の混和物である。

【0136】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された有効成分の小滴又は顆粒である。カプセル化された小滴は、直径が典型的には1～50ミクロンである。内包された液体は典型的には、カプセルの重量の50～95%を構成し、活性な化合物に追加して溶剤を含んでいてもよい。カプセル化された顆粒は一般に、顆粒の孔部開口をシールして、液体形態の活性種を顆粒の孔部内に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル～1センチメートル、好ましくは1～2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押出し成形、凝塊若しくはプリルによって形成されるか、又は、天然のものである。このような材料の例は、パーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくず及び粒状炭素である。シェル又はメンブラン材料は、天然及び合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン及びデンプンゼンデートを含む。

10

【0137】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレン及び他の有機溶剤などの、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における有効成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って有効成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機もまた用いられ得る。

20

【0138】

上記の配合物タイプの本発明の組成物の配合に有用である好適な農業用補助剤及びキャリアは、当業者に周知である。

【0139】

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

30

40

50

ピレングリコール、グリセリン及びN - メチル - 2 - ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

【0140】

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

【0141】

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

10

20

【0142】

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

【0143】

さらに加えて、他の殺生性有効成分又は組成物を、本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法において用い、及び、本発明の組成物と同時に又は順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる有効成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、又は、例えば、噴霧タンク中で一緒に混合されてもよい。これらのさらなる殺生性有効成分は、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤及び/又は植物成長調節剤であり得る。

30

【0144】

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

40

【0145】

加えて、本発明の組成物はまた、1種以上の全身獲得抵抗性誘導物質(「SAR」誘導物質)と一緒に適用され得る。SAR誘導物質は公知であって、例えば米国特許第6,919,298号明細書に記載されており、例えば、サリチル酸塩及び市販されているSAR誘導物質であるアシベンゾラル - S - メチルが挙げられる。

【0146】

式(I)の化合物は通常農芸化学組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物に、さらなる化合物と同時に、又は、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料若しくは微量元素供与物、又は、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤若しくは非選択

50

的な除草剤、並びに、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であることが可能であり、又は、これらの調製物の数種の混合物であって、所望の場合には配合物の分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは適用促進補助剤を伴う混合物であることが可能である。

【0147】

式(I)の化合物は、有効成分として少なくとも1種の式(I)の化合物を含む、植物病原性微生物に対する防除若しくは保護のための(殺菌・殺カビ)組成物の形態で用いられ得、又は、遊離形態若しくは農芸化学的に使用可能な塩形態の本明細書に定義されている少なくとも1種の好ましい個別の化合物と、上記の補助剤の少なくとも1種との形態で用いられ得る。

10

【0148】

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

【0149】

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

20

【0150】

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

30

40

【0151】

好適な追加の有効成分の例としてはまた、以下が挙げられる：3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(9-ジクロロメチレン-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノ-ナフタレン-5-イル)-アミド、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸メトキシ-[1-メチル-2-(2,4,6-トリクロロフェニル)-エチル]-アミド、1-メチル-3-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(2-ジクロロメチレン-3-エチル-1-

50

メチル - インダン - 4 - イル) - アミド (1 0 7 2 9 5 7 - 7 1 - 1)、 1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (4 ' - メチルスルファニル - ビフェニル - 2 - イル) - アミド、 1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 4 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 [2 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチル - エチル] - アミド、 (5 - クロロ - 2 , 4 - ジメチル - ピリジン - 3 - イル) - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フェニル) - メタノン、 (5 - ブロモ - 4 - クロロ - 2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フェニル) - メタノン、 2 - { 2 - [(E) - 3 - (2 , 6 - ジクロロ - フェニル) - 1 - メチル - プロブ - 2 - エン - (E) - イリデンアミノオキシメチル] - フェニル } - 2 - [(Z) - メトキシイミノ] - N - メチル - アセトアミド、 3 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 , 3 - ジメチル - イソキサゾリン - 3 - イル] - ピリジン、 (E) - N - メチル - 2 - [2 - (2 , 5 - ジメチルフェノキシメチル)フェニル] - 2 - メトキシ - イミノアセトアミド、 4 - ブロモ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 6 - トリフルオロメチルベンズイミダゾール - 1 - スルホンアミド、 a - [N - (3 - クロロ - 2 , 6 - キシリル) - 2 - メトキシアセトアミド] - y - ブチロラクトン、 4 - クロロ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 5 - p - トリルイミダゾール - 1 - スルホンアミド、 N - アリル - 4 , 5 , - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフエン - 3 - カルボキサミド、 N - (1 - シアノ - 1 , 2 - ジメチルプロピル) - 2 - (2 , 4 - ジクロロフェノキシ)プロピオンアミド、 N - (2 - メトキシ - 5 - ピリジル) - シクロプロパンカルボキサミド、 (. + .) - c i s - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - シクロヘプタノール、 2 - (1 - t - ブチル) - 1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール、 2 ' , 6 ' - ジブロモ - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 ' - トリフルオロメチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、 1 - イミダゾリル - 1 - (4 ' - クロロフェノキシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - オン、 メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - シアノフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - チオアミドフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - フルオロフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 , 6 - ジフルオロフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 , 6 - ジフルオロフェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (ピリミジン - 2 - イルオキシ)フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (5 - メチルピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (フェニル - スルホニルオキシ)フェノキシ] フェニル - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (4 - ニトロフェノキシ)フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - フェノキシフェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジメチル - ベンゾイル)ピロール - 1 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - メトキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 [2 - (2 - フェニルエテン - 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジクロロフェノキシ)ピリジン - 3 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - (3 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ)フェノキシ)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - [3 - (- ヒドロキシベンジル)フェノキシ] フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - (4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオキシ)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - n - プロピルオキシ - フェノキシ)フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - イソプロピルオキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (2 - フルオロフェノキシ)フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル

10

20

30

40

50

(E) - 2 - [2 - (3 - エトキシフェノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (4 - t - ブチル - ピリジン - 2 - イルオキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (3 - シアノフェノキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [(3 - メチル - ピリジン - 2 - イルオキシメチル) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - メチル - フェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (5 - プロモ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - (3 - ヨードピリジン - 2 - イルオキシ) フェノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - クロロピリジン - 3 - イルオキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - [2 - (5 , 6 - ジメチルピラジン - 2 - イルメチルオキシミノメチル) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2 - [6 - (6 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル } - 3 - メトキシ - アクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - (3 - メトキシフェニル) メチルオキシミノメチル] - フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2 - (6 - (2 - アジドフェノキシ) - ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - [6 - フェニルピリミジン - 4 - イル) - メチルオキシミノメチル] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - [(4 - クロロフェニル) - メチルオキシミノメチル] - フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2 - [6 - (2 - n - プロピルフェノキシ) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 4 - イルオキシ] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - [(3 - ニトロフェニル) メチルオキシミノメチル] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、3 - クロロ - 7 - (2 - アザ - 2 , 7 , 7 - トリメチル - オクタ - 3 - エン - 5 - イン) 、 2 , 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、3 - ヨード - 2 - プロピニルアルコール、4 - クロロフェニル - 3 - ヨードプロパルギルホルマル、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロピニルエチルカルバメート、2 , 3 , 3 - トリヨードアリルアルコール、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロピニルアルコール、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ブチルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ヘキシルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルシクロヘキシル - カルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルフェニルカルバメート ; トリプロモフェノール、テトラクロロフェノール、3 - メチル - 4 - クロロフェノール、3 , 5 - ジメチル - 4 - クロロフェノール、フェノキシエタノール、ジクロロフェン、o - フェニルフェノール、m - フェニルフェノール、p - フェニルフェノール、2 - ベンジル - 4 - クロロフェノール、5 - ヒドロキシ - 2 (5 H) - フラノンなどのフェノール ; 4 , 5 - ジクロロジチアゾリノン、4 , 5 - ベンゾジチアゾリノン、4 , 5 - トリメチレンジチアゾリノン、4 , 5 - ジクロロ - (3 H) - 1 , 2 - ジチオール - 3 - オン、3 , 5 - ジメチル - テトラヒドロ - 1 , 3 , 5 - チアジアジン - 2 - チオン、N - (2 - p - クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリド、アシベンゾラル、アシペタックス、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジモルフ、アリシン、アリルアルコール、アメトクトラジン、アミスルプロム、アモバム、アンブロピルホス、アニラジン、アソメート、オーレオファンギン、アザコナゾール、アザフェンジン、アジチラム、アゾキシストロピン、バリウムポリスルフィド、ベナラキシル、ベナラキシル - M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントアルロン、ベンチアバリカルブ、ベンチアゾール、塩化ベンザルコニウム、ベンザマクリル、ベンザモルフ、ベンゾヒドロキサム酸、ベンゾピンジフルピル、ベルベリン、ベトキサジン、ピロキサゾール、ピナパクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、ピキサフェン、プラストサイジン - S、ボスカリド、プロモタロニル、プロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、ブチルアミン多硫酸カルシウム、カプタホール、キャプタン、カルバモルフ、カルベンダジム、カルベンダジムクロリドレート、カルボキシ、カルプロバミド、カルボン

10

20

30

40

50

、CGA41396、CGA41397、キノメチオネート、キトサン、クロベンチアゾ
ン、クロラニホルメタン、クロラニル、クロルフエナゾール、クロロネブ、クロルピクリ
ン、クロロタロニル、クロロゾリネート、クロゾリネート、クリンバゾール、クロトリマ
ゾール、クロジラコン、酢酸銅、炭酸銅、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキ
シ塩化銅、オキシキノリン酸銅、ケイ酸銅、硫酸銅、タル油酸銅、クロム酸銅亜鉛及びボ
ルドー液などの銅含有化合物、クレゾール、クフラエブ、クプロバム、酸化第一銅、シア
ゾファミド、シクラフラミド、シクロヘキシミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シ
ペンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、デカフェン
チン、デヒドロ酢酸、ジ-2-ピリジルジスルフィド1,1'-ジオキシド、ジクロフル
アニド、ジクロメジン、ジクロン、ジクロラン、ジクロロフェン、ジクロゾリン、ジクロ
ブトラゾール、ジクロシメット、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾ
コート、ジフルメトリム、O-ジ-イソ-プロピル-S-ベンジルチオホスフェート、ジ
メフルアゾール、ジメタクロン、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモール、ジ
ニコナゾール、ジニコナゾール-M、ジノブトン、ジノカップ、ジノクトン、ジノペント
ン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジスルフィラム、
ジタリムホス、ジチアノン、ジチオエーテル、ドデシルジメチル塩化アンモニウム、ドデ
モルフ、ドジチン、ドジン、ドグアジン、ドラゾキシロン、エディフェンホス、エネスト
ロプリン、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモール
、エトキシキン、エチリシン、エチル(Z)-N-ベンジル-N([メチル(メチル-チ
オエチリデンアミノ-オキシカルボニル)アミノ]チオ)-アラニナト、エトリジア
ゾール、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェナリ
モル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェノ
キサニル、フェンピクロニル、フェンピコキサミド、フェンプロピジン、フェンプロピモ
ルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキシド、フェ
ルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキシニル、フルメトベル(flumet
over)、フルモルフ、フルピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フルトリマゾ
ール、フルオキサストロピン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド
、フルタニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、ホル
ムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメトビル、フルカルバ
ニル、フルコナゾール、ルフラール、フルメシクロックス、フロファネート、グリオジン
、グリセオフラビン、グアザチン、ハラクリネート、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサクロ
ロブタジエン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキシルチオホス、ヒドラルガ
フェン、ヒドロキシイソキサゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、イ
ミベンコナゾール、イミノクタジン、三酢酸イミノクタジン、イネジン、ヨードカルブ、
イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプ
ロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、イソピラザム、
イソチアニル、イソパレジオン、イゾパムホス、カスガマイシン、クレソキシム-メチル
、LY186054、LY211795、LY248908、マンコゼブ、マンジプロバ
ミド、マンネブ、メベニル、メカルピンジド、メフェノキサム、メフェントリフルコナゾ
ール、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、塩化第一水銀、メブチルジノカップ、
メタラキシル、メタラキシル-M、メタム、メタゾキシロン、メトコナゾール、メタスル
ホカルブ、メタフロキサム、臭化メチル、ヨウ化メチル、メチルイソチオシアネート、メ
チラム、メチラム-亜鉛、メトミノストロピン、メトラフェノン、メツルホバクス、ミル
ネブ、モロキシジン、マイクロブタニル、マイクロゾリン、ナーバム、ナタミシン、ネオアソ
ジン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロスチレン、ニトロタル-イソ-プロ
ピル、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、有機水銀化合物、オリザストロピン、オ
ストール、オキサジキシル、オキサスルフロン、オキシニン銅、オキシソリン酸、オクスボ
コナゾール、オキシカルボキシニル、パリーノール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシ
クロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンチオピラド、フェナマクリル、
フェナジンオキシド、ホスジフェン、ホセチル-A1、リン酸、フタリド、ピコキシスト

10

20

30

40

50

ロビン、ピペラリン、ポリカルバメート、ポリオキシシロキサン、ポリオキシリム、ポリラム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロバミジン、プロバモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフルメトフェン、ピラカルボリド、ピラクロストロビン、ピラメトロストロビン、ピラオキシストロビン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリジニトリル、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピロキロン、ピロキシクロール、ピロキシフル、ピロールニトリン、第4級アンモニウム化合物、キナセトール、キナザミド、キンコナゾール、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、ラベンザゾール、サントニン、セダキサ、シルチオファミン、シメコナゾール、シブコナゾール、5塩化石炭酸ナトリウム、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、スルトロペン、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン、チフルザミド、2-(チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオファネート-メチル、チオキノックス、チラム、チアジニル、チミベンコナゾール、チオキサミド、トルコホス-メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアミホス、トリアリモル、トリアズブチル、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルマゾール、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウルバシド、バリダマイシン、バリフェナレート、パバム、ピンクロゾリン、ザリルアミド、ジネブ、ジラム、及びゾキサミド。

10

20

【0152】

本発明の化合物はまた、駆虫薬薬剤との組み合わせで用いられ得る。このような駆虫薬としては、欧州特許第357460号明細書、欧州特許第444964号明細書及び欧州特許第594291号明細書に記載されているとおり、イベルメクチン、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エピリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチン及びミルベマイシン誘導体などの化合物の大環式ラクトンクラスから選択される化合物が挙げられる。追加の駆虫薬としては、米国特許第5015630号明細書、国際公開第9415944号及び国際公開第9522552号に記載されているものなどの半合成及び生合成アベルメクチン/ミルベマイシン誘導体が挙げられる。追加の駆虫薬としては、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オキシフェンダゾール、オキシベンダゾール、パルベンダゾール、及び、このクラスの他の構成要素などのベンズイミダゾールが挙げられる。追加の駆虫薬としては、イミダゾチアゾール、及び、テトラミゾール、レバミゾール、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、オキサニル又はモランテルなどのテトラヒドロピリミジンが挙げられる。追加の駆虫薬としては、トリクラベンダゾール及びクロルスロンなどのフルキシド、並びに、プラジカンテル及びエブシプランテルなどのセストサイド (cestocide) が挙げられる。

30

40

【0153】

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

【0154】

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

【0155】

50

本発明の化合物は、他の外寄生生物撲滅薬；例えば、フィプロニル；ピレスロイド；有機リン酸エステル；ルフェヌロンなどの昆虫成長調節剤；テブフェノジド等などのエクジソンアゴニスト；イミダクロプリド等などのネオニコチノイドとの組み合わせで用いられ得る。

【0156】

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

【0157】

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

有機リン酸エステル：アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、プロモホス、プロモホス - エチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、デメトン、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファンファー、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、フォノホス、ホルモチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イサゾホス、イソチオエート、イソキサチオン、マラチオン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチル - パラチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン - メチル、パラオキソン、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロパホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダベンチオン、キナルホス、スルプロホス、テメホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルピンホス、チメトン (t h i m e t o n)、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン。

【0158】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - s e c - ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、フェンチオカルブ、フラチオカルブ、H C N - 8 0 1、イソプロカルブ、インドキサカルブ、メチオカルブ、メソミル、5 - メチル - m - クメニルブチリル (メチル) カルバメート、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、U C - 5 1 7 1 7。

【0159】

ピレスロイド：アクリナチン (a c r i n a t h i n)、アレトリン、アルファメトリン (a l p h a m e t r i n)、5 - ベンジル - 3 - フリルメチル (E) - (1 R) - シス - 2 , 2 - ジメチル - 3 - (2 - オキソチオラン - 3 - イリデンメチル) シクロプロパンカルボキシレート、ピフェントリン、 - シフルトリン、シフルトリン、 - シペルメトリン、 - シペルメトリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン ((S) - シクロペンチル異性体)、ピオレスメトリン、ピフェントリン、N C I - 8 5 1 9 3、シクロプロトリン、シハロトリン、シチトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エムペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート (D 異性体)、イミプロトリン、シハロトリン、 - シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン (天然生成物)、レスメスリン、テトラメトリン、トランスフルトリン、 - シペルメトリン、シラフルオフエン、t - フルバリネート、テフルトリン、トラロメトリン、 - シペルメトリン。

【0160】

節足動物成長調節剤：a) キチン合成抑制剤：ベンゾイル尿素：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルアズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフ

10

20

30

40

50

ルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、プロロフェジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロルフェンタジン；b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；c) ジュベノイド：ピリプロキシフェン、メトプレン（S-メトプレンを含む）、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成抑制剤：スピロジクロフェン。

【0161】

他の抗寄生虫薬：アセキノシル、アミトラズ、AKD-1022、ANS-118、アザジラクチン、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、ベンサルタップ、ピフェナゼート、ピナパクリル、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、カンフェクロル、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナピル、クロマフェノジド、クロチアニジン (*clothianidine*)、シロマジン、ジアクロデン、ジアフェンチウロン、DBI-3204、ジナクチン、ジヒドロキシメチルジヒドロキシピロリジン、ジノプトン、ジノカップ、エンドスルファン、エチプロール、エトフェンプロクス、フェナザキン、フルマイト、MTI-800、フェンピロキシメート、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルフェンジン、フルフェンプロックス、フルプロキシフェン、ハロフェンプロックス (*halofenprox*)、ヒドラメチルノン、IKI-220、カネマイト、NC-196、ニームガード、ニジノルテルフラン、ニテンピラム、SD-35651、WL-108477、ピリダリル、プロバルギット、プロトリフェンプト、ピメトロジン (*pymethrozine*)、ピリダベン、ピリミジフェン、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、シラフルオフエン、シロマジン、スピノサド、テブフェンピラド、テトラジホン、テトラナクチン (*tetranactin*)、チアクロプリド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラド、トリアザメート、トリエトキシスピノシン、トリナクチン、ベルブチン、ベルタレク、YI-5301。

10

20

【0162】

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

30

【0163】

殺菌剤：クロルテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、ストレプトマイシン。

【0164】

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

【0165】

式(I)の化合物と有効成分との以下の混合物が好ましい。略記「TX」は、表1.1~1.3、及び2.1~2.2(以下)に示す化合物、又は表T1に記載の化合物1.1~1.190、(以下)に記載の化合物からなる群から選択される1種の化合物を意味する。

40

石油(代替名)(628)+TXからなる物質の群から選択される補助剤、
1,1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール(IUPAC名)(910)+TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1059)+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセトアミド(IUPAC名)(1295)+TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン(IUPAC名)(981)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセキノシル(3)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アルジカルブ(

50

16) + TX、アルドキシカルブ(863) + TX、 - シペルメトリン(202) + TX、
 X、アミジチオン(870) + TX、アミドフルメト[CCN] + TX、アミドチオエー
 ト(872) + TX、アミトン(875) + TX、シュウ酸水素アミトン(875) + TX
 X、アミトラズ(24) + TX、アラマイト(881) + TX、三酸化ヒ素(882) +
 TX、AVI 382(化合物コード) + TX、AZ 60541(化合物コード) + TX
 X、アジンホス - エチル(44) + TX、アジンホス - メチル(45) + TX、アゾベン
 ゼン(IUPAC名)(888) + TX、アゾシクロチン(46) + TX、アゾトエート
 (889) + TX、ベノミル(62) + TX、ベノキサホス(代替名)[CCN] + TX
 X、ベンゾキシメート(71) + TX、ベンジル安息香酸塩(IUPAC名)[CCN] +
 TX、ピフェナゼート(74) + TX、ピフェントリン(76) + TX、ピナバクリル(10
 907) + TX、プロフェンパレレート(代替名) + TX、プロモシクレン(918) +
 TX、プロモホス(920) + TX、プロモホス - エチル(921) + TX、プロモプロ
 ピレート(94) + TX、プロロフェジン(99) + TX、プトカルボキシム(103)
 + TX、プトキシカルボキシム(104) + TX、プチルピリダベン(代替名) + TX、
 多硫化カルシウム(IUPAC名)(111) + TX、カンフェクロル(941) + TX
 X、カーボレート(943) + TX、カルパリル(115) + TX、カルボフラン(11
 8) + TX、カルボフェノチオン(947) + TX、CGA 50'439(開発コード
)(125) + TX、チノメチオナート(126) + TX、クロルベンシド(959) +
 TX、クロルジメホルム(964) + TX、クロルジメホルム塩酸塩(964) + TX、
 クロルフェナピル(130) + TX、クロルフェネトール(968) + TX、クロルフェ 20
 ンソン(970) + TX、クロルフェンスルフィド(971) + TX、クロルフェンピ
 ン(131) + TX、クロロベンジラート(975) + TX、クロロメブホルム(97
 7) + TX、クロロメチウロン(978) + TX、クロロプロピレート(983) + TX
 X、クロルピリホス(145) + TX、クロルピリホス - メチル(146) + TX、クロル
 チオホス(994) + TX、シネリンI(696) + TX、シネリンII(696) + TX
 X、シネリン(696) + TX、クロフェンテジン(158) + TX、クロサンテル(代
 替名)[CCN] + TX、クマホス(174) + TX、クロタミトン(代替名)[CCN
] + TX、クロトキシホス(1010) + TX、クフラネブ(1013) + TX、シアン
 トエート(1020) + TX、シフルメトフェン(CAS登録番号:400882-07
 -7) + TX、シハロトリン(196) + TX、シヘキサチン(199) + TX、シペル 30
 メトリン(201) + TX、DCPM(1032) + TX、DDT(219) + TX、デ
 メフィオン(1037) + TX、デメフィオン - O(1037) + TX、デメフィオン -
 S(1037) + TX、デメトン(1038) + TX、デメトン - メチル(224) + TX
 X、デメトン - O(1038) + TX、デメトン - O - メチル(224) + TX、デメト
 ン - S(1038) + TX、デメトン - S - メチル(224) + TX、デメトン - S - メ
 チルスルホン(1039) + TX、ジアフェンチウロン(226) + TX、ジアリホス(40
 1042) + TX、ダイアジノン(227) + TX、ジクロフルアニド(230) + TX
 X、ジクロルボス(236) + TX、ジクリホス(代替名) + TX、ジコホル(242) +
 TX、ジクロトホス(243) + TX、ジエノクロル(1071) + TX、ジメホックス
 (1081) + TX、ジメトエート(262) + TX、ジナクチン(代替名)(653)
 + TX、ジネクス(1089) + TX、ジネクスジクレキシ(1089) + TX、ジノ
 プトン(269) + TX、ジノカップ(270) + TX、ジノカップ - 4[CCN] + TX
 X、ジノカップ - 6[CCN] + TX、ジノクトン(1090) + TX、ジノペントン(40
 1092) + TX、ジノスルホン(1097) + TX、ジノテルボン(1098) + TX
 X、ジオキサチオン(1102) + TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(1103
) + TX、ジスルフィラム(代替名)[CCN] + TX、ジスルホトン(278) + TX
 X、DNOC(282) + TX、ドフェナピン(1113) + TX、ドラメクチン(代替名
) [CCN] + TX、エンドスルファン(294) + TX、エンドチオン(1121) +
 TX、EPN(297) + TX、エプリノメクチン(代替名)[CCN] + TX、エチオ
 ン(309) + TX、エトエートメチル(1134) + TX、エトキサゾール(320) 50

+ TX、エトリムホス(1142)+TX、フェナザフロル(1147)+TX、フェナザキン(328)+TX、酸化フェンブタズ(330)+TX、フェノチオカルブ(337)+TX、フェンプロパトリン(342)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンピロキシメート(345)+TX、フェンソン(1157)+TX、フェントリファニル(1161)+TX、フェンバレート(349)+TX、フィプロニル(354)+TX、フルアクリピリム(360)+TX、フルアズロン(1166)+TX、フルベンジミン(1167)+TX、フルシクロクスロン(366)+TX、フルシトリネート(367)+TX、フルエネチル(1169)+TX、フルフェノクスロン(370)+TX、フルメトリン(372)+TX、フルオルベンシド(1174)+TX、フルバリネート(1184)+TX、FMC 1137(開発コード)(1185)+TX、ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネート塩酸塩(405)+TX、ホルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、-HCH(430)+TX、グリオジン(1205)+TX、ハルフェンプロックス(424)+TX、ヘプテノホス(432)+TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1216)+TX、ヘキシチアゾクス(441)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イソカルボホス(代替名)(473)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ジャスモリンI(696)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ヨードフェンホス(1248)+TX、リンダン(430)+TX、ルフェヌロン(490)+TX、マラチオン(492)+TX、マロノベン(1254)+TX、メカルバム(502)+TX、メホスホラン(1261)+TX、メスルフェン(代替名)[CCN]+TX、メタクリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メソミル(531)+TX、臭化メチル(537)+TX、メトルカルブ(550)+TX、メピンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホックス(1293)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、NC-512(化合物コード)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニコマイシン(代替名)[CCN]+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラチオン(615)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホキシム(642)+TX、ピリミホス-メチル(652)+TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347)+TX、ポリナクチン(代替名)(653)+TX、プロクロノール(1350)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロマシル(1354)+TX、プロパルギット(671)+TX、プロペタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロトエート(1362)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、キナルホス(711)+TX、キンチオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、RA-17(開発コード)(1383)+TX、ロテノン(722)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、ソファミド(1402)+TX、スピロジク

10

20

30

40

50

ロフェン(738)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、SSI-121(開発コード)(1404)+TX、スルフィラム(代替名)[CCN]+TX、スルフルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、硫黄(754)+TX、SZI-121(開発コード)(757)+TX、-フルバリネート(398)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、TEPP(1417)+TX、テルバム(代替名)+TX、テトラクロルピンホス(777)+TX、テトラジホン(786)+TX、テトラナクチン(代替名)(653)+TX、テトラスル(1425)+TX、チアフェノックス(代替名)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオファノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオキノックス(1436)+TX、ツリンギエンシン(代替名)[CCN]+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアラテン(1443)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリクロルホン(824)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリアクチン(代替名)(653)+TX、パミドチオン(847)+TX、パニリプロール[CCN]及びYI-5302(化合物コード)+TXからなる物質の群から選択される殺ダニ剤、

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

アバメクチン(1)+TX、クルホメート(1011)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エブリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ピペラジン[CCN]+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、スピノサド(737)及びチオファネート(1435)+TXからなる物質の群から選択される駆虫薬、

クロラロース(127)+TX、エンドリン(1122)+TX、フェンチオン(346)+TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)及びストリキニーネ(745)+TXからなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン(IUPAC名)(1222)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、8-ヒドロキシキノリン硫酸塩(446)+TX、プロノポール(97)+TX、ニオクタン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、水酸化銅(IUPAC名)(169)+TX、クレゾール[CCN]+TX、ジクロロフェン(232)+TX、ジピリチオン(1105)+TX、ドジシン(1112)+TX、フェナミノスルフ(1144)+TX、ホルムアルデヒド(404)+TX、ヒドラルガフェン(代替名)[CCN]+TX、カスガマイシン(483)+TX、カスガマイシン塩酸塩水和物(483)+TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308)+TX、ニトラピリン(580)+TX、オクチリノン(590)+TX、オキシリン酸(606)+TX、オキシテトラサイクリン(611)+TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩(446)+TX、プロベナゾール(658)+TX、ストレプトマイシン(744)+TX、ストレプトマイシンセスキ硫酸塩(744)+TX、テクロフタラム(766)+TX、及びチオメルサル(代替名)[CCN]+TXからなる物質の群から選択される殺菌剤、

リンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana)GV(代替名)(12)+TX、アグロバクテリウムラジオバクター(Agrobacterium radiobacter)(代替名)(13)+TX、アムプリセイウス属(Amblyseius spp.)(代替名)(19)+TX、アナグラファファルシフェラ(Anagrap

10

20

30

40

50

ha falci fera) NPV (代替名) (28) + TX、アングルスアトムス (*Anagrus atomus*) (代替名) (29) + TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) (代替名) (33) + TX、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) + TX、シヨクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代替名) (35) + TX、オートグラファカリホルニカ (*Autographa californica*) NPV (代替名) (38) + TX、パチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) (代替名) (48) + TX、パチルススファエリクスネイデ (*Bacillus sphaericus Neide*) (学名) (49) + TX、パチルスチューリングゲンシスベルリナー (*Bacillus thuringiensis Berliner*) (学名) (51) + TX、パチルスチューリングゲンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*) (学名) (51) + TX、パチルスチューリングゲンシス亜種イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*) (学名) (51) + TX、パチルスチューリングゲンシス亜種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*) (学名) (51) + TX、パチルスチューリングゲンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) (学名) (51) + TX、パチルスチューリングゲンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ボーベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ボーベリアブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオヒメテントウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリング (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) 及び H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アクリズム (*Metarhizium anisopliae var. acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae var. anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンテイ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属 (*Orius spp.*) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイネルネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマカルボカブサエ (*Steinernema c*

10

20

30

40

50

ar p o c a p s a e) (代 替 名) (7 4 2) + T X、ステイネルネマフェルチアエ (S
 t e i n e r n e m a f e l t i a e) (代 替 名) (7 4 2) + T X、ステイネルネマ
 グラセリ (S t e i n e r n e m a g l a s e r i) (代 替 名) (7 4 2) + T X、ス
 テイネルネマリオブラベ (S t e i n e r n e m a r i o b r a v e) (代 替 名) (7
 4 2) + T X、ステイネルネマリオブラビス (S t e i n e r n e m a r i o b r a v
 i s) (代 替 名) (7 4 2) + T X、ステイネルネマスカプテリスキ (S t e i n e r n
 e m a s c a p t e r i s c i) (代 替 名) (7 4 2) + T X、ステイネルネマ属 (S
 t e i n e r n e m a s p p .) (代 替 名) (7 4 2) + T X、トリコグラマ属 (T r
 i c h o g r a m m a s p p .) (代 替 名) (8 2 6) + T X、チフロドロムスオクシ
 デンタリス (T y p h l o d r o m u s o c c i d e n t a l i s) (代 替 名) (8 4
 4) 及びベルチシリウムレカニイ (V e r t i c i l l i u m l e c a n i i) (代 替
 名) (8 4 8) + T X、枯草菌変種アミロリケファシエンス (B a c i l l u s s u b
 t i l i s v a r . a m y l o l i q u e f a c i e n s) 菌株 F Z B 2 4 (N o v o
 z y m e s B i o l o g i c a l s I n c . (5 4 0 0 C o r p o r a t e C i
 r c l e , S a l e m , V A 2 4 1 5 3 , U . S . A .) から入手可能、商標 T a e g
 r o (登 録 商 標) で知られている) + T X からなる物質の群から選択される生物剤、
 ヨードメタン (I U P A C 名) (5 4 2) 及び臭化メチル (5 3 7) + T X からなる物質
 の群から選択される土壌滅菌剤、
 アホレート [C C N] + T X、ピサジル (代 替 名) [C C N] + T X、ブスルファン (代
 替 名) [C C N] + T X、ジフルベンズロン (2 5 0) + T X、ジマチフ (代 替 名) [C
 C N] + T X、ヘメル [C C N] + T X、ヘムパ [C C N] + T X、メテパ [C C N] +
 T X、メチオテパ [C C N] + T X、メチルアホレート [C C N] + T X、モルジド [C
 C N] + T X、ペンフルロン (代 替 名) [C C N] + T X、テパ [C C N] + T X、チオ
 ヘンパ (代 替 名) [C C N] + T X、チオテパ (代 替 名) [C C N] + T X、トレタミン
 (代 替 名) [C C N] 及びウレデパ (代 替 名) [C C N] + T X からなる物質の群から選
 択される不妊化剤、
 (E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートを伴う (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オー
 ル (I U P A C 名) (2 2 2) + T X、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテ
 ー ト (I U P A C 名) (8 2 9) + T X、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オー
 ル (I U P A C 名) (5 4 1) + T X、(E , Z) - テトラデカ - 4 , 1 0 - ジエン - 1
 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 7 9) + T X、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1
 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 5) + T X、(Z) - ヘキサデカ - 1 1 - エナー
 ル (I U P A C 名) (4 3 6) + T X、(Z) - ヘキサデカ - 1 1 - エン - 1 - イルアセ
 テー ト (I U P A C 名) (4 3 7) + T X、(Z) - ヘキサデカ - 1 3 - エン - 1 1 - イ
 ン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (4 3 8) + T X、(Z) - イコス - 1 3 - エ
 ン - 1 0 - オン (I U P A C 名) (4 4 8) + T X、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1
 - アール (I U P A C 名) (7 8 2) + T X、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オー
 ル (I U P A C 名) (7 8 3) + T X、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテ
 ー ト (I U P A C 名) (7 8 4) + T X、(7 E , 9 Z) - ドデカ - 7 , 9 - ジエン - 1
 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 3) + T X、(9 Z , 1 1 E) - テトラデカ -
 9 , 1 1 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 8 0) + T X、(9 Z , 1
 2 E) - テトラデカ - 9 , 1 2 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 8 1
) + T X、1 4 - メチルオクタデカ - 1 - エン (I U P A C 名) (5 4 5) + T X、4 -
 メチルノナン - 5 - オールを伴う 4 - メチルノナン - 5 - オン (I U P A C 名) (5 4 4
) + T X、 - マルチストリアチン (代 替 名) [C C N] + T X、プレビコミン (代 替 名
) [C C N] + T X、コドレルア (代 替 名) [C C N] + T X、コドレモン (代 替 名) (1
 6 7) + T X、キュウルア (代 替 名) (1 7 9) + T X、ディスパールア (2 7 7) +
 T X、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 6) + T X、ドデ
 カ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 7) + T X、ドデカ - 8 + T
 X、1 0 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 4) + T X、ドミニカル

ア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート (IUPAC 名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロントリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシッブルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (589) + TX、オルラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタルア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₁ (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₂ (代替名) (839) + TX、トリメドルア C (代替名) (839) 及びトランクコール (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

10

20

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

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1058) + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) エタン (IUPAC 名) (1056) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1062) + TX、1, 2 - ジクロロプロパンを伴う 1, 3 - ジクロロプロペン (IUPAC 名) (1063) + TX、1 - プロモ - 2 - クロロエタン (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (916) + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) エチルアセテート (IUPAC 名) (1451) + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルホスフェート (IUPAC 名) (1066) + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニルジメチルカルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1109) + TX、2 - (2 - プトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (935) + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチルカルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1084) + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ) エタノール (IUPAC 名) (986) + TX、2 - クロロビニルジエチルホスフェート (IUPAC 名) (984) + TX、2 - イミダゾリドン (IUPAC 名) (1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC 名) (1246) + TX、2 - メチル (プロパ - 2 - イニル) アミノフェニルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1284) + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート (IUPAC 名) (1433) + TX、3 - プロモ - 1 - クロロプロパ - 1 - エン (IUPAC 名) (917) + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート (IUPAC 名) (1283) + TX、4 - メチル (プロパ - 2 -

30

40

50

イニル) アミノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート (I U P A C 名) (1 2 8 5) +
 T X、5, 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート (I U P A C 名) (1 0 8 5) + T X、アバメクチン (1) + T X、アセフェート (2) +
 T X、アセタミプリド (4) + T X、アセチオン (代替名) [C C N] + T X、アセトプ
 ロール [C C N] + T X、アクリナトリン (9) + T X、アクリロニトリル (I U P A C
 名) (8 6 1) + T X、アラニカルブ (1 5) + T X、アルジカルブ (1 6) + T X、アル
 ドキシカルブ (8 6 3) + T X、アルドリン (8 6 4) + T X、アレトリン (1 7) +
 T X、アロサミジン (代替名) [C C N] + T X、アリキシカルブ (8 6 6) + T X、
 - シベルメトリン (2 0 2) + T X、 - エクジソン (代替名) [C C N] + T X、リン
 化アルミニウム (6 4 0) + T X、アミジチオン (8 7 0) + T X、アミドチオエート (8 7 2) + T X、アミノカルブ (8 7 3) + T X、アミトン (8 7 5) + T X、シュウ酸
 水素アミトン (8 7 5) + T X、アミトラズ (2 4) + T X、アナバシン (8 7 7) + T
 X、アチダチオン (8 8 3) + T X、A V I 3 8 2 (化合物コード) + T X、A Z 6
 0 5 4 1 (化合物コード) + T X、アザジラクチン (代替名) (4 1) + T X、アザメチ
 ホス (4 2) + T X、アジンホス - エチル (4 4) + T X、アジンホス - メチル (4 5)
 + T X、アゾトエート (8 8 9) + T X、パチルスチューリングシス (*Bacillus thuringiensis*) エンドトキシン (代替名) (5 2) + T X、ヘキサ
 フルオロケイ酸バリウム (代替名) [C C N] + T X、多硫化バリウム (I U P A C / ケ
 ミカルアブストラクツ名) (8 9 2) + T X、バルトリン [C C N] + T X、Bayer
 2 2 / 1 9 0 (開発コード) (8 9 3) + T X、Bayer 2 2 4 0 8 (開発コード
) (8 9 4) + T X、ベンジオカルブ (5 8) + T X、ベンフラカルブ (6 0) + T X、
 ベンスルタップ (6 6) + T X、 - シフルトリン (1 9 4) + T X、 - シベルメトリ
 ン (2 0 3) + T X、ピフェントリン (7 6) + T X、ピオアレトリン (7 8) + T X、
 ピオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (代替名) (7 9) + T X、ピオエタノメト
 リン [C C N] + T X、ピオペルメトリン (9 0 8) + T X、ピオレスメトリン (8 0)
 + T X、ビス (2 - クロロエチル) エーテル (I U P A C 名) (9 0 9) + T X、ピスト
 リフルロン (8 3) + T X、ホウ砂 (8 6) + T X、プロフェンバレレート (代替名) +
 T X、プロムフェンピンホス (9 1 4) + T X、プロモシクレン (9 1 8) + T X、プロ
 モ - D D T (代替名) [C C N] + T X、プロモホス (9 2 0) + T X、プロモホス - エ
 チル (9 2 1) + T X、プフェンカルブ (9 2 4) + T X、ププロフェジン (9 9) + T
 X、ブタカルブ (9 2 6) + T X、ブタチオホス (9 2 7) + T X、プトカルボキシム (1 0 3) + T X、プトネート (9 3 2) + T X、プトキシカルボキシム (1 0 4) + T X
 、プチルピリダベン (代替名) + T X、カズサホス (1 0 9) + T X、ヒ酸カルシウム [C C N] + T X、シアン化カルシウム (4 4 4) + T X、多硫化カルシウム (I U P A C
 名) (1 1 1) + T X、カンフェクロル (9 4 1) + T X、カーボノレート (9 4 3) +
 T X、カルバリル (1 1 5) + T X、カルボフラン (1 1 8) + T X、二硫化炭素 (I U
 P A C / ケミカルアブストラクツ名) (9 4 5) + T X、四塩化炭素 (I U P A C 名) (9 4 6) + T X、カルボフェノチオン (9 4 7) + T X、カルボスルファン (1 1 9) +
 T X、カルタップ (1 2 3) + T X、カルタップ塩酸塩 (1 2 3) + T X、セバジン (代
 替名) (7 2 5) + T X、クロルピシクレン (9 6 0) + T X、クロルダン (1 2 8) +
 T X、クロルデコン (9 6 3) + T X、クロルジメホルム (9 6 4) + T X、クロルジメ
 ホルム塩酸塩 (9 6 4) + T X、クロルエトキシホス (1 2 9) + T X、クロルフェナビ
 ル (1 3 0) + T X、クロルフェンピンホス (1 3 1) + T X、クロルフルアズロン (1
 3 2) + T X、クロルメホス (1 3 6) + T X、クロロホルム [C C N] + T X、クロロ
 ピクリン (1 4 1) + T X、クロルホキシム (9 8 9) + T X、クロルプラゾホス (9 9
 0) + T X、クロルピリホス (1 4 5) + T X、クロルピリホス - メチル (1 4 6) + T
 X、クロルチオホス (9 9 4) + T X、クロマフェノジド (1 5 0) + T X、シネリン I
 (6 9 6) + T X、シネリン I I (6 9 6) + T X、シネリン (6 9 6) + T X、シス -
 レスメトリン (代替名) + T X、シスメトリン (8 0) + T X、クロシトリン (代替名)
 + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、クロサンテル (代替名) [C C N] + T X、

10

20

30

40

50

クロチアニジン (165) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、ヒ酸銅 [CCN] + TX、オレイン酸銅 [CCN] + TX、クマホス (174) + TX、クミトエート (1006) + TX、クロタミトン (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1010) + TX、クルホメート (1011) + TX、氷晶石 (代替名) (177) + TX、CS708 (開発コード) (1012) + TX、シアノフェンホス (1019) + TX、シアノホス (184) + TX、シアントエート (1020) + TX、シクレトリン [CCN] + TX、シクロプロトリン (188) + TX、シフルトリン (193) + TX、シハロトリン (196) + TX、シペルメトリン (201) + TX、シフェノトリン (206) + TX、シロマジン (209) + TX、サイチオアート (代替名) [CCN] + TX、d-リモネン (代替名) [CCN] + TX、d-テトラメトリン (代替名) (788) + TX、DAEP (1031) + TX、ダゾメット (216) + TX、DDT (219) + TX、デカルボフラン (1034) + TX、デルタメトリン (223) + TX、デメフィオン (1037) + TX、デメフィオン-O (1037) + TX、デメフィオン-S (1037) + TX、デメトン (1038) + TX、デメトン-メチル (224) + TX、デメトン-O (1038) + TX、デメトン-O-メチル (224) + TX、デメトン-S (1038) + TX、デメトン-S-メチル (224) + TX、デメトン-S-メチルスルホン (1039) + TX、ジアフェンチウロン (226) + TX、ジアリホス (1042) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ダイアジノン (227) + TX、ジカプトン (1050) + TX、ジクロフェンチオン (1051) + TX、ジクロルボス (236) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジクレシル (代替名) [CCN] + TX、ジクロトホス (243) + TX、ジシクラニル (244) + TX、ディルドリン (1070) + TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルホスフェート (IUPAC名) (1076) + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジロール (代替名) [CCN] + TX、ジメフルトリン [CCN] + TX、ジメホックス (1081) + TX、ジメタン (1085) + TX、ジメトエート (262) + TX、ジメトリン (1083) + TX、ジメチルピンホス (265) + TX、ジメチラン (1086) + TX、ジネクス (1089) + TX、ジネクスジクレキシシ (1089) + TX、ジノプロブ (1093) + TX、ジノサム (1094) + TX、ジノセブ (1095) + TX、ジノテフラン (271) + TX、ジオフェノラン (1099) + TX、ジオキサベンゾホス (1100) + TX、ジオキサカルブ (1101) + TX、ジオキサチオン (1102) + TX、ジスルホトン (278) + TX、ジチクロホス (1108) + TX、DNOC (282) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、DSP (1115) + TX、エクジステロン (代替名) [CCN] + TX、EI 1642 (開発コード) (1118) + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、EMPIC (1120) + TX、エンペントリン (292) + TX、エンドスルファン (294) + TX、エンドチオン (1121) + TX、エンドリン (1122) + TX、EPBP (1123) + TX、EPN (297) + TX、エポフェノナン (1124) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エスフェンバレート (302) + TX、エタホス (代替名) [CCN] + TX、エチオフエンカルブ (308) + TX、エチオン (309) + TX、エチプロール (310) + TX、エトエートメチル (1134) + TX、エトプロホス (312) + TX、ギ酸エチル (IUPAC名) [CCN] + TX、エチル-DDD (代替名) (1056) + TX、二臭化エチレン (316) + TX、二塩化エチレン (化学名) (1136) + TX、エチレンオキシド [CCN] + TX、エトフェンブロックス (319) + TX、エトリムホス (1142) + TX、EXD (1143) + TX、ファンファー (323) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェナザフロル (1147) + TX、フェンクロールホス (1148) + TX、フェネタカルブ (1149) + TX、フェンフルトリン (1150) + TX、フェニトロチオン (335) + TX、フェノブカルブ (336) + TX、フェノキサクリム (1153) + TX、フェノキサカルブ (340) + TX、フェンピリトリン (1155) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、フェンチオン (

10

20

30

40

50

346) + TX、フェンチオン - エチル [CCN] + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィプロニル (354) + TX、フロニカミド (358) + TX、フルベンジアミド (CAS登録番号: 272451-65-7) + TX、フルコフロン (1168) + TX、フルシクロクソン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネチル (1169) + TX、フルフェネリム [CCN] + TX、フルフェノクソン (370) + TX、フルフェンブロックス (1171) + TX、フルメトリン (372) + TX、フルバリネート (1184) + TX、
 FMC 1137 (開発コード) (1185) + TX、ホノホス (1191) + TX、ホルメタネート (405) + TX、ホルメタネート塩酸塩 (405) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート (1193) + TX、ホスメチラン (1194) + TX、ホスピレート (1195) + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、フラチオカルブ (412) + TX、フレトリン (1200) + TX、
 - シハロトリン (197) + TX、
 - HCH (430) + TX、グアザチン (422) + TX、グアザチン酢酸塩 (422) + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ハルフェンブロックス (424) + TX、ハロフェノジド (425) + TX、HCH (430) + TX、HEOD (1070) + TX、ヘプタクロル (1211) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヘキサフルムロン (439) + TX、HHDN (864) + TX、ヒドラメチルノン (443) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ハイドロブレン (445) + TX、ヒキンカルブ (1223) + TX、イミダクロプリド (458) + TX、イミプロトリン (460) + TX、インドキサカルブ (465) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、IPSP (1229) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イソベンザン (1232) + TX、イソカルボホス (代替名) (473) + TX、イソドリン (1235) + TX、イソフェンホス (1236) + TX、イソラン (1237) + TX、イソプロカルブ (472) + TX、イソプロピルO- (メトキシアミノチオホスホリル) サリチレート (IUPAC名) (473) + TX、イソプロチオラン (474) + TX、イソチオエート (1244) + TX、イソキサチオン (480) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリンI (696) + TX、ジャスモリンII (696) + TX、ヨードフェンホス (1248) + TX、幼若ホルモンI (代替名) [CCN] + TX、幼若ホルモンII (代替名) [CCN] + TX、幼若ホルモンIII (代替名) [CCN] + TX、ケレバン (1249) + TX、キノブレン (484) + TX、
 - シハロトリン (198) + TX、ヒ酸鉛 [CCN] + TX、レピメクチン (CCN) + TX、レプトホス (1250) + TX、リンダン (430) + TX、リリムホス (1251) + TX、ルフェヌロン (490) + TX、リチダチオン (1253) + TX、m-クメニルメチルカルバメート (IUPAC名) (1014) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) + TX、マラチオン (492) + TX、マロノベン (1254) + TX、マジドックス (1255) + TX、メカルバム (502) + TX、メカルフォン (1258) + TX、メナゾン (1260) + TX、メホスホラン (1261) + TX、塩化第一水銀 (513) + TX、メスルフェンホス (1263) + TX、メタフルミゾン (CCN) + TX、メタム (519) + TX、メタムカリウム (代替名) (519) + TX、メタムナトリウム (519) + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、メタンスルホニルフルオリド (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1268) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メトクロトホス (1273) + TX、メソミル (531) + TX、メトブレン (532) + TX、メトキン - ブチル (1276) + TX、メトトリン (代替名) (533) + TX、メトキシクロル (534) + TX、メトキシフェノジド (535) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、メチルクロロホルム (代替名) [CCN] + TX、塩化メチレン [CCN] + TX、メトフルトリン [CCN] + TX、メトルカルブ (550) + TX、メトキサジアゾン (1288) + TX、メピンホス (556) + TX、メキサカルベート (1290) + TX、ミルベメクチン (557) + TX、

10

20

30

40

50

ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホックス(1293)+TX
 、ミレックス(1294)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1
 300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナフトロホス(代替名)
 [CCN]+TX、ナレド(567)+TX、ナフトレン(IUPAC/ケミカルアブス
 トラクツ名)(1303)+TX、NC-170(開発コード)(1306)+TX、N
 C-184(化合物コード)+TX、ニコチン(578)+TX、硫酸ニコチン(578
)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニテンピラム(579)+TX、ニチアジ
 ン(1311)+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化
 亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-02
 50(化合物コード)+TX、ノルニコチン(慣用名)(1319)+TX、ノバルロン
 (585)+TX、ノピフルムロン(586)+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフ
 ェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057)+TX、O,
 O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエー
 ト(IUPAC名)(1074)+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピ
 ルピリミジン-4-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1075)+TX、O,
 O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424)
 +TX、オレイン酸(IUPAC名)(593)+TX、オメトエート(594)+TX
 、オキサミル(602)+TX、オキシデメトンメチル(609)+TX、オキシデプロ
 ホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(2
 19)+TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN]+TX、パラチオン(615)+TX
 、パラチオン-メチル(616)+TX、ペンフルロン(代替名)[CCN]+TX、ペ
 ンタクロロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC
 名)(623)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+T
 X、PH 60-38(開発コード)(1328)+TX、フェンカプトン(1330)
 +TX、フェノトリン(630)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(6
 36)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメッ
 ト(638)+TX、ホスニクロル(1339)+TX、ホスファミドン(639)+T
 X、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、ホキシム(642)+TX、ホキシ
 ム-メチル(1340)+TX、ピリメタホス(1344)+TX、ピリミカーブ(65
 1)+TX、ピリミホス-エチル(1345)+TX、ピリミホス-メチル(652)+
 TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポ
 リクロロテルペン(慣用名)(1347)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、カ
 リウムチオシアネート[CCN]+TX、プラレトリン(655)+TX、プレコセンI
 (代替名)[CCN]+TX、プレコセンII(代替名)[CCN]+TX、プレコセン
 III(代替名)[CCN]+TX、プリミドホス(1349)+TX、プロフェノホス
 (662)+TX、プロフルトリン[CCN]+TX、プロマシル(1354)+TX、
 プロメカルブ(1355)+TX、プロパホス(1356)+TX、プロペタンホス(6
 73)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プ
 ロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフェンビユー
 ト[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、
 ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン(1367)+TX、ピレトリンI(69
 6)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベ
 ン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+T
 X、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシ
 フェン(708)+TX、カシヤ(代替名)[CCN]+TX、キナルホス(711)
 +TX、キナルホス-メチル(1376)+TX、キノチオン(1380)+TX、キン
 チオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、ラホキ
 サニド(代替名)[CCN]+TX、レスメトリン(719)+TX、ロテノン(722
)+TX、RU 15525(開発コード)(723)+TX、RU 25475(開発
 コード)(1386)+TX、リアニア(代替名)(1387)+TX、リアノジン(慣
 10
 20
 30
 40
 50

用名) (1387) + TX、サバジラ(代替名) (725) + TX、シュラーダン(1389) + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名) [CCN] + TX、SI-0009(化合物コード) + TX、SI-0205(化合物コード) + TX、SI-0404(化合物コード) + TX、SI-0405(化合物コード) + TX、シラフルオフエン(728) + TX、SN 72129(開発コード) (1397) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + TX、シアン化ナトリウム(444) + TX、フッ化ナトリウム(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1399) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623) + TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名) (1401) + TX、ナトリウムチオシアネート[CCN] + TX、ソファミド(1402) + TX、スピノサド(737) + TX、スピロメシフェン(739) + TX、スピロテトラマト(CCN) + TX、スルコフロン(746) + TX、スルコフロン-ナトリウム(746) + TX、スルフルアミド(750) + TX、スルホテップ(753) + TX、フッ化スルフルル(756) + TX、スルプロホス(1408) + TX、タール油(代替名) (758) + TX、-フルバリネート(398) + TX、タジムカルブ(1412) + TX、TDE(1414) + TX、テブフェノジド(762) + TX、テブフェンピラド(763) + TX、テブピリムホス(764) + TX、テフルベンズロン(768) + TX、テフルトリン(769) + TX、テメホス(770) + TX、TEPP(1417) + TX、テラレトリン(1418) + TX、テルバム(代替名) + TX、テルブホス(773) + TX、テトラクロロエタン[CCN] + TX、テトラクロルピンホス(777) + TX、テトラメトリン(787) + TX、-シベルメトリン(204) + TX、チアクロプリド(791) + TX、チアフェノックス(代替名) + TX、チアメトキサム(792) + TX、チクロホス(1428) + TX、チオカルボキシム(1431) + TX、チオシクラム(798) + TX、シュウ酸水素チオシクラム(798) + TX、チオジカルブ(799) + TX、チオファノックス(800) + TX、チオメトン(801) + TX、チオナジン(1434) + TX、チオスルタップ(803) + TX、チオスルタップ-ナトリウム(803) + TX、ツリンギエンシン(代替名) [CCN] + TX、トルフェンピラド(809) + TX、トラロメトリン(812) + TX、トランスフルトリン(813) + TX、トランスベルメトリン(1440) + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアザメート(818) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリクロルメタホス-3(代替名) [CCN] + TX、トリクロロナート(1452) + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリフルムロン(835) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、トリブレン(1459) + TX、パミドチオン(847) + TX、パニリプロール[CCN] + TX、ベラトリジン(代替名) (725) + TX、ベラトリン(代替名) (725) + TX、XMC(853) + TX、キシリルカルブ(854) + TX、YI-5302(化合物コード) + TX、-シベルメトリン(205) + TX、メトリン(代替名) + TX、リン化亜鉛(640) + TX、ゾラプロホス(1469) 及び ZXI 8901(開発コード) (858) + TX、シアントラニリプロール[736994-63-19] + TX、クロラントラニリプロール[500008-45-7] + TX、シエノピラフェン[560121-52-0] + TX、シフルメトフェン[400882-07-7] + TX、ピリフルキナゾン[337458-27-2] + TX、スピネトラム[187166-40-1+187166-15-0] + TX、スピロテトラマト[203313-25-1] + TX、スルホキサフロール[946578-00-3] + TX、フルフィプロール[704886-18-0] + TX、メベルフルトリン[915288-13-0] + TX、テトラメチルフルトリン[84937-88-2] + TX、トリフルメゾピリム(国際公開第2012/092115号に開示されている) + TXからなる物質の群から選択される殺虫剤、

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名) (913) + TX、プロモアセトアミド[CCN] + TX、ヒ酸カルシウム[CCN] + TX、クロエトカルブ(999) + TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN] + TX、硫酸銅(172) + TX、フェンチン(347)

10

20

30

40

50

+ TX、リン酸第二鉄 (IUPAC名) (352) + TX、メタアルデヒド (518) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ニクロシアミド (576) + TX、ニクロシアミドオラミン (576) + TX、ペンタクロロフェノール (623) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (623) + TX、タジムカルブ (1412) + TX、チオジカルブ (799) + TX、酸化トリブチルスズ (913) + TX、トリフェンモルフ (1454) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX、ピリプロール [394730-71-3] + TX からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、AKD-3088 (化合物コード) + TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1045) + TX、1,2-ジクロロプロパン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1062) + TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン (IUPAC名) (1063) + TX、1,3-ジクロロプロペン (233) + TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1065) + TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルローダニン (IUPAC名) (980) + TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸 (IUPAC名) (1286) + TX、6-イソペンテニルアミノプリン (代替名) (210) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、ベンクロチアズ [CCN] + TX、ベノミル (62) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (945) + TX、カルボスルファン (119) + TX、クロロピクリン (141) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロエトカルブ (999) + TX、サイトカイニン (代替名) (210) + TX、ダゾメット (216) + TX、DBC P (1045) + TX、DCIP (218) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ジクロフェンチオン (1051) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジメトエート (262) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エトプロホス (312) + TX、二臭化エチレン (316) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、フルフルール (代替名) [CCN] + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、キネチン (代替名) (210) + TX、メカルフォン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタムカリウム (代替名) (519) + TX、メタムナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC-184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロチオフェン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1422) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノルス [CCN] + TX、YI-5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [318290-98-1] + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤、エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX からなる物

10

20

30

40

50

質の群から選択される硝化阻害剤、

アシベンゾラル(6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル(6) + TX、プロベナゾール(658)及びオオイタドリ(*Reynoutria sachalinensis*)抽出物(代替名)(720) + TXからなる物質の群から選択される植物活性化剤、

2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246) + TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748) + TX、

-クロロヒドリン[CCN] + TX、リン化アルミニウム(640) + TX、アンツ(880) + TX、三酸化ヒ素(882) + TX、炭酸バリウム(891) + TX、ビスチオセミ(912) + TX、プロディファコウム(89) + TX、プロマジオロン(91) + TX、プロメタリン(92) + TX、シアン化カルシウム(444) + TX、

クロラロース(127) + TX、クロロファシノン(140) + TX、コレカルシフェロール(代替名)(850) + TX、クマクロール(1004) + TX、クマフリル(1005) + TX、クマテトラリル(175) + TX、クリミジン(1009) + TX、ジフェナコウム(246) + TX、ジフェチアロン(249) + TX、ジファシノン(273) + TX、

エルゴカルシフェロール(301) + TX、フロクマフェン(357) + TX、フルオロアセトアミド(379) + TX、フルプロパジン(1183) + TX、フルプロパジン塩酸塩(1183) + TX、

-HCH(430) + TX、HCH(430) + TX、シアン化水素(444) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、リンダン(430) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、

臭化メチル(537) + TX、ノルボルミド(1318) + TX、ホサセチム(1336) + TX、ホスフィン(IUPAC名)(640) + TX、リン[CCN] + TX、ピンドン(1341) + TX、

亜ヒ酸カリウム[CCN] + TX、ピリヌロン(1371) + TX、シリロシド(1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + TX、シアン化ナトリウム(444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム(735) + TX、ストリキニーネ(745) + TX、

硫酸タリウム[CCN] + TX、ワルファリン(851)及びリン化亜鉛(640) + TXからなる物質の群から選択される殺鼠剤、

2-(2-プトキシエトキシ)エチルピペロニレート(IUPAC名)(934) + TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903) + TX、

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

プロピル異性体(1358) + TX、S421(開発コード)(724) + TX、セサメックス(1393) + TX、セサモリン(1394)及びスルホキシド(1406) + TXからなる物質の群から選択される共力剤、

アントラキノ(32) + TX、クロラロース(127) + TX、ナフテン酸銅[CCN] + TX、オキシ塩化銅(171) + TX、ダイアジノン(227) + TX、ジシクロペンタジエン(化学名)(1069) + TX、

グアザチン(422) + TX、グアザチン酢酸塩(422) + TX、メチオカルブ(530) + TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23) + TX、チラム(804) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、

ナフテン酸亜鉛[CCN]及びジラム(856) + TXからなる物質の群から選択される動物忌避剤、

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

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

並びに、アメトクトラジン[865318-97-4] + TX、アミスルプロム[348635-87-0] + TX、アザコナゾール[60207-31-0] + TX、ベンゾピンジフルピル[1072957-71-1] + TX、

ピテルタノール[70585-36-3] + TX、ピキサフェン[581809-46-3] + TX、プロムコナゾール[116255-48-2] + TX、クモキシストロピン[850881-70-8] + TX

10

20

30

40

50

、シブロコナゾール [9 4 3 6 1 - 0 6 - 5] + T X、ジフェノコナゾール [1 1 9 4 4
6 - 6 8 - 3] + T X、ジニコナゾール [8 3 6 5 7 - 2 4 - 3] + T X、エノキサスト
ロピン [2 3 8 4 1 0 - 1 1 - 2] + T X、エボキシコナゾール [1 0 6 3 2 5 - 0 8 -
0] + T X、フェンブコナゾール [1 1 4 3 6 9 - 4 3 - 6] + T X、フェンピラザミン
[4 7 3 7 9 8 - 5 9 - 3] + T X、フルキンコナゾール [1 3 6 4 2 6 - 5 4 - 5] +
T X、フルシラゾール [8 5 5 0 9 - 1 9 - 9] + T X、フルトリアホール [7 6 6 7 4
- 2 1 - 0] + T X、フルキサピロキサド [9 0 7 2 0 4 - 3 1 - 3] + T X、フルオピ
ラム [6 5 8 0 6 6 - 3 5 - 4] + T X、フェナミンストロピン [3 6 6 8 1 5 - 3 9 -
6] + T X、イソフェタミド [8 7 5 9 1 5 - 7 8 - 9] + T X、ヘキサコナゾール [7
9 9 8 3 - 7 1 - 4] + T X、イマザリル [3 5 5 5 4 - 4 4 - 0] + T X、イミベンコ
ナゾール [8 6 5 9 8 - 9 2 - 7] + T X、イブコナゾール [1 2 5 2 2 5 - 2 8 - 7]
+ T X、イブフェントリフルコナゾール [1 4 1 7 7 8 2 - 0 8 - 1] + T X、イソチア
ニル [2 2 4 0 4 9 - 0 4 - 1] + T X、マンデストロピン [1 7 3 6 6 2 - 9 7 - 0]
(国際公開第 2 0 1 0 / 0 9 3 0 5 9 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + T X
、メフェントリフルコナゾール [1 4 1 7 7 8 2 - 0 3 - 6] + T X、メトコナゾール [1
2 5 1 1 6 - 2 3 - 6] + T X、マイクロブタニル [8 8 6 7 1 - 8 9 - 0] + T X、パ
クロブトラゾール [7 6 7 3 8 - 6 2 - 0] + T X、ペフラゾエート [1 0 1 9 0 3 - 3
0 - 4] + T X、ペンフルフェン [4 9 4 7 9 3 - 6 7 - 8] + T X、ペンコナゾール [6
6 2 4 6 - 8 8 - 6] + T X、プロチオコナゾール [1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6] + T X
、ピリフェノックス [8 8 2 8 3 - 4 1 - 4] + T X、プロクロラズ [6 7 7 4 7 - 0 9
- 5] + T X、プロピコナゾール [6 0 2 0 7 - 9 0 - 1] + T X、シメコナゾール [1
4 9 5 0 8 - 9 0 - 7] + T X、テブコナゾール [1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3] + T X、テ
トラコナゾール [1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3] + T X、トリアジメホン [4 3 1 2 1 - 4 3
- 3] + T X、トリアジメノール [5 5 2 1 9 - 6 5 - 3] + T X、トリフルミゾール [9
9 3 8 7 - 8 9 - 0] + T X、トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7] + T X、
アンシミドール [1 2 7 7 1 - 6 8 - 5] + T X、フェナリモル [6 0 1 6 8 - 8 8 - 9
] + T X、ヌアリモル [6 3 2 8 4 - 7 1 - 9] + T X、ブピリメート [4 1 4 8 3 - 4
3 - 6] + T X、ジメチリモール [5 2 2 1 - 5 3 - 4] + T X、エチリモール [2 3 9
4 7 - 6 0 - 6] + T X、ドデモルフ [1 5 9 3 - 7 7 - 7] + T X、フェンブロピジン
[6 7 3 0 6 - 0 0 - 7] + T X、フェンブロピモルフ [6 7 5 6 4 - 9 1 - 4] + T X
、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8] + T X、トリデモルフ [8 1 4 1 2 - 4 3
- 3] + T X、シブロジニル [1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2] + T X、メパニピリム [1 1 0
2 3 5 - 4 7 - 7] + T X、ピリメタニル [5 3 1 1 2 - 2 8 - 0] + T X、フェンピク
ロニル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + T X、フルジオキシソニル [1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1]
+ T X、フルインダピル (f l u i n d a p y r) [1 3 8 3 8 0 9 - 8 7 - 7] + T X
、ベナラキシル [7 1 6 2 6 - 1 1 - 4] + T X、フララキシル [5 7 6 4 6 - 3 0 - 7
] + T X、メタラキシル [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + T X、R - メタラキシル [7 0 6 3
0 - 1 7 - 0] + T X、オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + T X、オキサジキシル [7
7 7 3 2 - 0 9 - 3] + T X、ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2] + T X、カルベンダ
ジム [1 0 6 0 5 - 2 1 - 7] + T X、デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9 1 - 6] + T X、フ
ベリダゾール [3 8 7 8 - 1 9 - 1] + T X、チアベンダゾール [1 4 8 - 7 9 - 8] +
T X、クロゾリネート [8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + T X、ジクロゾリン [2 4 2 0 1 - 5
8 - 9] + T X、イブロジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + T X、マイクロゾリン [5 4 8
6 4 - 6 1 - 8] + T X、プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8] + T X、ピンクロゾリ
ン [5 0 4 7 1 - 4 4 - 8] + T X、ボスカリド [1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6] + T X、カル
ボキシシン [5 2 3 4 - 6 8 - 4] + T X、フェンフラム [2 4 6 9 1 - 8 0 - 3] + T
X、フルトラニル [6 6 3 3 2 - 9 6 - 5] + T X、フルチアニル [9 5 8 6 4 7 - 1 0
- 4] + T X、メブロニル [5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + T X、オキシカルボキシシン [5 2
5 9 - 8 8 - 1] + T X、ペンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + T X、チフルザ
ミド [1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7] + T X、グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + T X

10

20

30

40

50

、ドジン [2 4 3 9 - 1 0 - 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] (遊離塩基) + T X、イミノクタ
 ジン [1 3 5 1 6 - 2 7 - 3] + T X、アゾキシストロピン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8]
 + T X、ジモキシストロピン [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + T X、エネステロプリン { P
 r o c . B C P C , I n t . C o n g r . , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + T
 X、フルオキサストロピン [3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9] + T X、クレソキシム - メチル [1
 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0] + T X、メトミノストロピン [1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1] + T
 X、トリフロキシストロピン [1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7] + T X、オリザストロピン [2
 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0] + T X、ピコキシストロピン [1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5] + T X
 、ピラクロストロピン [1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0] + T X、ピラオキシストロピン [8 6
 2 5 8 8 - 1 1 - 2] + T X、フェルバム [1 4 4 8 4 - 6 4 - 1] + T X、マンコゼブ 10
 [8 0 1 8 - 0 1 - 7] + T X、マネブ [1 2 4 2 7 - 3 8 - 2] + T X、メチラム [9
 0 0 6 - 4 2 - 2] + T X、プロピネブ [1 2 0 7 1 - 8 3 - 9] + T X、チラム [1 3
 7 - 2 6 - 8] + T X、ジネブ [1 2 1 2 2 - 6 7 - 7] + T X、ジラム [1 3 7 - 3 0
 - 4] + T X、カプタホール [2 4 2 5 - 0 6 - 1] + T X、キャプタン [1 3 3 - 0 6
 - 2] + T X、ジクロフルアニド [1 0 8 5 - 9 8 - 9] + T X、フルオロイミド [4 1
 2 0 5 - 2 1 - 4] + T X、ホルベット [1 3 3 - 0 7 - 3] + T X、トリルフルアニド
 [7 3 1 - 2 7 - 1] + T X、ボルドー液 [8 0 1 1 - 6 3 - 0] + T X、水酸化銅 [2
 0 4 2 7 - 5 9 - 2] + T X、オキシ塩化銅 [1 3 3 2 - 4 0 - 7] + T X、硫酸銅 [7
 7 5 8 - 9 8 - 7] + T X、酸化銅 [1 3 1 7 - 3 9 - 1] + T X、マンカップー [5 3
 9 8 8 - 9 3 - 5] + T X、オキシ銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6] + T X、ジノカップ 20
 [1 3 1 - 7 2 - 6] + T X、ニトロタール - イソプロピル [1 0 5 5 2 - 7 4 - 6] + T
 X、エディフェンホス [1 7 1 0 9 - 4 9 - 8] + T X、イプロベンホス [2 6 0 8 7 -
 4 7 - 8] + T X、イソプロチオラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1] + T X、ホスジフェン [3
 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + T X、ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8 - 6] + T X、トルクロ
 ホス - メチル [5 7 0 1 8 - 0 4 - 9] + T X、アシベンゾラル - S - メチル [1 3 5 1
 5 8 - 5 4 - 2] + T X、アニラジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + T X、ベンチアバリカルブ
 [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + T X、ブラストサイジン - S [2 0 7 9 - 0 0 - 7] + T
 X、チノメチオナート [2 4 3 9 - 0 1 - 2] + T X、クロロネブ [2 6 7 5 - 7 7 - 6
] + T X、クロロタロニル [1 8 9 7 - 4 5 - 6] + T X、シフルフェナミド [1 8 0 4
 0 9 - 6 0 - 3] + T X、シモキサニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7] + T X、ジクロン [1
 1 7 - 8 0 - 6] + T X、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4] + T X、ジクロメ
 ジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + T X、ジクロラン [9 9 - 3 0 - 9] + T X、ジエトフ
 エンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9] + T X、ジメトモルフ [1 1 0 4 8 8 - 7 0 - 5]
 + T X、S Y P - L I 9 0 (フルモルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9] + T X、ジチアノ
 ン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + T X、エタボキサム [1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3] + T X、エ
 トリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5 - 9] + T X、ファモキサドン [1 3 1 8 0 7 - 5 7 -
 3] + T X、フェンアミドン [1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7] + T X、フェノキサニル [1 1
 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + T X、フェンチン [6 6 8 - 3 4 - 8] + T X、フェリムゾン [8
 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + T X、フルアジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 - 6] + T X、フルオ
 ピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7] + T X、フルスルファミド [1 0 6 9 1 7 - 5 2 -
 6] + T X、フェンヘキサミド [1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + T X、ホセチル - アルミニ
 ウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] + T X、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4 - 4 4 - 1] + T X
 、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2 3 - 1 7 - 7] + T X、I K F - 9 1 6 (シアゾファミ
 ド) [1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3] + T X、カスガマイシン [6 9 8 0 - 1 8 - 3] + T X
 、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2 - 4 9 - 6] + T X、メトラフェノン [2 2 0 8 9 9 -
 0 3 - 6] + T X、ペンシクロン [6 6 0 6 3 - 0 5 - 6] + T X、フタリド [2 7 3 5
 5 - 2 2 - 2] + T X、ピカルブトラゾクス [5 0 0 2 0 7 - 0 4 - 5] + T X、ポリオ
 キシン [1 1 1 1 3 - 8 0 - 7] + T X、プロベナゾール [2 7 6 0 5 - 7 6 - 1] + T
 X、プロパモカルブ [2 5 6 0 6 - 4 1 - 1] + T X、プロキナジド [1 8 9 2 7 8 - 1
 2 - 4] + T X、ピジフルメトフェン [1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7] + T X、ピラメトス 40
 50

トロピン [9 1 5 4 1 0 - 7 0 - 7] + T X、ピロキロン [5 7 3 6 9 - 3 2 - 1] + T X、
 X、ピリオフェノン [6 8 8 0 4 6 - 6 1 - 9] + T X、ピリベンカルブ [7 9 9 2 4 7
 - 5 2 - 2] + T X、ピリソキサゾール (p y r i s o x a z o l e) [8 4 7 7 4 9 -
 3 7 - 5] + T X、キノキシフェン [1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7] + T X、キントゼン [8
 2 - 6 8 - 8] + T X、硫黄 [7 7 0 4 - 3 4 - 9] + T X、Timorex Gold
 (商 標) (S t o c k t o n G r o u p 製 の テ ィ ー ツ リ ー 油 を 含 有 す る 植 物 抽 出 物) +
 T X、テブフロキン [3 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2] + T X、チアジニル [2 2 3 5 8 0 - 5
 1 - 6] + T X、トリアゾキシド [7 2 4 5 9 - 5 8 - 6] + T X、トルプロカルブ [9
 1 1 4 9 9 - 6 2 - 2] + T X、トリクロピリカルブ [9 0 2 7 6 0 - 4 0 - 1] + T X
 、トリシクラゾール [4 1 8 1 4 - 7 8 - 2] + T X、トリホリン [2 6 6 4 4 - 4 6 - 10
 2] + T X、バリダマイシン [3 7 2 4 8 - 4 7 - 8] + T X、バリフェナレート [2 8
 3 1 5 9 - 9 0 - 0] + T X、ゾキサミド (R H 7 2 8 1) [1 5 6 0 5 2 - 6 8 - 5]
 + T X、マンジプロパミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + T X、イソピラザム [8 8 1 6
 8 5 - 5 8 - 1] + T X、フェナマクリル (p h e n a m a c r i l) + T X、セダキサ
 ン [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6] + T X、トリネキサパック - エチル [9 5 2 6 6 - 4 0 -
 3] + T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (10
 9 - ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン -
 5 - イル) - アミド (国 際 公 開 第 2 0 0 7 / 0 4 8 5 5 6 号 に 開 示 さ れ て い る) + T X、
 3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3 ' , 4 ' ,
 5 ' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国 際 公 開 第 2 0 0 6 / 0 8 7 3
 4 3 号 に 開 示 さ れ て い る) + T X、
 [(3 S , 4 R , 4 a R , 6 S , 6 a S , 1 2 R , 1 2 a S , 1 2 b S) - 3 - [(シ ク
 ロ プ ロ ピ ル カ ル ボ ニ ル) オ キ シ] - 1 , 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1
 2 b - デ カ ヒ ド ロ - 6 , 1 2 - ジ ヒ ド ロ キ シ - 4 , 6 a , 1 2 b - ト リ メ チ ル - 1 1 - オ
 キ ソ - 9 - (3 - ピ リ ジ ニ ル) - 2 H , 1 1 H ナ フ ト [2 , 1 - b] ピ ラ ノ [3 , 4 - e
] ピ ラ ン - 4 - イ ル] メ チ ル - シ ク ロ プ ロ バ ン カ ル ボ キ シ レ ー ト [9 1 5 9 7 2 - 1 7 -
 7] + T X 及 び 1 , 3 , 5 - ト リ メ チ ル - N - (2 - メ チ ル - 1 - オ キ ソ プ ロ ピ ル) - N
 - [3 - (2 - メ チ ル プ ロ ピ ル) - 4 - [2 , 2 , 2 - ト リ フ ル オ ロ - 1 - メ ト キ シ - 1
 - (ト リ フ ル オ ロ メ チ ル) エ チ ル] フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド
 [9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8] + T X から なる 群 から 選 択 さ れ る 生 物 学 的 に 有 効 な 化 合 物、
 又 は N - [(5 - ク ロ ロ - 2 - イ ソ プ ロ ピ ル - フェニル) メチル] - N - シクロプロピル
 - 3 - (ジ フ ル オ ロ メ チ ル) - 5 - フ ル オ ロ - 1 - メ チ ル - ピ ラ ゾ ー ル - 4 - カ ル ボ キ サ
 ミ ド (国 際 公 開 第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号 に 記 載 の 手 順 に し た が っ て 調 製 さ れ 得 る) +
 T X、2 , 6 - ジ メ チ ル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジ チ イ ノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c '
] ジ ピ ロ ー ル - 1 , 3 , 5 , 7 (2 H , 6 H) - テ ト ロ ン (国 際 公 開 第 2 0 1 1 / 1 3 8
 2 8 1 号 に 記 載 の 手 順 に し た が っ て 調 製 さ れ 得 る) + T X、6 - エ チ ル - 5 , 7 - ジ オ キ
 ソ - ピ ロ ロ [4 , 5] [1 , 4] ジ チ イ ノ [1 , 2 - c] イ ソ チ ア ゾ ー ル - 3 - カ ル ボ ニ
 ト リ ル + T X、4 - (2 - プ ロ モ - 4 - フ ル オ ロ - フェニル) - N - (2 - クロロ - 6 -
 フルオロ - フェニル) - 2 , 5 - ジメチル - ピラゾール - 3 - アミン (国 際 公 開 第 2 0 1
 2 / 0 3 1 0 6 1 号 に 記 載 の 手 順 に し た が っ て 調 製 さ れ 得 る) + T X、3 - (ジ フ ル オ ロ
 メ チ ル) - N - (7 - フ ル オ ロ - 1 , 1 , 3 - ト リ メ チ ル - イ ン ダ ン - 4 - イ ル) - 1 -
 メ チ ル - ピ ラ ゾ ー ル - 4 - カ ル ボ キ サ ミ ド (国 際 公 開 第 2 0 1 2 / 0 8 4 8 1 2 号 に 記 載
 の 手 順 に し た が っ て 調 製 さ れ 得 る) + T X、C A S 8 5 0 8 8 1 - 3 0 - 0 + T X、3
 - (3 , 4 - ジ ク ロ ロ - 1 , 2 - チ ア ゾ ー ル - 5 - イ ル メ ト キ シ) - 1 , 2 - ベ ン ゴ チ ア
 ゾ ー ル 1 , 1 - ジ オ キ シ ド (国 際 公 開 第 2 0 0 7 / 1 2 9 4 5 4 号 に 記 載 の 手 順 に し た が
 っ て 調 製 さ れ 得 る) + T X、2 - [2 - [(2 , 5 - ジ メ チ ル フェノキシ) メチル] フェ
 ニル] - 2 - メ ト キ シ - N - メ チ ル - ア セ ト ア ミ ド + T X、3 - (4 , 4 - ジ フ ル オ ロ -
 3 , 4 - ジ ヒ ド ロ - 3 , 3 - ジ メ チ ル イ ソ キ ノ リ ン - 1 - イ ル) キ ノ ロ ン (国 際 公 開 第 2
 0 0 5 / 0 7 0 9 1 7 号 に 記 載 の 手 順 に し た が っ て 調 製 さ れ 得 る) + T X、2 - [2 - フ
 ル オ ロ - 6 - [(8 - フ ル オ ロ - 2 - メ チ ル - 3 - キ ノ リ ル) オ キ シ] フェニル] プロパ
 40
 50

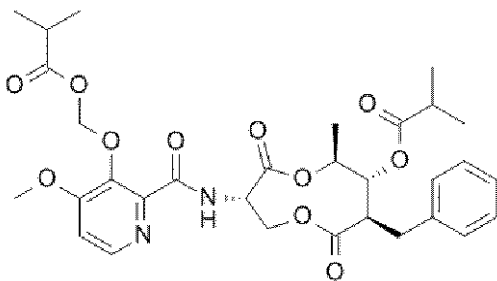
ン - 2 - オール (国際公開第 2011/081174 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、2 - [2 - [(7, 8 - ジフルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] - 6 - フルオロ - フェニル] プロパン - 2 - オール (国際公開第 2011/081174 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、オキサチアピプロリン + TX [1003318 - 67 - 9]、tert - ブチル N - [6 - [[[(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート + TX、N - [2 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) ピラジン - 2 - カルボキサミド (国際公開第 2007/072999 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2014/013842 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、2, 2, 2 - トリフルオロエチル N - [2 - メチル - 1 - [[(4 - メチルベンゾイル) アミノ] メチル] プロピル] カルバメート + TX、(2RS) - 2 - [4 - (4 - シクロフェノキシ) - , , - トリフルオロ - o - トリル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + TX、(2RS) - 2 - [4 - (4 - シクロフェノキシ) - , , - トリフルオロ - o - トリル] - 3 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4, 5 - ジクロロチアゾール - 2 - イル) オキシ - 2, 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン (国際公開第 2007/031513 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、[2 - [3 - [2 - [1 - [2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジル] チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 5 - イル] - 3 - クロロ - フェニル] メタンスルホネート (国際公開第 2012/025557 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、ブタ - 3 - イニル N - [6 - [[[(Z) - [(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート (国際公開第 2010/000841 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、2 - [[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル] - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン (国際公開第 2010/146031 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、メチル N - [[5 - [4 - (2, 4 - ジメチルフェニル) トリアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - フェニル] メチル] カルバメート + TX、3 - クロロ - 6 - メチル - 5 - フェニル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン (国際公開第 2005/121104 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - シクロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール (国際公開第 2013/024082 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、3 - クロロ - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン (国際公開第 2012/020774 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン - 3 - カルボニトリル (国際公開第 2012/020774 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、(R) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2011/162397 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2012/084812 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、1 - [2 - [[1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オ

キシメチル] - 3 - メチル - フェニル] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン (国際公開第 2013 / 162072 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 2 - [[2 - メチル - 4 - (3, 4, 5 - トリメチルピラゾール - 1 - イル)フェノキシ]メチル]フェニル]テトラゾール - 5 - オン (国際公開第 2014 / 051165 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、(Z, 2E) - 5 - [1 - (4 - クロロフェニル)ピラゾール - 3 - イル]オキシ - 2 - メトキシイミノ - N, 3 - ジメチル - ペンタ - 3 - エンアミド + TX、(4 - フェノキシフェニル)メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + TX、N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [1255734 - 28 - 1] (国際公開第 2010 / 130767 号に記載の手順にしたがって調製され得る) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - N - [(R) - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [1352994 - 67 - 2] + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4, 5 - ジクロロ - チアゾール - 2 - イルオキシ) - 2, 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4, 5 - ジクロロ - チアゾール - 2 - イルオキシ) - 2, 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、

10

20

【化 21】



(フェンピコキサミド [517875 - 34 - 2] (国際公開第 2003 / 035617 号に記載されているような)) + TX、(1S) - 2, 2 - ビス(4 - フルオロフェニル) - 1 - メチルエチル N - {[3 - (アセチルオキシ) - 4 - メトキシ - 2 - ピリジル]カルボニル} - L - アラニネート [1961312 - 55 - 9] (国際公開第 2016 / 122802 号に記載されているような) + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル)ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - エチル - 1, 1 - ジメチルインダン - 4 - イル)ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (1, 1 - ジメチル - 3 - プロピル - インダン - 4 - イル)ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - イソブチル - 1, 1 - ジメチルインダン - 4 - イル)ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチルインダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、及び 2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 1, 1 - ジメチル - 3 - プロピルインダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、ここで、これらのカルボキサミド化合物の各々は、国際公開第 2014 / 095675 号及び / 又は国際公開第 2016 / 139189 号に記載されている手順に従って調製することができる。

30

40

【0166】

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

50

相手は公知である。有効成分が、“The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council] 中に含まれている場合、それらは、特定の化合物について本明細書中上記の丸括弧中に示されている項目番号でその中に記載されており；例えば、化合物「アバメクチン」は、項目番号(1)で記載されている。上記に記載の特定の化合物について「[CCN]」が付記されている場合、対象の化合物は、[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright (著作権) 1995 - 2004]にてインターネットを介してアクセス可能である“Compendium of Pesticide Common Names”に含まれており；例えば、化合物「アセトプロール」は、インターネットアドレス <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> において記載されている。

【0167】

上記明細書において、上記の有効成分の大部分は、いわゆる「一般名」、関連する「ISO一般名」又は別の「一般名」を個々の事例において用いることにより言及されている。「一般名」による呼称ではない場合、代わりに用いられる呼称の性質は特定の化合物について丸括弧中に記載されており；この場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクツ名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」若しくは「開発コード」が用いられており、又は、これらの呼称若しくは「一般名」のいずれも用いられていない場合には、「代替名」が用いられている。「CAS登録番号」は、Chemical Abstracts Registry Numberを意味する。

【0168】

表1.1~1.3並びに表2.1及び2.2(以下)に表されているような1種の化合物、又は表T1(以下)に記載されている化合物1.1~1.190から選択される式(I)の化合物の有効成分混合物は、好ましくは、100:1~1:6000、特に50:1~1:50の混合比に、より特に20:1~1:20、更により特に10:1~1:10、非常に特に5:1~1:5の比にあり、2:1~1:2の比が特別に好ましく、及び4:1~2:1の比が同様に好ましく、とりわけ1:1、又は5:1、又は5:2、又は5:3、又は5:4、又は4:1、又は4:2、又は4:3、又は3:1、又は3:2、又は2:1、又は1:5、又は2:5、又は3:5、又は4:5、又は1:4、又は2:4、又は3:4、又は1:3、又は2:3、又は1:2、又は1:600、又は1:300、又は1:150、又は1:35、又は2:35、又は4:35、又は1:75、又は2:75、又は4:75、又は1:6000、又は1:3000、又は1:1500、又は1:350、又は2:350、又は4:350、又は1:750、又は2:750、又は4:750の比にある。それらの混合比は重量による。

【0169】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物若しくはその環境に適用する工程を含む有害生物を防除する方法において用いられることが可能であるが、手術若しくは治療によるヒト若しくは動物の身体の処置法、及びヒト又は動物の身体において実施される診断法は除かれる。

【0170】

表1.1~1.3並びに表2.1及び2.2(以下)に表されているような化合物、又は表TI(以下)に記載されている化合物1.1~1.190と、上記の1種以上の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の有効成分コンポーネントの個々の配合物からなる、「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、及び、連続して(すなわち、数時間又は数日間などの、適度に短い期間のうちに次々と)適用される場合には単一の有効成分を併用して適用することができる。表1.1~1.3並びに表2.1及び2.2(以下)に表されているような化合物、又は表T1(以下)に記載されている化合物1.1~1.190、及び上記の有効成分を適用する順番は、本発明の作用に

とって重要ではない。

【0171】

本発明に係る組成物はまた、例えば未エポキシ化又はエポキシ化植物油（例えばエポキシ化ココナツ油、ナタネ油又はダイズ油）といった安定化剤、例えばシリコン油といった消泡剤、防腐剤、粘度調節剤、バインダ及び/又は粘着剤、肥料又は特定の効果を達成するための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺菌・殺カビ剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤若しくは除草剤などのさらなる固体助剤若しくは液体助剤を含み得る。

【0172】

本発明に係る組成物は、それ自体公知である様式において、助剤の不在下で、例えば、固体有効成分を粉末化し、スクリーニングし、及び/又は圧縮することにより、及び少なくとも1種の助剤の存在下で、例えば、有効成分を1種又は複数の助剤と共に均質混合し、及び/又は粉末化することにより調製される。組成物のこれらの調製プロセス及びこれらの組成物を調製するための化合物（I）の使用も本発明の主題である。

【0173】

本発明の他の態様は、式（I）の化合物若しくは本明細書に定義されている好ましい個別の化合物、少なくとも1種の式（I）の化合物若しくは少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む組成物、又は、少なくとも1種の式（I）の化合物若しくは少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む殺菌・殺カビ若しくは殺虫性混合物であって、上記の他の殺菌・殺カビ剤若しくは殺虫剤を伴う混和物における使用であり、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、又は、昆虫若しくは好ましくは真菌性生物といった植物病原性微生物による非生体材料に係る外寄生を防除若しくは予防するための使用に関する。

【0174】

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

【0175】

防除若しくは予防とは、特に真菌性生物といった植物病原性若しくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物若しくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0176】

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

【0177】

例えば、式（I）の化合物と、所望の場合に、式（I）の化合物をカプセル化する固体又は液体補助剤又はモノマーとを含有する組成物といった配合物は、公知の様式で、典型的には、化合物を例えば溶剤、固体キャリア及び任意選択により表面活性化合物（界面活

10

20

30

40

50

性剤)といった増量剤と一緒に均質に混合し、及び/又は、粉碎することにより調製され得る。

【0178】

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

【0179】

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

10

【0180】

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

【0181】

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末(DS)、種子処理用エマルジョン(ES)、種子処理用流動性濃縮物(FS)、種子処理用溶液(LS)、種子処理用水分散性粉末(WS)、種子処理用カプセル懸濁液(CF)、種子処理用ゲル(GF)、エマルジョン濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁液(CS)、水分散性顆粒(WG)、乳化性顆粒(EG)、エマルジョン、油中水型(EO)、エマルジョン、水中油型(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油分散体(OD)、油混和性の流動体(OF)、混油性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、又は、農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

20

【0182】

このような組成物は、従来様式で、例えば有効成分を、適切な不活性配合物(希釈剤、溶剤、充填材、並びに、界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤及びアジュバント活性効果をもたらす化合物などの任意選択により他の配合成分)と混合することにより、生成され得る。また、従来緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合に採用され得る。特に、水分散性濃縮物(例えばEC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等)、水和剤及び顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例えばホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート、及びエトキシ化アルキルフェノール及びエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤及び分散剤及びアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有していてもよい。

30

【0183】

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

40

【0184】

普通、配合物は、0.01~90重量%の活性薬剤、0~20%の農学的に許容可能な界面活性剤、並びに、10~99.99%の固体又は液体不活性配合物及び補助剤を含み、活性薬剤は、少なくとも式(I)の化合物を、任意選択により他の活性薬剤、特に殺菌剤又は防腐剤等を一緒に伴って構成されている。組成物の濃縮形態は、一般に、約2~80%、好ましくは約5~70重量%の活性薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば0.01~20重量%、好ましくは0.01~5重量%の活性薬剤を含有し得る。市販製

50

品は濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは通常希釈した配合物を利用することとなる。

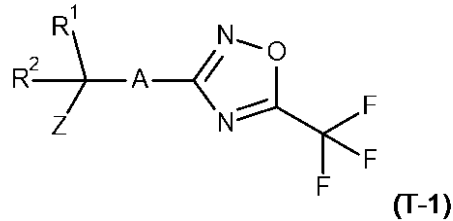
【0185】

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

【0186】

表1.1：この表は式(T-1)の65種の特定の化合物を開示するものであり：

【化22】



10

ここで、Aは2,5-チエニルであり、R¹及びR²は水素であり、並びに、Zは、表1において以下に定義されているとおりである。

【0187】

表1.2～1.3（表1.1に続く）の各々は、式(T-1)の65種の個別の化合物を利用可能にしており、ここで、A、R¹、及びR²は、表1.2～1.3（Zが具体的に定義されている表1を参照する）において具体的に定義されているとおりである。

20

【0188】

【表 1 - 1】

表1

化合物 no.	Z	化合物 no.	Z
1.001	1H-ピラゾール-4-カルボン酸	1.034	4-フルオロピラゾール-1-イル
1.002	メチル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.035	1H-ピラゾール-4-カルボニトリル
1.003	エチル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.036	5-(2-プロモフェニル) テトラゾール-1-イル
1.004	プロピル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.037	4-ニトロピラゾール-1-イル
1.005	プロパ-2-エニル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.038	ピロロ [2, 3-b] ピリジン-1-イル
1.006	プロパ-2-イニル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.039	ピラゾール-1-イル
1.007	tert-ブチル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.040	メチル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
1.008	イソプロピル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.041	4-メチルピラゾール-1-イル
1.009	2-(ジメチルアミノ) エチル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.042	1, 2, 3-トリアゾール-1-イル
1.010	2-メトキシエチル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.043	1, 2, 4-トリアゾール-1-イル
1.011	シクロプロピル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.044	5, 5-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-オン
1.012	シクロプロピルメチル 1H-ピラゾール-4-カルボキシレート	1.045	N, N-ジメチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-アミン
1.013	1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.046	ベンズイミダゾール-1-イル
1.014	N-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.047	5-メトキシベンズイミダゾール-1-イル
1.015	N-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.048	6-メトキシベンズイミダゾール-1-イル
1.016	N-プロピル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.049	1H-ピラゾール-4-カルバルデヒド
1.017	N-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.050	3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル
1.018	N-プロパ-2-エニル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.051	アゼチジン-1-イル
1.019	N-プロパ-2-イニル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.052	メチル 3-(メトキシメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキシレート
1.020	N-シクロプロピル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1.053	5-(ジフルオロメチル)-3-アミノ-1, 2, 4-トリアゾール-2-イル

10

20

30

40

【表 1 - 2】

1. 021	N-(シクロプロピルメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 054	1-ピペリジル	
1. 022	N-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 055	モルホリン-4-イル	
1. 023	N-メトキシ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 056	3-オキソ-モルホリン-4-イル	
1. 024	N-エトキシ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 057	3-オキソ-イソオキサゾリジン-2-イル	10
1. 025	N-プロパ-2-エニルオキシ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 058	5, 5-ジメチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-2-イル	
1. 026	N-メトキシ-N-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 059	2-オキソ-1-ピペリジル	
1. 027	N-エトキシ-N-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 060	3, 3-ジメチル-2-オキソ-1-ピペリジル	
1. 028	N, N-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 061	4, 4-ジメチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-2-イル	20
1. 029	N, N-ジエチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 062	4-メチル-2-オキソ-1-ピリジル	
1. 030	N-エチル-N-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 063	2-オキソ-1-ピリジル	
1. 031	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	1. 064	1, 1-ジオキソ-1, 2-チアゾリジン-2-イル	
1. 032	イミダゾール-1-イル	1. 065	2-オキソピロリジン-1-イル	
1. 033	5-メチル-3-アミノピラゾール-2-イル			30

【 0 1 8 9 】

表 1 . 2 : この表は式 (T - 1) の 6 5 種 の 特定 の 化合物 を 開示 す る も の で あ り、こ こ で、A は 3 , 5 - チエニル で あ り、並 び に、R¹ 及 び R² は 水 素 で あ り、Z は、表 1 に お い て 上 に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

【 0 1 9 0 】

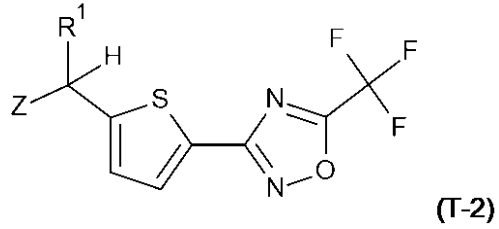
表 1 . 3 : この表は式 (T - 1) の 6 5 種 の 特定 の 化合物 を 開示 す る も の で あ り、こ こ で、A は 2 , 5 - チエニル で あ り、R¹ は 水 素 で あ り、R² は メチル で あ り、Z は、表 1 に お い て 上 に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

40

【 0 1 9 1 】

表 2 . 1 : この表は式 (T - 2) の 3 7 2 種 の 特定 の 化合物 を 開示 す る も の で あ り、

【化 2 3】



ここで、 R^1 は水素であり、並びに、 Z は、表 2 において以下に定義されているとおりである。

10

【0192】

表 2 . 2 (表 2 . 1 に続く) は、式 (T - 2) の 3 7 2 種 の 個 別 の 化 合 物 を 利 用 可 能 に して お り、こ こ で、 R^1 は、表 2 . 2 (Z が 具 体 的 に 定 義 さ れ て い る 表 2 を 参 照 す る) に お い て 具 体 的 に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

【0193】

【表 2 - 1】

表2

化合物 no.	Z	化合物 no.	Z
2.001	2H-ピラゾール-3-カルボン酸	2.187	1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボン酸
2.002	メチル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.188	メチル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.003	エチル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.189	エチル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.004	プロピル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.190	プロピル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.005	プロパ-2-エニル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.191	プロパ-2-エニル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.006	プロパ-2-イニル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.192	プロパ-2-イニル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.007	tert-ブチル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.193	tert-ブチル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.008	イソプロピル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.194	イソプロピル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.009	2-(ジメチルアミノ)エチル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.195	2-(ジメチルアミノ)エチル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.010	2-メトキシエチル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.196	2-メトキシエチル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.011	シクロプロピル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.197	シクロプロピル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.012	シクロプロピルメチル 2H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.198	シクロプロピルメチル 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート
2.013	2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.199	1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.014	N-メチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.200	N-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.015	N-エチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.201	N-エチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.016	N-プロピル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.202	N-プロピル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.017	N-イソプロピル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.203	N-イソプロピル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド

10

20

30

40

【表 2 - 2】

2.018	N-プロパ-2-エニル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.204	N-プロパ-2-エニル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.019	N-プロパ-2-イニル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.205	N-プロパ-2-イニル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.020	N-シクロプロピル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.206	N-シクロプロピル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.021	N-(シクロプロピルメチル)-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.207	N-(シクロプロピルメチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.022	N-(2-メトキシエチル)-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.208	N-(2-メトキシエチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.023	N-メトキシ-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.209	N-メトキシ-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.024	N-エトキシ-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.210	N-エトキシ-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.025	N-プロパ-2-エニルオキシ-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.211	N-プロパ-2-エニルオキシ-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.026	N-メトキシ-N-メチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.212	N-メトキシ-N-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.027	N-エトキシ-N-メチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.213	N-エトキシ-N-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.028	N,N-ジメチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.214	N,N-ジメチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.029	N,N-ジエチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.215	N,N-ジエチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.030	N-エチル-N-メチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.216	N-エチル-N-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.031	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-2H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.217	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド
2.032	1H-ピラゾール-3-カルボン酸	2.218	3H-トリアゾール-4-カルボン酸
2.033	メチル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.219	メチル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.034	エチル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.220	エチル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.035	プロピル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2.221	プロピル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート

10

20

30

40

【表 2 - 3】

2. 036	プロパ-2-エニル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 222	プロパ-2-エニル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 037	プロパ-2-イニル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 223	プロパ-2-イニル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 038	tert-ブチル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 224	tert-ブチル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 039	イソプロピル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 225	イソプロピル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 040	2-(ジメチルアミノ)エチル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 226	2-(ジメチルアミノ)エチル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 041	2-メトキシエチル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 227	2-メトキシエチル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 042	シクロプロピル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 228	シクロプロピル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 043	シクロプロピルメチル 1H-ピラゾール-3-カルボキシレート	2. 229	シクロプロピルメチル 3H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2. 044	1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 230	3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 045	N-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 231	N-メチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 046	N-エチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 232	N-エチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 047	N-プロピル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 233	N-プロピル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 048	N-イソプロピル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 234	N-イソプロピル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 049	N-プロパ-2-エニル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 235	N-プロパ-2-エニル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 050	N-プロパ-2-イニル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 236	N-プロパ-2-イニル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 051	N-シクロプロピル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 237	N-シクロプロピル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 052	N-(シクロプロピルメチル)-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 238	N-(シクロプロピルメチル)-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 053	N-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 239	N-(2-メトキシエチル)-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 054	N-メトキシ-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 240	N-メトキシ-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 055	N-エトキシ-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 241	N-エトキシ-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 056	N-プロパ-2-エニルオキシ-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2. 242	N-プロパ-2-エニルオキシ-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド

10

20

30

40

【表 2 - 4】

2.057	N-メトキシ-N-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.243	N-メトキシ-N-メチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.058	N-エトキシ-N-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.244	N-エトキシ-N-メチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.059	N,N-ジメチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.245	N,N-ジメチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.060	N,N-ジエチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.246	N,N-ジエチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.061	N-エチル-N-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.247	N-エチル-N-メチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.062	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド	2.248	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-3H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.063	1H-イミダゾール-2-カルボン酸	2.249	2H-トリアゾール-4-カルボン酸
2.064	メチル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.250	メチル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.065	エチル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.251	エチル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.066	プロピル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.252	プロピル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.067	プロパ-2-エニル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.253	プロパ-2-エニル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.068	プロパ-2-イニル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.254	プロパ-2-イニル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.069	tert-ブチル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.255	tert-ブチル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.070	イソプロピル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.256	イソプロピル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.071	2-(ジメチルアミノ)エチル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.257	2-(ジメチルアミノ)エチル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.072	2-メトキシエチル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.258	2-メトキシエチル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.073	シクロプロピル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.259	シクロプロピル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.074	シクロプロピルメチル 1H-イミダゾール-2-カルボキシレート	2.260	シクロプロピルメチル 2H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.075	1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.261	2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.076	N-メチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.262	N-メチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.077	N-エチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.263	N-エチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド

10

20

30

40

【表 2 - 5】

2.078	N-プロピル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.264	N-プロピル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.079	N-イソプロピル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.265	N-イソプロピル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.080	N-プロパ-2-エニル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.266	N-プロパ-2-エニル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.081	N-プロパ-2-イニル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.267	N-プロパ-2-イニル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.082	N-シクロプロピル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.268	N-シクロプロピル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.083	N-(シクロプロピルメチル)-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.269	N-(シクロプロピルメチル)-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.084	N-(2-メトキシエチル)-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.270	N-(2-メトキシエチル)-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.085	N-メトキシ-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.271	N-メトキシ-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.086	N-エトキシ-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.272	N-エトキシ-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.087	N-プロパ-2-エニルオキシ-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.273	N-プロパ-2-エニルオキシ-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.088	N-メトキシ-N-メチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.274	N-メトキシ-N-メチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.089	N-エトキシ-N-メチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.275	N-エトキシ-N-メチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.090	N,N-ジメチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.276	N,N-ジメチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.091	N,N-ジエチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.277	N,N-ジエチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.092	N-エチル-N-メチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.278	N-エチル-N-メチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.093	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド	2.279	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-2H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2.094	1H-イミダゾール-4-カルボン酸	2.280	1H-トリアゾール-4-カルボン酸
2.095	メチル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2.281	メチル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.096	エチル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2.282	エチル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.097	プロピル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2.283	プロピル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート
2.098	プロパ-2-エニル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2.284	プロパ-2-エニル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート

10

20

30

40

【表 2 - 6】

2. 099	プロパ-2-イニル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 285	プロパ-2-イニル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート	
2. 100	tert-ブチル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 286	tert-ブチル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート	
2. 101	イソプロピル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 287	イソプロピル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート	
2. 102	2-(ジメチルアミノ)エチル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 288	2-(ジメチルアミノ)エチル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート	10
2. 103	2-メトキシエチル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 289	2-メトキシエチル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート	
2. 104	シクロプロピル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 290	シクロプロピル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート	
2. 105	シクロプロピルメチル 1H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 291	シクロプロピルメチル 1H-トリアゾール-4-カルボキシレート	
2. 106	1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 292	1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	20
2. 107	N-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 293	N-メチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 108	N-エチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 294	N-エチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 109	N-プロピル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 295	N-プロピル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 110	N-イソプロピル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 296	N-イソプロピル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 111	N-プロパ-2-エニル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 297	N-プロパ-2-エニル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	30
2. 112	N-プロパ-2-イニル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 298	N-プロパ-2-イニル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 113	N-シクロプロピル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 299	N-シクロプロピル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 114	N-(シクロプロピルメチル)-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 300	N-(シクロプロピルメチル)-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 115	N-(2-メトキシエチル)-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 301	N-(2-メトキシエチル)-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	40
2. 116	N-メトキシ-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 302	N-メトキシ-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 117	N-エトキシ-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 303	N-エトキシ-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	
2. 118	N-プロパ-2-エニルオキシ-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 304	N-プロパ-2-エニルオキシ-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド	

【表 2 - 7】

2. 119	N-メトキシ-N-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 305	N-メトキシ-N-メチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 120	N-エトキシ-N-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 306	N-エトキシ-N-メチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 121	N,N-ジメチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 307	N,N-ジメチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 122	N,N-ジエチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 308	N,N-ジエチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 123	N-エチル-N-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 309	N-エチル-N-メチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 124	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 310	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-1H-トリアゾール-4-カルボキサミド
2. 125	3H-イミダゾール-4-カルボン酸	2. 311	1H-テトラゾール-5-カルボン酸
2. 126	メチル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 312	メチル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 127	エチル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 313	エチル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 128	プロピル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 314	プロピル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 129	プロパ-2-エニル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 315	プロパ-2-エニル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 130	プロパ-2-イニル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 316	プロパ-2-イニル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 131	tert-ブチル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 317	tert-ブチル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 132	イソプロピル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 318	イソプロピル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 133	2-(ジメチルアミノ)エチル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 319	2-(ジメチルアミノ)エチル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 134	2-メトキシエチル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 320	2-メトキシエチル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 135	シクロプロピル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 321	シクロプロピル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 136	シクロプロピルメチル 3H-イミダゾール-4-カルボキシレート	2. 322	シクロプロピルメチル 1H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 137	3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 323	1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 138	N-メチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 324	N-メチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 139	N-エチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 325	N-エチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド

10

20

30

40

【表 2 - 8】

2. 140	N-プロピル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 326	N-プロピル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 141	N-イソプロピル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 327	N-イソプロピル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 142	N-プロパ-2-エニル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 328	N-プロパ-2-エニル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 143	N-プロパ-2-イニル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 329	N-プロパ-2-イニル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 144	N-シクロプロピル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 330	N-シクロプロピル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 145	N-(シクロプロピルメチル)-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 331	N-(シクロプロピルメチル)-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 146	N-(2-メトキシエチル)-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 332	N-(2-メトキシエチル)-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 147	N-メトキシ-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 333	N-メトキシ-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 148	N-エトキシ-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 334	N-エトキシ-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 149	N-プロパ-2-エニルオキシ-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 335	N-プロパ-2-エニルオキシ-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 150	N-メトキシ-N-メチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 336	N-メトキシ-N-メチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 151	N-エトキシ-N-メチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 337	N-エトキシ-N-メチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 152	N, N-ジメチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 338	N, N-ジメチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 153	N, N-ジエチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 339	N, N-ジエチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 154	N-エチル-N-メチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 340	N-エチル-N-メチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 155	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-3H-イミダゾール-4-カルボキサミド	2. 341	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-1H-テトラゾール-5-カルボキサミド
2. 156	2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボン酸	2. 342	2H-テトラゾール-5-カルボン酸
2. 157	メチル 2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート	2. 343	メチル 2H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 158	エチル 2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート	2. 344	エチル 2H-テトラゾール-5-カルボキシレート
2. 159	プロピル 2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート	2. 345	プロピル 2H-テトラゾール-5-カルボキシレート

10

20

30

40

【表 2 - 9】

2. 160	プロパ-2-エニル 2H-1, 2, 4- トリアゾール-3-カルボキシレ- レート	2. 346	プロパ-2-エニル 2H-テトラ ゾール-5-カルボキシレ- ート	
2. 161	プロパ-2-イニル 2H-1, 2, 4- トリアゾール-3-カルボキシレ- レート	2. 347	プロパ-2-イニル 2H-テトラ ゾール-5-カルボキシレ- ート	
2. 162	tert-ブチル 2H-1, 2, 4-トリ アゾール-3-カルボキシレ- ート	2. 348	tert-ブチル 2H-テトラゾ- ール-5-カルボキシレ- ート	10
2. 163	イソプロピル 2H-1, 2, 4-トリ アゾール-3-カルボキシレ- ート	2. 349	イソプロピル 2H-テトラゾ- ール-5-カルボキシレ- ート	
2. 164	2-(ジメチルアミノ)エチル 2H-1, 2, 4-トリアゾール-3- カルボキシレ- ート	2. 350	2-(ジメチルアミノ)エチル 2H-テトラゾール-5-カルボ キシレ- ート	
2. 165	2-メトキシエチル 2H- 1, 2, 4-トリアゾール-3-カル ボキシレ- ート	2. 351	2-メトキシエチル 2H-テト ラゾール-5-カルボキシレ- ート	20
2. 166	シクロプロピル 2H-1, 2, 4- トリアゾール-3-カルボキシレ- ート	2. 352	シクロプロピル 2H-テトラ ゾール-5-カルボキシレ- ート	
2. 167	シクロプロピルメチル 2H- 1, 2, 4-トリアゾール-3-カル ボキシレ- ート	2. 353	シクロプロピルメチル 2H- テトラゾール-5-カルボキシ レ- ート	
2. 168	2H-1, 2, 4-トリアゾール-3- カルボキサミド	2. 354	2H-テトラゾール-5-カルボ キサミド	
2. 169	N-メチル-2H-1, 2, 4-トリア ゾール-3-カルボキサミド	2. 355	N-メチル-2H-テトラゾール- 5-カルボキサミド	
2. 170	N-エチル-2H-1, 2, 4-トリア ゾール-3-カルボキサミド	2. 356	N-エチル-2H-テトラゾール- 5-カルボキサミド	30
2. 171	N-プロピル-2H-1, 2, 4-トリ アゾール-3-カルボキサミド	2. 357	N-プロピル-2H-テトラゾ- ール-5-カルボキサミド	
2. 172	N-イソプロピル-2H-1, 2, 4- トリアゾール-3-カルボキサ ミド	2. 358	N-イソプロピル-2H-テトラ ゾール-5-カルボキサミド	
2. 173	N-プロパ-2-エニル-2H- 1, 2, 4-トリアゾール-3-カル ボキサミド	2. 359	N-プロパ-2-エニル-2H-テト ラゾール-5-カルボキサミド	
2. 174	N-プロパ-2-イニル-2H- 1, 2, 4-トリアゾール-3-カル ボキサミド	2. 360	N-プロパ-2-イニル-2H-テト ラゾール-5-カルボキサミド	40
2. 175	N-シクロプロピル-2H- 1, 2, 4-トリアゾール-3-カル ボキサミド	2. 361	N-シクロプロピル-2H-テト ラゾール-5-カルボキサミド	
2. 176	N-(シクロプロピルメチル)- 2H-1, 2, 4-トリアゾール-3- カルボキサミド	2. 362	N-(シクロプロピルメチル)- 2H-テトラゾール-5-カルボ キサミド	

【表 2 - 10】

2. 177	N-(2-メトキシエチル)-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 363	N-(2-メトキシエチル)-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	
2. 178	N-メトキシ-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 364	N-メトキシ-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	
2. 179	N-エトキシ-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 365	N-エトキシ-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	
2. 180	N-プロパ-2-エニルオキシ-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 366	N-プロパ-2-エニルオキシ-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	10
2. 181	N-メトキシ-N-メチル-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 367	N-メトキシ-N-メチル-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	
2. 182	N-エトキシ-N-メチル-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 368	N-エトキシ-N-メチル-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	
2. 183	N, N-ジメチル-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 369	N, N-ジメチル-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	20
2. 184	N, N-ジエチル-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 370	N, N-ジエチル-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	
2. 185	N-エチル-N-メチル-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 371	N-エチル-N-メチル-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	
2. 186	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-2H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド	2. 372	N-プロパ-2-エニル-N-メチル-2H-テトラゾール-5-カルボキサミド	30

【0194】

表 2 . 2 : この表は式 (T - 2) の 3 7 2 種 の 特 定 の 化 合 物 を 開 示 す る も の で あり、こ こ で、R¹ は メ チ ル で あり、並 び に、Z は、表 2 に お い て 上 に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

【0195】

(ラジカルとして特定される化合物 No . 1 . 0 3 4、1 . 0 3 6 ~ 1 . 0 3 9、1 . 0 4 1 ~ 1 . 0 4 3、1 . 0 4 6 ~ 1 . 0 4 8、1 . 0 5 0、1 . 0 5 1、1 . 0 5 3 ~ 1 . 0 6 5 を 除 いて) 上 の 表 1 及 び 2 に お い て 定 義 さ れ て い る Z に つ い て、Z 基 は、利 用 可 能 な 環 窒 素 (N - H 基 で 示 さ れ る よ う な) が、本 発 明 の 式 (I) の 化 合 物 に つ い て の Z ラジカルに従った分子の残部への結合点である化合物として開示されている。

【0196】

例として、表 1 に お け る 化 合 物 1 . 0 0 1 (1 H - ピ ラ ゾ ー ル - 4 - カ ル ボ ン 酸) の Z ラジカルは、

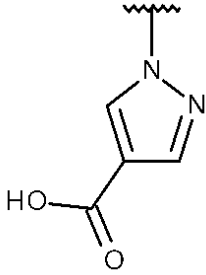
10

20

30

40

【化 2 4】

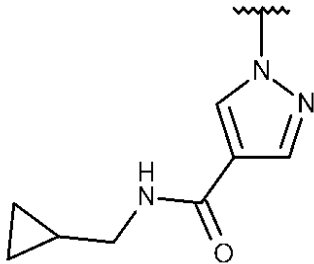


であり；

10

表 1 における化合物 1 . 0 2 1 (N - (シクロプロピルメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド) の Z ラジカルは、

【化 2 5】

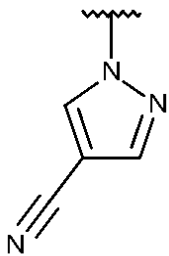


20

であり；

表 1 における化合物 1 . 0 3 5 (1 H - ピラゾール - 4 - カルボニトリル) の Z ラジカルは、

【化 2 6】

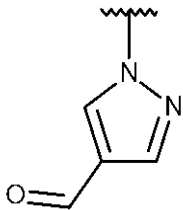


30

であり；

表 1 における化合物 1 . 0 4 9 (1 H - ピラゾール - 4 - カルバルデヒド) の Z ラジカルは、

【化 2 7】

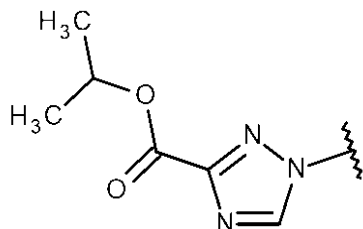


40

であり；

表 2 における化合物 2 . 1 9 4 (イソプロピル 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - カルボキシレート) の Z ラジカルは、

【化 2 8】



である、等である。

【0197】

以下の一般的な手順が、式(I)の化合物を提供するために適切なビルディングブロック(式(II)及び(III)の化合物)を使用する組み合わせ様式で用いられた。以下の組み合わせプロトコルによって調製された化合物は、LC/MS方法Bを用いて分析された。

【実施例】

【0198】

以下の実施例は本発明を例示するものである。本発明の化合物は低施用量でのより高い効力により公知の化合物から区別可能であり、これは、実施例において概説されている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm、又は0.2 ppmといったより少ない施用量を用いることで当業者により検証可能である。

【0199】

式(I)の化合物は、とりわけ、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る有利なレベルの生物学的活性、又は農芸化学有効成分としての使用に係る優れた特性(例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全プロファイル(向上した作物の耐性を含む)、向上した物理化学的特性、又は高い生分解性)を含む、多数の有益性を有し得る。

【0200】

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

【0201】

装置及び方法Aの説明は以下のとおりである：

Waters製のSQ Detector 2

イオン化法：エレクトロスプレー

極性：陽イオン及び陰イオン

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

質量範囲：100~900 Da

DAD波長範囲(nm)：210~500

以下のHPLC勾配条件によるWaters ACQUITY UPLC法

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

【0202】

10

20

30

40

【表3】

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

【0203】

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

10

【0204】

LC/MS装置及び方法Bの説明は以下のとおりである：

Waters製のSQ Detector 2

イオン化法：エレクトロスプレー

極性：陽イオン

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

質量範囲：140~800 Da

DAD波長範囲(nm)：210~400

20

以下のHPLC勾配条件によるWaters ACQUITY UPLC法：

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

【0205】

【表4】

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

30

【0206】

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

【0207】

LC/MS装置及び方法Cの説明は以下のとおりである：

Waters製のSQ Detector 2

イオン化法：エレクトロスプレー

Waters製のACQUITY H Class UPLC、Mass Spectrometer

40

極性：陽及び陰極性スイッチ

スキャンタイプ MS1 Scan

キャピラリ(kV)3.00、コーン(V)40.00、脱溶剤温度()500、コーンガス流(L/Hr)50、脱溶剤ガス流(L/Hr)1000

質量範囲：0~2000 Da

DAD波長範囲(nm)：200~350

以下のHPLC勾配条件によるWaters ACQUITY UPLC法

(溶剤A：水+0.1%ギ酸及び溶剤B：アセトニトリル)

【0208】

50

【表 5】

時間(分)	A (%)	B (%)	流量(ml/分)
0	70	30	0.5
0.05	70	30	0.5
0.8	5	95	0.5
1.8	5	95	0.5
2.45	70	30	0.5
2.50	70	30	0.5

10

【0209】

カラムタイプ：Waters ACQUITY UPLC BEH C18；カラム長：50mm；カラム内径：2.1mm；粒径：1.7ミクロン；温度：35。

【0210】

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

【0211】

配合物実施例

【0212】

20

【表 6】

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

30

【0213】

有効成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈された所望の濃度の懸濁液をもたらすことが可能である水和剤を得た。

【0214】

【表 7】

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

40

【0215】

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

【0216】

乳化性濃縮物

有効成分[式(I)の化合物] 10%

オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル 3%

50

(4 ~ 5 m o l のエチレンオキシド)
 ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 3 %
 ヒマシ油ポリグリコールエーテル (3 5 m o l のエチレンオキシド) 4 %
 シクロヘキサノン 3 0 %
 キシレン混合物 5 0 %

【 0 2 1 7 】

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

【 0 2 1 8 】

【表 8】

10

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

【 0 2 1 9 】

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

20

【 0 2 2 0 】

押し出し顆粒
 有効成分 [式 (I) の化合物] 1 5 %
 リグノスルホン酸ナトリウム 2 %
 カルボキシメチルセルロース 1 %
 カオリン 8 2 %

【 0 2 2 1 】

有効成分を補助剤と混合及び粉砕し、この混合物を水で湿らせる。この混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

【 0 2 2 2 】

30

コーティングされた顆粒
 有効成分 [式 (I) の化合物] 8 %
 ポリエチレングリコール (m o l . w t . 2 0 0) 3 %
 カオリン 8 9 %

【 0 2 2 3 】

細かく粉砕した有効成分を、ミキサ中において、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉末を発生しないコーティングされた顆粒がこのようにして得られる。

【 0 2 2 4 】

40

懸濁液濃縮物
 有効成分 [式 (I) の化合物] 4 0 %
 プロピレングリコール 1 0 %
 ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル (1 5 m o l のエチレンオキシド) 6 %
 リグノスルホン酸ナトリウム 1 0 %
 カルボキシメチルセルロース 1 %
 シリコン油 (7 5 % 水中エマルジョンの形態) 1 %
 水 3 2 %

【 0 2 2 5 】

細かく粉砕した有効成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈するこ

50

とによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物並びに植物繁殖体を処理及び保護可能である。

【0226】

種子処理に係る流動性濃縮物

有効成分〔式(I)の化合物〕 40%

プロピレングリコール 5%

コポリマーブタノール PO/EO 2%

10~20モルのEOを伴うトリスチレンフェノール 2%

1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(20%水溶液の形態) 0.5%

モノアゾ-顔料カルシウム塩 5%

シリコーン油(75%水中エマルジョンの形態) 0.2%

水 45.3%

【0227】

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

【0228】

緩効性カプセル懸濁液

28部の組み合わせた式Iの化合物を、2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート混合物(8:1)と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。この混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。

【0229】

得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の有効成分を含有する。中程度のカプセル径は8~15ミクロンである。

【0230】

得られる配合物を、目的に好適な装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

【0231】

AIBN = アゾビスイソブチロニトリル

DMF = ジメチルホルムアミド

DMA = ジメチルアセトアミド

DIPEA = N,N-ジ-イソプロピルエチルアミン

EtOAc = 酢酸エチル

HCl = 塩酸

mp = 融点

= 度摂氏

MeOH = メチルアルコール

NaOH = 水酸化ナトリウム

NBS = N-ブロモスクシンイミド

min = 分

Rt = 室温

h = 時間

TFAA = 無水トリフルオロ酢酸

THF = テトラヒドロフラン

R_t = 保持時間(分単位)

10

20

30

40

50

LC/M S = 液体クロマトグラフィー質量分析法 (LC/M S 分析のために用いられる装置及び方法の説明は上に示されている)

【0232】

調製実施例

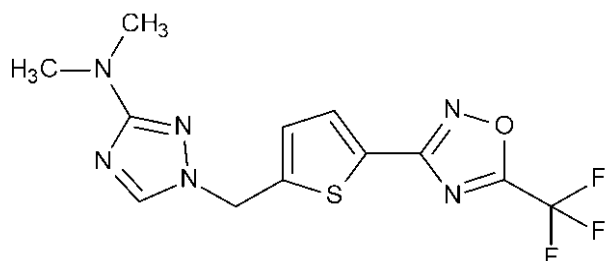
上及び下の両方に記載される合成技術を用いて、式 (I) の化合物は相応に調製し得る。

【0233】

実施例 1 : この実施例は、N, N - ジメチル 1 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - アミン (表 T 1 の化合物 1.4) の調製を例示する。

10

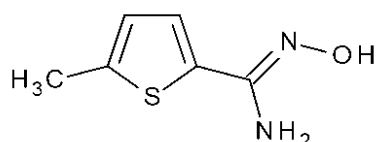
【化 29】



ステップ 1 : N' - ヒドロキシ - 5 - メチル - チオフェン - 2 - カルボキサミジンの調製

20

【化 30】



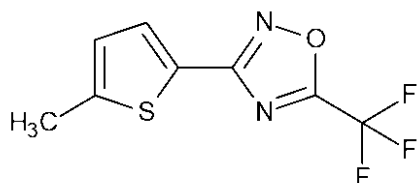
室温で攪拌する 5 - メチルチオフェン - 2 - カルボニトリル (9.0 g、73 mmol) のエタノール (365 mL) 中の懸濁液に、トリエチルアミン (20.6 mL、146 mmol) を添加し、続いて塩酸ヒドロキシルアミン (10.3 g、146 mmol) を少しずつ導入した。反応内容物を還流で 3.5 時間加熱し、25 に冷却し、減圧下で濃縮して N' - ヒドロキシ - 5 - メチル - チオフェン - 2 - カルボキサミジンを粗残渣として得、それをさらに精製することなく次の変換に使用した。LC/M S (方法 A) 保持時間 = 0.24 分、156 (M + H)。

30

【0234】

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

【化 31】



40

粗 N' - ヒドロキシ - 5 - メチル - チオフェン - 2 - カルボキサミジン (32.0 g) のテトラヒドロフラン (1.0 L) 中の懸濁液に、ピリジン (24 mL、292 mmol) を導入し、内容物を 10 に冷却した。この懸濁液に、TFAA (30.9 mL、219 mmol) を滴々導入した。反応混合物を一晩で 25 に暖ませ、次に減圧で濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルに溶解させ、1 M の HCl 水溶液、水、及び飽和 Na₂CO₃ 水溶液で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、揮発性物質を減圧で除去した。粗残渣を、シクロヘキサン/EtOAc 溶離液勾配を用いるシリカゲルによるフラ

50

ッシュクロマトグラフィによって精製して3-(5-メチル-2-チエニル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールを清透な油(13.1g、76%収率)として得た。LC/MS(方法A)保持時間=1.13分、質量は検出せず。

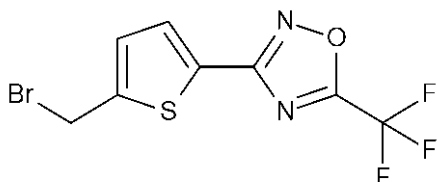
^1H NMR(400MHz, CDCl_3) ppm: 7.68(d, 1H), 6.84(d, 1H), 2.57(s, 3H).

^{19}F NMR(400MHz, CDCl_3) ppm: -65.44(s).

【0235】

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

【化32】



アルゴン雰囲気下の3-(5-メチル-2-チエニル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(13.1g、55.7mmol)及びテトラクロロメタン(111mL)の溶液に、AIBN(0.93g、5.6mmol)、次にNBS(11.02g、61.3mmol)を添加した。内容物を70℃で18時間加熱した。混合物を25℃に冷却し、次にジクロロメタン及び水で希釈した。層を分離し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、揮発性物質を減圧下で除去した。粗残渣を、シクロヘキサン/EtOAc溶離液勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製して3-[5-(プロモメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールを黄色の油(3.86g、22%収率)として得た。LC/MS(方法A)保持時間=1.14分、質量は検出せず。

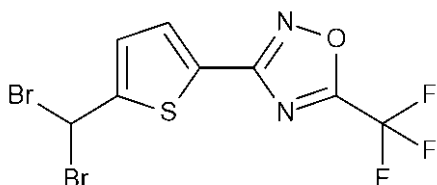
^1H NMR(400MHz, CDCl_3) ppm: 8.11(d, 1H), 7.55(d, 1H), 4.53(s, 2H).

^{19}F NMR(400MHz, CDCl_3) ppm: -65.31(s).

【0236】

3-[5-(ジプロモメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールが副生成物として黄色の非晶性固体(13.0g)として単離された。

【化33】



^1H NMR(400MHz, CDCl_3) ppm: 7.73(d, 1H), 7.32(d, 1H), 6.91(s, 1H).

【0237】

ステップ4: N,N-ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-アミンの調製

3-[5-(プロモメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(150mg、0.48mmol)、N,N-ジメチル-4H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン(64mg、0.57mmol)、及び炭酸カリウム(133mg、0.96mmol)のアセトニトリル(6.0mL)中の溶液を室温

10

20

30

40

50

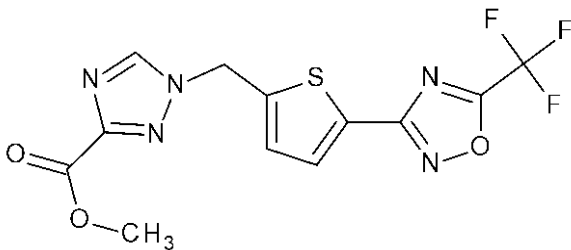
で一晩攪拌した。固形分をろ過によって除去し、酢酸エチルで洗浄し、揮発性物質を減圧下で除去した。得られた残渣を、シクロヘキサン/EtOAc 溶離液勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製してN,N-ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-アミンを黄色の固体(49mg、30%収率)として得た。LC/MS(方法A)保持時間=0.96分、345(M+H). mp: 113~116°C

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) ppm: 7.78 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 5.37 (s, 2H), 2.99 (s, 6H).

【0238】

実施例2: この実施例は、メチル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート(表T1の化合物1.6)の調製を例示する。

【化34】



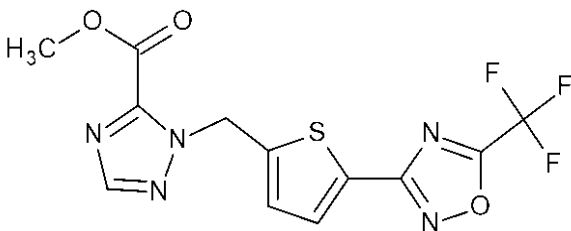
3-[5-(プロモメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(1.0g、3.2mmol)と、メチル 1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート(610mg、4.8mmol)と炭酸カリウム(880mg、6.4mmol)とのアセトニトリル(32mL)中の混合物を、110で2時間加熱した。得られたオレンジ色の懸濁液をろ過して固形分を除去し、濾液を次に減圧下で濃縮した。得られた粗残渣を、シクロヘキサン/EtOAc 勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製して750mgの表題化合物を白色の固体として得た。LC/MS(方法A)保持時間=0.91分、360(M+H).

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.25 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 5.65 (s, 2H), 4.05 (s, 3H).

【0239】

メチル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート(表T1の化合物1.55)が、副生成物として無色のガム(306mg)の形態で単離された、LC/MS(方法A)保持時間=0.91分、360(M+H).

【化35】



$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.05 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 6.50 (s, 2H), 4.05 (s, 3H).

【0240】

実施例3: この実施例は、プロピル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリア

10

20

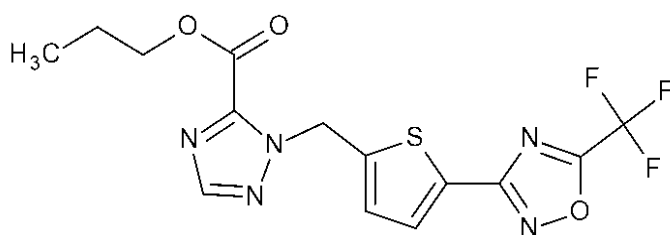
30

40

50

ゾール - 3 - カルボキシレート (表 T 1 の化合物 1 . 4 4) の調製を例示する。

【化 3 6】



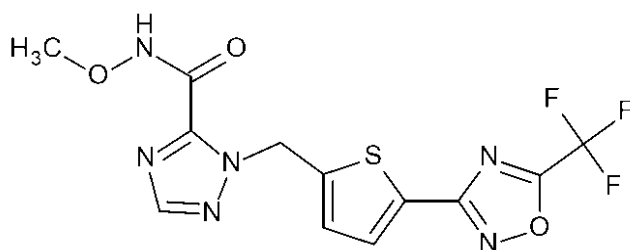
メチル 2 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - カルボキシレート (1 0 0 m g 、 0 . 2 7 m m o l) 及びプロパノール (0 . 8 3 m L) の溶液に、濃硫酸 (0 . 0 1 m L) を導入した。白色の懸濁液を還流下に 1 2 時間攪拌し、その時間の間に、それは、清透な溶液に変わった。反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣を、シクロヘキサン / 酢酸エチル勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製して 4 7 m g の表題化合物を無色のガムとして得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1 . 1 0 分、3 8 8 (M + H) .

^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m : 8 . 0 5 (s , 1 H) , 7 . 7 5 (d , 1 H) , 7 . 2 5 (d , 1 H) , 6 . 0 5 (s , 2 H) , 4 . 4 5 (t , 2 H) , 1 . 8 5 (m , 2 H) , 1 . 0 5 (t , 3 H) .

【 0 2 4 1】

実施例 4 : この実施例は、N - メチル - N - メトキシ - 2 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - カルボキサミド (表 T 1 の化合物 1 . 6 1) の調製を例示する。

【化 3 7】



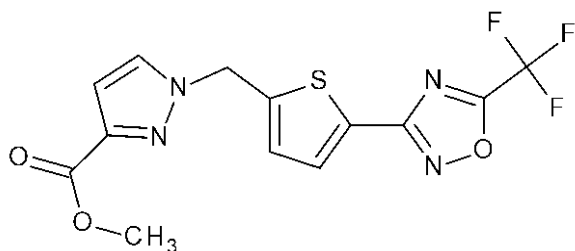
塩酸 O - メチルヒドロキシルアミン (1 3 6 m g 、 1 . 6 7 m m o l) のトルエン (2 m L) 中の清透な溶液に、塩化ジエチルアルミニウム (トルエン中の 1 M 、 1 . 6 7 m L 、 1 . 6 7 m m o l) を滴々導入した。10分後に、メチル 2 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - カルボキシレート (1 5 0 m g 、 0 . 4 1 m m o l) を添加し、混合物を 7 0 で 1 2 時間加熱した。反応を水 (約 0 . 0 3 0 m L) でクエンチし、懸濁液を減圧下で濃縮した。得られた残渣を、シクロヘキサン / E t O A c 勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製して 6 4 m g の表題化合物を白色の固体として得た。m . p : 1 3 5 ~ 1 4 0 ; LC / MS (方法 A) 保持時間 = 0 . 9 3 分、3 7 5 (M + H) .

^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m : 7 . 9 5 (s , 1 H) , 7 . 7 5 (d , 1 H) , 7 . 3 5 (d , 1 H) , 6 . 1 2 (s , 2 H) , 3 . 9 7 (s , 3 H) .

【 0 2 4 2】

実施例 5 : この実施例は、メチル 1 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 3 - カルボキシレート (表 T 1 の化合物 1 . 5 3) の調製を例示する。

【化38】



3 - [5 - (ブロモメチル) - 2 - チエニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール (1 . 0 g 、 3 . 2 m m o l) と、メチル 1 H - ピラゾール - 3 - カルボキシレート (6 0 0 m g 、 4 . 8 m m o l) と炭酸カリウム (8 8 0 m g 、 6 . 4 m m o l) とのアセトニトリル (3 2 m L) 中の混合物を、110 で2時間加熱した。オレンジ色の懸濁液をろ過して固形分を除去し、濾液を次に減圧下で濃縮した。得られた粗残渣を、シクロヘキサン / E t O A c 勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製して610mgの表題化合物を白色の固体として得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1 . 0 0 分、3 5 9 (M + H) .

10

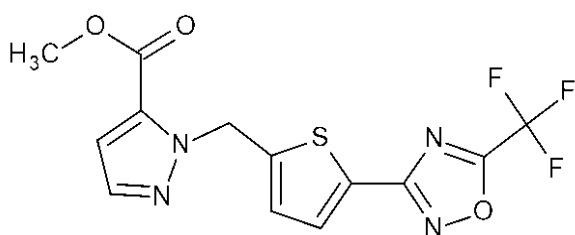
^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m : 7 . 7 8 (d , 1 H) , 7 . 5 1 (d , 1 H) , 7 . 1 2 (d , 1 H) , 6 . 8 9 (d , 1 H) , 5 . 6 1 (s , 2 H) , 3 . 9 8 (s , 3 H) .

20

【0243】

メチル 2 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 3 - カルボキシレート (表 T 1 の化合物 1 . 5 4) が、副生成物として白色の固体 (2 7 4 m g) の形態で単離された。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1 . 1 0 分、3 5 9 (M + H) .

【化39】



30

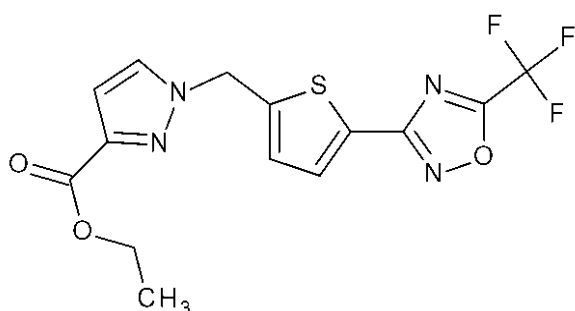
^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m : 7 . 7 2 (d , 1 H) , 7 . 5 8 (d , 1 H) , 7 . 1 8 (d , 1 H) , 6 . 8 9 (d , 1 H) , 6 . 0 5 (s , 2 H) , 3 . 9 8 (s , 3 H) .

【0244】

実施例6：この実施例は、エチル 1 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 3 - カルボキシレート (表 T 1 の化合物 1 . 4 2) の調製を例示する。

40

【化40】



50

メチル 1 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 3 - カルボキシレート (1 0 0 m g 、 0 . 2 7 m m o l) 及びエタノール (0 . 8 3 m L) の溶液に、濃硫酸 (0 . 0 1 m L) を導入した。白色の懸濁液を還流で 2 時間攪拌し、その時間の間に、それは、清透な溶液になった。反応混合物を減圧下で濃縮し、得られた粗残渣を、水 / アセトニトリル溶液勾配を用いる逆相カラムクロマトグラフィによって精製して 2 0 m g の表題化合物を白色の固体として得た。mp : 1 2 0 ~ 1 2 4 ; LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1 . 0 7 分、3 7 3 (M + H) .

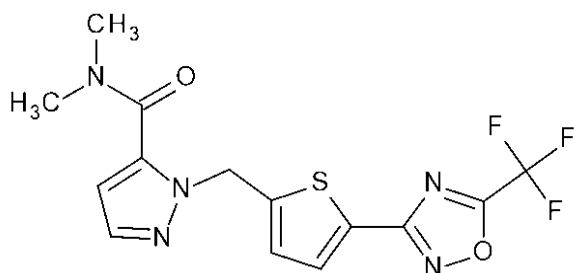
^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) ppm : 7 . 7 1 (d , 1 H) , 7 . 5 2 (d , 1 H) , 7 . 1 2 (d , 1 H) , 6 . 8 5 (d , 1 H) , 5 . 6 2 (s , 2 H) , 4 . 4 5 (q , 2 H) , 1 . 4 5 (t , 3 H) .

10

【 0 2 4 5 】

実施例 7 : この実施例は、N , N - ジメチル - 2 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 3 - カルボキサミド (表 T 1 の化合物 1 . 5 8) の調製を例示する。

【 化 4 1 】



20

塩酸 N - メチルメタンアミン (1 3 6 m g 、 1 . 6 7 m m o l) のトルエン (2 m L) 中の清透な溶液に、塩化ジエチルアルミニウム (トルエン中の 1 M 、 1 . 6 7 m L 、 1 . 6 7 m m o l) を滴々導入した。10分後に、メチル 2 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 3 - カルボキシレート (1 5 0 m g 、 0 . 4 1 m m o l) を添加し、混合物を 7 0 で 1 2 時間加熱した。反応を水 (約 0 . 0 3 m L) でクエンチし、懸濁液を減圧下で濃縮した。得られた残渣を、シクロヘキサン / E t O A c 勾配を用いるシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィによって精製して表題化合物 (1 0 5 m g 、 6 7 % 収率) を黄色のガムとして得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 0 . 9 6 分、3 7 2 (M + H)

30

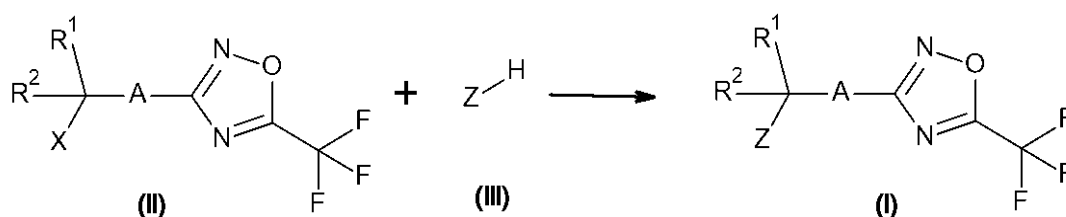
^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) ppm : 7 . 7 1 (d , 1 H) , 7 . 5 5 (d , 1 H) , 7 . 1 2 (d , 1 H) , 6 . 4 2 (d , 1 H) , 5 . 7 8 (s , 2 H) , 3 . 0 5 (s , 3 H) , 3 . 1 5 (s , 3 H) .

【 0 2 4 6 】

以下の一般的な手順を、適切なビルディングブロック (式 (I I) 及び (I I I) の化合物) を使用する組み合わせ様式で行って式 (I) の化合物を提供した。以下の組み合わせプロトコルによって調製された化合物は、LC / MS 方法 B を用いて分析した。

40

【 化 4 2 】



【 0 2 4 7 】

50

例示の目的で、アセトニトリル（1.0 mL）中の式（II）の[[5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ヘテロアリアル]メチルプロミド誘導体（0.03 mmol）を、式（III）のアミン誘導体（0.03 mmol）、炭酸カリウム（0.06 mmol）を含有するマイクロ波バイアルに移し、パラレルマイクロ波装置において120 で20分間マイクロ波照射下に攪拌した。溶媒を窒素の流れ下に除去した。得られた粗残渣を、MeOH（250 μL）とDMA（500 μL）との混合物に可溶化し、分取LC/MS精製に直接供し、この精製は式（I）の化合物を提供した。異性体の構造は、NMR技術によって帰属させた。

【0248】

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

【0249】

【表 9 - 1】

表T1:式(I)に係る化合物についての融点(mp)データ及び/又は保持時間(R_t)

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 1	エチル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキシレート		1.08	373.2	B	115.7- 116.5
1. 2	3-[5-(1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		0.89	302.3	A	
1. 3	5,5-ジメチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イソオキサゾリジン-3-オン		1.04	348.2	A	
1. 4	N,N-ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-アミン					113-116
1. 5	3-[5-[(4-メチルピラゾール-1-イル)メチル]-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1.63	315	B	

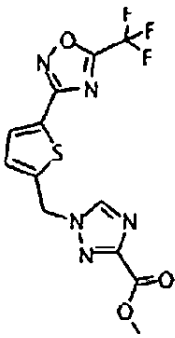
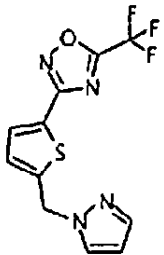
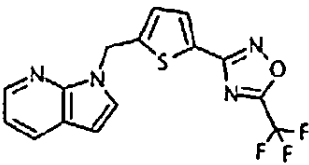
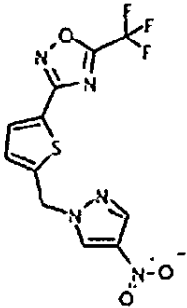
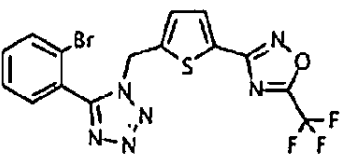
10

20

30

40

【表 9 - 2】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 6	メチル 1-[[5-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-チエニル] メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート		1. 34	360	B	
1. 7	3-[5-(ピラゾール-1-イルメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1. 52	301	B	
1. 8	3-[5-(ピロロ[2,3-b]ピリジン-1-イルメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		0. 95	351	B	
1. 9	3-[5-[(4-ニトロピラゾール-1-イル)メチル]-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1. 63	346. 4	B	
1. 10	3-[5-[[5-(2-ブロモフェニル)テトラゾール-1-イル]メチル]-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1. 74	457	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 11	1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボニトリル		1.54	326	B	
1. 12	3-[5-[(4-フルオロピラゾール-1-イル)メチル]-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1.63	319	B	
1. 13	N,N-ジメチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-アミン		1.44	345.1	B	
1. 14	5-(ジフルオロメチル)-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-アミン		1.36	367	B	
1. 15	3-[5-(ピロリジン-1-イルメチル)-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		0.84	304	B	

10

20

30

40

【表 9 - 4】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 16	5-メチル-2- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾ ール-3-アミン		1.14	330	B	
1. 17	3-[5-(イミダゾ ール-1-イルメ チル)-2-チエニ ル]-5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール		0.83	301	B	
1. 18	4-[[5-[5-(トリ フルオロメチル)-1,2,4-オキサ ジアゾール-3- イル]-2-チエニ ル]メチル]モル ホリン		0.89	320	B	
1. 19	メチル 3-(メト キシメチル)-1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾ ール-4-カルボ キシレート		1.58	403.1	B	
1. 20	3-[5-(アゼチジ ン-1-イルメチ ル)-2-チエニル]-5-(トリフル オロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール		0.82	290	B	
1. 21	3-[5-[(3,5-ジ メチルピラゾ ール-1-イル)メチ ル]-2-チエニル]-5-(トリフル オロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール		1.68	329	B	

10

20

30

40

【表 9 - 5】

項目	名称	構造	R ₁ (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 22	1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルバルデヒド		1.41	3.29	B	
1. 23	3-[5-[[6-メトキシベンズイミダゾール-1-イル]メチル]-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1.25	381.1	B	
1. 24	3-[5-[[5-メトキシベンズイミダゾール-1-イル]メチル]-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1.28	381.1	B	
1. 25	3-[5-(ベンズイミダゾール-1-イル)メチル]-2-チエニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1.28	351	B	
1. 26	エチル 1-[[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキシレート					119-123
1. 27	6-メチル-1-[[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]		0.97	342	A	

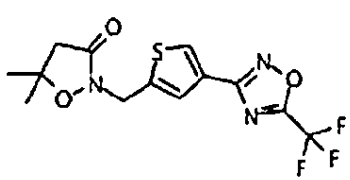
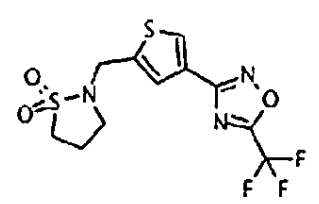
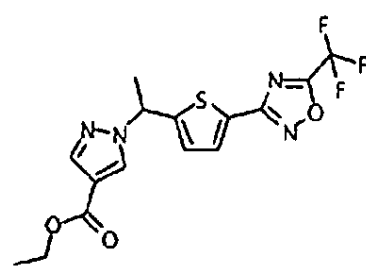
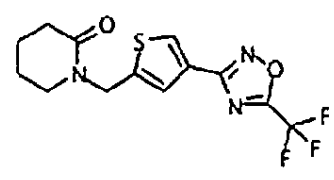
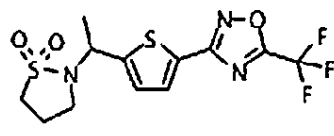
10

20

30

40

【表 9 - 6】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
	ル]-2-チエニル]メチル]ピリジ ン-2-オン					
1. 28	5,5-ジメチル- 2-[[4-[5-(トリ フルオロメチル)-1,2,4-オキサ ジアゾール-3- イル]-2-チエニ ル]メチル]イソ オキサゾリジン -3-オン		1.03	348	A	
1. 29	2-[[4-[5-(トリ フルオロメチル)-1,2,4-オキサ ジアゾール-3- イル]-2-チエニ ル]メチル]- 1,2-チアゾリジ ン 1,1-ジオキシ シド		0.96	質量は 検出せ ず	A	
1. 30	エチル 1-[1- [5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3- イル]-2-チエニ ル]エチル]ピラゾ ール-4-カルボ キシレート		1.12	387	A	
1. 31	1-[[4-[5-(トリ フルオロメチル)-1,2,4-オキサ ジアゾール-3- イル]-2-チエニ ル]メチル]ピペ リジン-2-オン		0.98	332	A	
1. 32	2-[1-[5-[5-(トリ フルオロメチル)-1,2,4-オキサ ジアゾール- 3-イル]-2-チエ ニル]エチル]- 1,2-チアゾリジ ン 1,1-ジオキシ シド		1.01	384	A	

10

20

30

40

【表 9 - 7】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 33	6-メチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピリジン-2-オン		1. 02	356	A	
1. 34	1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピペリジン-2-オン		1. 04	346	A	
1. 35	アゼチジン-1-イル-[1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-イル]メタノン					76-78
1. 36	1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボン酸					182-185
1. 37	1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボン酸					133-143
1. 38	N-メチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾ					150.8- 155.7

10

20

30

40

【表 9 - 8】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
	ール-4-カルボキサミド					
1. 39	N-(2-メトキシエチル)-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド					135.3- 137.9
1. 40	エチル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート					136-140
1. 41	エチル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート		1.05	374	A	
1. 42	エチル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート					120-124
1. 43	プロピル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾ					140-160

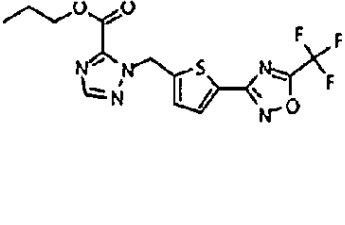
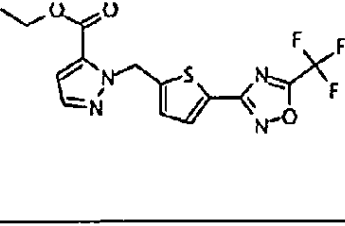
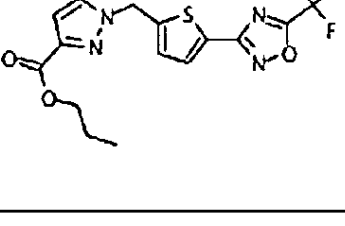
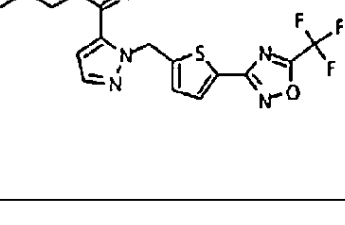
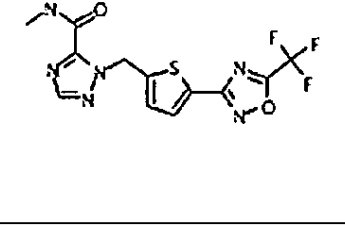
10

20

30

40

【表 9 - 9】

項目	名称	構造	R ₁ (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
	ール-3-カルボキシレート					
1. 44	プロピル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート		1. 09	388	A	
1. 45	エチル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート		1. 16	373	A	
1. 46	プロピル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート					88-94
1. 47	プロピル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート		1. 22	387	A	
1. 48	N-メチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド					132-140

10

20

30

40

【表 9 - 10】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 49	N-メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド					198-218
1. 50	N,N-ジメチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		0.96	373	A	
1. 51	N-メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド					124-126
1. 52	N-メチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド					148-151
1. 53	メチル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート		1.00	359	A	

10

20

30

40

【表 9 - 1 1】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	MP (°C)
1. 54	メチル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート		1.10	359	A	
1. 55	メチル 2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキシレート		0.98	360	A	
1. 56	<i>N</i> -メトキシ-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド					134-141
1. 57	<i>N,N</i> -ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド					90-96
1. 58	<i>N,N</i> -ジメチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		0.96	388	A	

10

20

30

40

【表 9 - 1 2】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 59	N-メトキシ-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド					168-178
1. 60	N-メトキシ-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド					105-115
1. 61	N-メトキシ-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド					135-140
1. 62	1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボン酸					140-150
1. 63	1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボン酸					210-220

10

20

30

40

【表 9 - 1 3】

項目	名称	構造	R ₁ (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 64	2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボン酸					145-165
1. 65	<i>N</i> - <i>sec</i> -ブチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 60	414. 08	B	
1. 66	<i>N</i> -(2,2-ジメチルプロピル)-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 70	428. 09	B	
1. 67	<i>N</i> -イソプロピル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 52	400. 06	B	
1. 68	<i>N</i> -メトキシ- <i>N</i> -メチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 52	402. 03	B	

10

20

30

40

【表 9 - 1 4】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 69	N,N-ジメチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.43	386.05	B	
1. 70	N-メチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.33	372.02	B	
1. 71	N-シクロヘキシル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.71	440.09	B	
1. 72	N-エチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.43	386.05	B	
1. 73	N-アリル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.48	398.05	B	

10

20

30

40

【表 9 - 15】

項目	名称	構造	R _f (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 74	<i>N</i> -イソブチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 61	414. 08	B	
1. 75	<i>N</i> -シクロプロピル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 44	398. 05	B	
1. 76	<i>N,N</i> -ジエチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 61	414. 09	B	
1. 77	<i>N</i> -フェニル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 69	434. 05	B	
1. 78	<i>N</i> -ベンジル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 65	448. 07	B	

10

20

30

40

【表 9 - 16】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1.79	N-シクロブチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.57	412.07	B	
1.80	N-エトキシ-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.42	402.05	B	
1.81	N-プロピル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.52	400.07	B	
1.82	N-メトキシ-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.35	388.04	B	
1.83	N-シクロペンチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.64	426.08	B	

10

20

30

40

【表 9 - 17】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 84	モルホリノ-[1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-イル]メタノン		1.42	428.06	B	
1. 85	N-(2-フリルメチル)-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.55	438.04	B	
1. 86	N-tert-ブチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.66	414.07	B	
1. 87	N-プロパ-2-イルニル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.43	396.01	B	
1. 88	N-エチル-N-メチル-1-[1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.52	400.05	B	

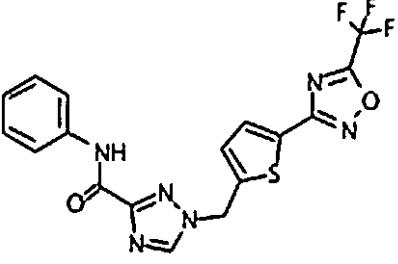
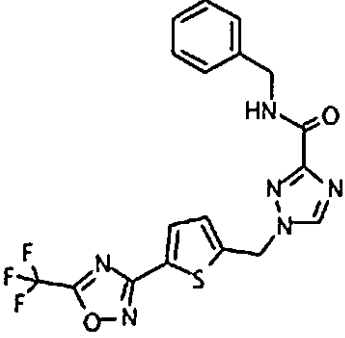
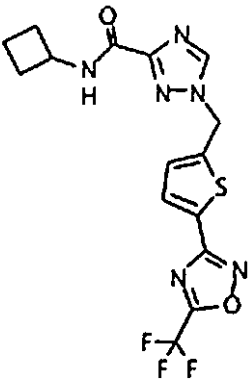
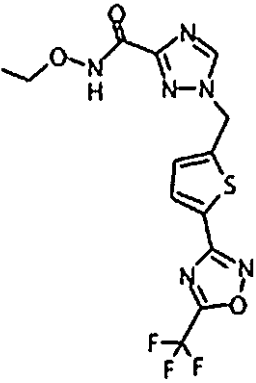
10

20

30

40

【表 9 - 18】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 89	N-フェニル-1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]-2-チエニル] メチル]- 1,2,4-トリアゾ ール-3-カルボ キサミド		1. 56	421. 00	B	
1. 90	N-ベンジル-1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]-2-チエニル] メチル]- 1,2,4-トリアゾ ール-3-カルボ キサミド		1. 55	435. 01	B	
1. 91	N-シクロブチル -1-[[5-[5-(ト リフルオロメチ ル)-1,2,4-オキ サジアゾール- 3-イル]-2-チエ ニル]メチル]- 1,2,4-トリアゾ ール-3-カルボ キサミド		1. 46	398. 99	B	
1. 92	N-エトキシ-1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]-2-チエニル] メチル]- 1,2,4-トリアゾ ール-3-カルボ キサミド		1. 24	388. 96	B	

10

20

30

40

【表 9 - 19】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 93	N-プロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1. 41	386. 99	B	
1. 94	N-シクロペンチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1. 54	413. 02	B	
1. 95	モルホリノ-[1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]メタノン		1. 27	414. 99	B	
1. 96	N-(2-フリルメチル)-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1. 42	424. 99	B	

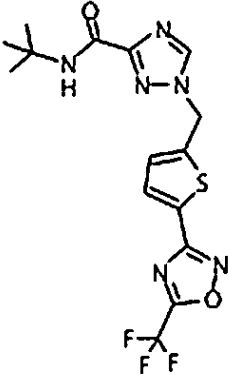
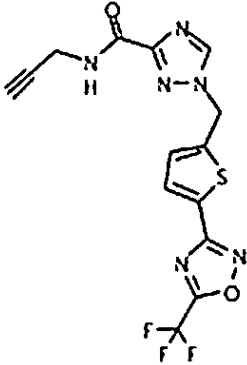
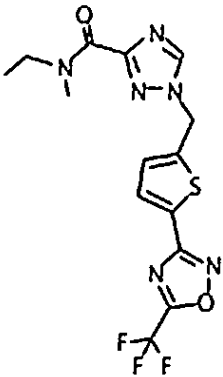
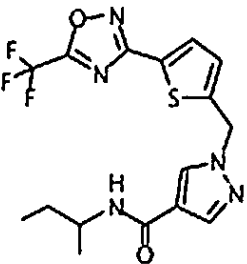
10

20

30

40

【表 9 - 20】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 97	<i>N</i> - <i>tert</i> -ブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.54	401.01	B	
1. 98	<i>N</i> -プロパ-2-イニル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.28	382.96	B	
1. 99	<i>N</i> -エチル- <i>N</i> -メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.38	386.99	B	
1. 100	<i>N</i> - <i>sec</i> -ブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.52	400.02	B	

10

20

30

40

【表 9 - 2 1】

項目	名称	構造	R _f (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 101	<i>N</i> -(2,2-ジメチルプロピル)-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.63	414.03	B	
1. 102	<i>N</i> -イソプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.44	385.99	B	
1. 103	<i>N</i> -メトキシ- <i>N</i> -メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.43	387.97	B	
1. 104	<i>N,N</i> -ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.34	371.97	B	
1. 105	<i>N</i> -シクロヘキシル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.65	426.04	B	

10

20

30

40

【表 9 - 2 2】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 106	<i>N</i> -エチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.34	371.97	B	
1. 107	<i>N</i> -アリル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.39	383.97	B	
1. 108	<i>N</i> - <i>sec</i> -ブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.66	400.02	B	
1. 109	<i>N</i> -イソブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.52	400.01	B	

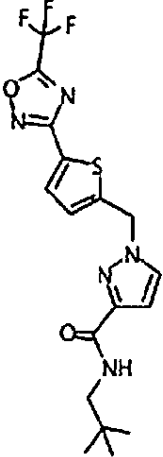
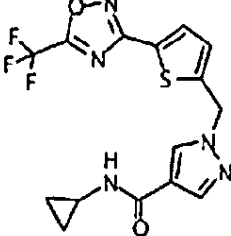
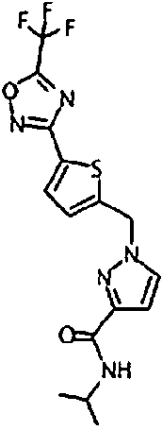
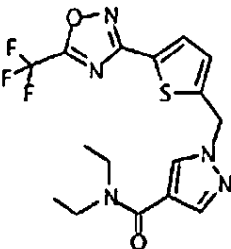
10

20

30

40

【表 9 - 2 3】

項目	名称	構造	R ₁ (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 110	<i>N</i> -(2,2-ジメチルプロピル)-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.76	414.04	B	
1. 111	<i>N</i> -シクロプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.36	383.97	B	
1. 112	<i>N</i> -イソプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.57	386.00	B	
1. 113	<i>N,N</i> -ジエチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.58	400.01	B	

10

20

30

40

【表 9 - 2 4】

項目	名称	構造	R _f (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 114	<i>N</i> -メトキシ- <i>N</i> -メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1. 45	387. 97	B	
1. 115	<i>N</i> -フェニル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 61	420. 00	B	
1. 116	<i>N</i> -ベンジル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 55	434. 01	B	
1. 117	<i>N</i> -シクロブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 49	398. 00	B	

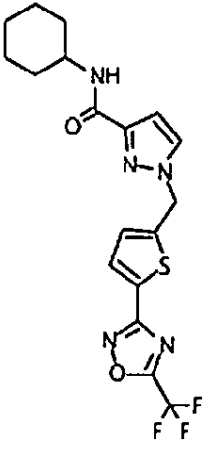
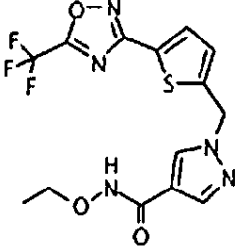
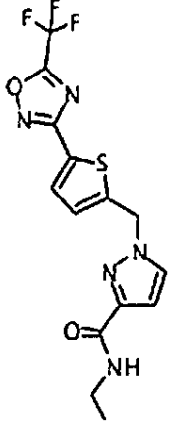
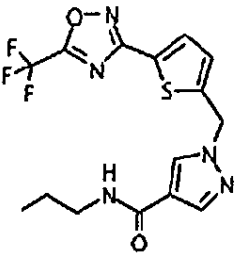
10

20

30

40

【表 9 - 2 5】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 118	N-シクロヘキシル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1. 80	426. 05	B	
1. 119	N-エトキシ-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 33	387. 97	B	
1. 120	N-エチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1. 46	371. 97	B	
1. 121	N-プロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1. 44	385. 99	B	

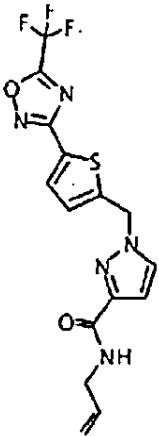
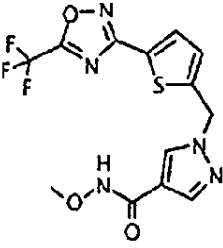
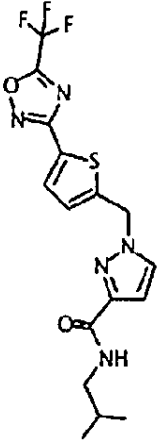
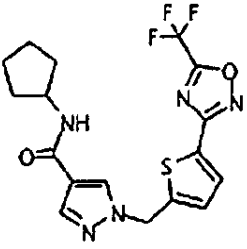
10

20

30

40

【表 9 - 2 6】

項目	名称	構造	R ₁ (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 122	N-アリル-1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]-2-チエニル] メチル]ピラゾ ール-3-カルボ キサミド		1. 52	383. 97	B	
1. 123	N-メトキシ-1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]-2-チエニル] メチル]ピラゾ ール-4-カルボ キサミド		1. 25	373. 94	B	
1. 124	N-イソブチル- 1-[[5-[5-(トリ フルオロメチル)-1,2,4-オキサ ジアゾール-3- イル]-2-チエニ ル]メチル]ピラ ゾール-3-カル ボキサミド		1. 67	400. 01	B	
1. 125	N-シクロペンチ ル-1-[[5-[5-(トリフルオロメ チル)-1,2,4-オ キサジアゾール -3-イル]-2-チ エニル]メチル] ピラゾール-4- カルボキサミド		1. 54	412. 02	B	

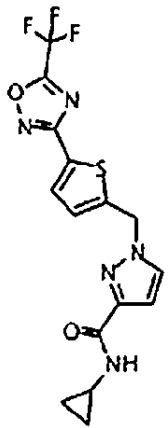
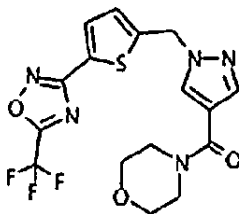
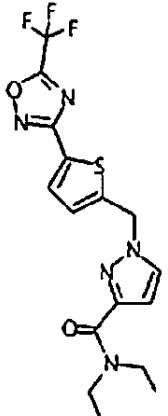
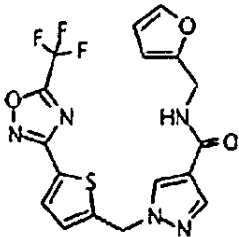
10

20

30

40

【表 9 - 27】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 126	<i>N</i> -シクロプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.47	383.97	B	
1. 127	モルホリノ-[1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-イル]メタノン		1.33	414.00	B	
1. 128	<i>N,N</i> -ジエチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.66	400.02	B	
1. 129	<i>N</i> -(2-フリルメチル)-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.47	423.98	B	

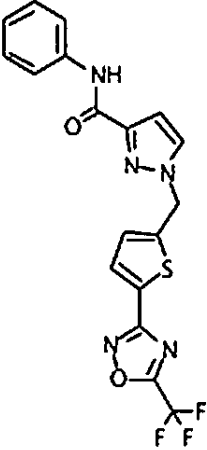
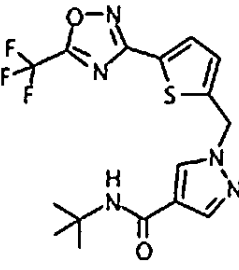
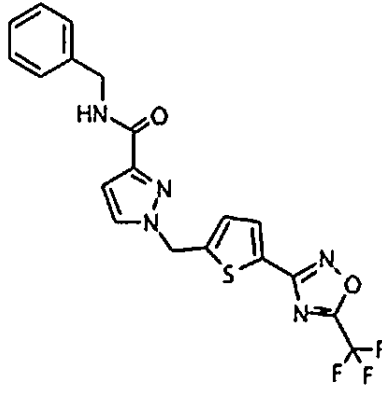
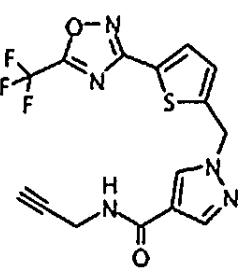
10

20

30

40

【表 9 - 2 8】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 130	<i>N</i> -フェニル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.75	420.00	B	
1. 131	<i>N</i> -tert-ブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.58	400.01	B	
1. 132	<i>N</i> -ベンジル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.69	434.02	B	
1. 133	<i>N</i> -プロパ-2-エニル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.34	381.96	B	

10

20

30

40

【表 9 - 2 9】

項目	名称	構造	R ₁ (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 134	N-シクロブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.62	397.99	B	
1. 135	N-エチル-N-メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキサミド		1.43	385.99	B	
1. 136	N-エトキシ-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.40	387.98	B	

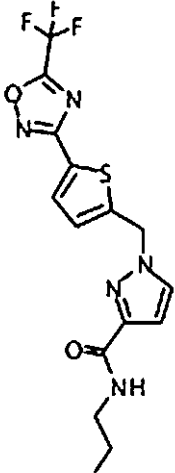
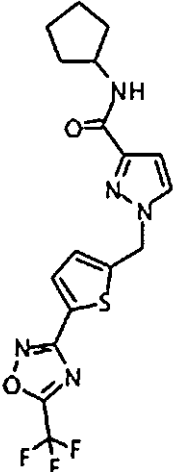
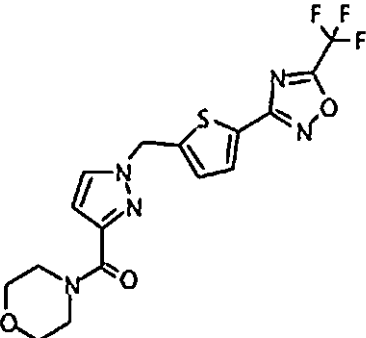
10

20

30

40

【表 9 - 30】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 137	N-プロピル-1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イ ル]-2-チエニル]メチル]ピラゾ ール-3-カルボ キサミド		1.57	386.00	B	
1. 138	N-シクロペンチ ル-1-[[5-[5-(トリフルオロメ チル)-1,2,4-オ キサジアゾール -3-イル]-2-チ エニル]メチル] ピラゾール-3- カルボキサミド		1.59	424.00	B	
1. 139	モルホリノ-[1- [[5-[5-(トリフ ルオロメチル)- 1,2,4-オキサジ アゾール-3-イ ル]-2-チエニル]メチル]ピラゾ ール-3-イル]メ タノン		1.73	400.01	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3 1】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 140	<i>N</i> -(2-フリルメチル)-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.45	381.96	B	
1. 141	<i>N-tert</i> -ブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.59	424.00	B	
1. 142	<i>N</i> -プロパ-2-イニル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.73	400.01	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3 2】

項目	名称	構造	R ₁ (分)	質量 電荷	方法	MP (°C)
1. 143	<i>N</i> -エチル- <i>N</i> -メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.53	386.00	B	
1. 144	<i>N</i> - <i>sec</i> -ブチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.51	401.01	B	
1. 145	<i>N</i> -(2,2-ジメチルプロピル)-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.62	415.03	B	
1. 146	<i>N</i> -イソプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.41	386.99	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3 3】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 147	<i>N</i> -メトキシ- <i>N</i> -メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1. 32	388. 97	B	
1. 148	<i>N,N</i> -ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1. 28	372. 97	B	
1. 149	<i>N</i> -シクロヘキシル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1. 64	427. 04	B	
1. 150	<i>N</i> -エチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1. 30	372. 97	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3 4】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 151	<i>N</i> -アリル-1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.36	384.97	B	
1. 152	<i>N</i> -イソブチル-1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.50	401.01	B	
1. 153	<i>N</i> -シクロプロピル-1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.32	384.97	B	
1. 154	<i>N,N</i> -ジエチル-1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド		1.49	401.01	B	

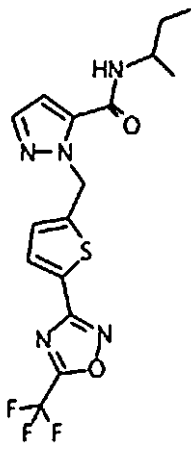
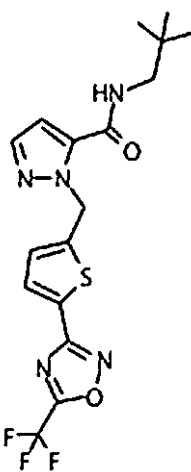
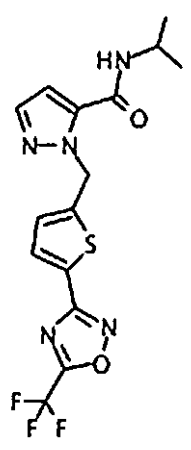
10

20

30

40

【表 9 - 3 5】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 155	<i>N</i> -sec-ブチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.72	400.07	B	
1. 156	<i>N</i> -(2,2-ジメチルプロピル)-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.83	414.09	B	
1. 157	<i>N</i> -イソプロピル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.62	386.04	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3 6】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 158	N-メトキシ-N-メチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.58	388.02	B	
1. 159	N-シクロヘキシル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.86	426.09	B	
1. 160	N-イソブチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.73	400.07	B	

10

20

30

40

【表 9 - 37】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	MP (°C)
1. 161	N,N-ジエチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.65	400.07	B	
1. 162	N-フェニル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.79	420.03	B	
1. 163	N-ベンジル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.75	434.05	B	
1. 164	N-エトキシ-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.46	388.02	B	

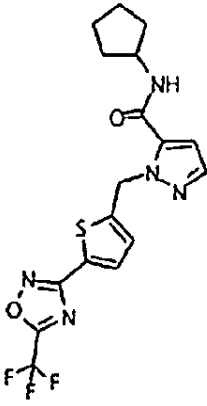
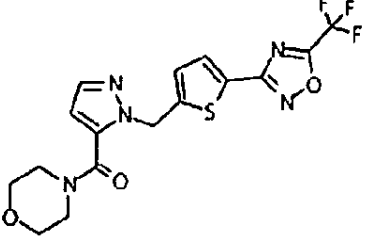
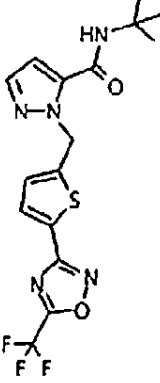
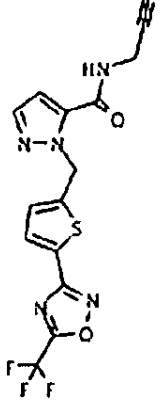
10

20

30

40

【表 9 - 3 8】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	MP (°C)
1. 165	N-シクロペンチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.76	412.08	B	
1. 166	モルホリノ-[2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-イル]メタノン		1.43	414.05	B	
1. 167	N-tert-ブチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.79	400.07	B	
1. 168	N-プロパ-2-イニル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.50	382.02	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3 9】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 169	<i>N</i> -エチル- <i>N</i> -メチル-2-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.54	386.08	B	
1. 170	<i>N</i> -メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド		1.20	358	C	
1. 171	<i>N</i> -シクロプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					
1. 172	<i>N,N</i> -ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					
1. 173	<i>N</i> -プロパ-2-エニル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキ					

10

20

30

40

【表 9 - 40】

項目	名称	構造	R _i (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
	サミド					
1. 174	N-メトキシ-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド		1.37	374	C	10
1. 175	N-イソプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					20
1. 176	N-メチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-2-カルボキサミド		1.39	358	C	30
1. 177	N-シクロプロピル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-2-カルボキサミド		1.46	384	C	40
1. 178	N,N-ジメチル-1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-2-カルボキサミド		1.31	372	C	

【表 9 - 4 1】

項目	名称	構造	R _f (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 179	N-プロパ-2-イニル-1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-2-カルボキサミド		1.45	検出せず	C	
1. 180	N-メトキシ-1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-2-カルボキサミド		1.37	374	C	
1. 181	N-イソプロピル-1-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-2-カルボキサミド					
1. 182	N-メチル-3-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド		0.90	358	C	
1. 183	N-シクロプロピル-3-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					

10

20

30

40

【表 9 - 4 2】

項目	名称	構造	R _t (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1.184	N,N-ジメチル-3-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					
1.185	N-プロパ-2-イニル-3-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					
1.186	N-メトキシ-3-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					
1.187	N-イソプロピル-3-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキサミド					
1.188	メチル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-2-カルボキシレート		1.39	359	C	

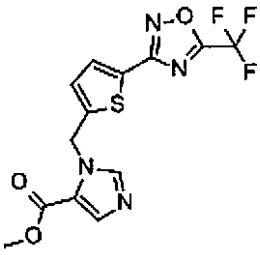
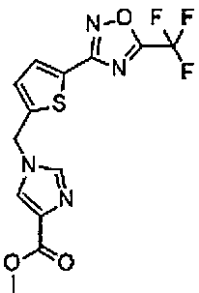
10

20

30

40

【表 9 - 4 3】

項目	名称	構造	R _f (分)	質量 電荷	方法	mp (°C)
1. 189	メチル 3-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキシレート		1. 39	359	C	
1. 190	メチル 1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]イミダゾール-4-カルボキシレート		1. 33	359	C	

10

20

【0250】

生物学的実施例

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

30

【0251】

ウェルプレートにおける液体培養テストの一般的実施例：

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

40

【0252】

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

コムギ葉切片（cv. Kanzler）を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天上に載せ、水で希釈された配合されたテスト化合物を噴霧した。葉片に、適用から

50

1日後に真菌の孢子懸濁液を播種した。播種された葉切片を、気候キャビネット中において、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下で、19及び75%の相対湿度(rh)でインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉切片に現われた時点で(適用から7~9日後)、未処理のものとはした病害防除割合として評価した。

【0253】

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

【0254】

化合物(表T1より)1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.12、1.13、1.14、1.16、1.17、1.18、1.19、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.30、1.32、1.33、1.34、1.35、1.36、1.37、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42、1.43、1.44、1.45、1.46、1.47、1.48、1.49、1.50、1.51、1.52、1.53、1.54、1.55、1.56、1.57、1.58、1.59、1.60、1.61、1.62、1.63、1.64、1.66、1.68、1.70、1.71、1.73、1.79、1.82、1.83、1.84、1.85、1.88、1.91、1.94、1.95、1.96、1.98、1.100、1.101、1.102、1.103、1.105、1.106、1.109、1.113、1.115、1.120、1.122、1.126、1.128、1.129、1.130、1.137、1.140、1.144、1.145、1.149、1.151、1.153、1.155、1.156、1.157、1.158、1.159、1.160、1.161、1.162、1.163、1.164、1.165、1.166、1.167、1.168、1.169、1.176及び1.177。

10

20

【0255】

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

30

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

【0256】

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

40

【0257】

化合物(表T1より)1.1、1.2、1.4、1.6、1.8、1.9、1.11、1.13、1.14、1.16、1.17、1.19、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.30、1.32、1.33、1.34、1.35、1.36、1.37、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42、1.43、1.44、1.45、1.46、1.47、1.48、1.49、1.50、1.51、1.52、1.53、1.54、1.55、1.56、1.57、1.58、1.59、1.60、1.61、1.63、1.64、1.66、1.68、1.70、1.73、1.79、1.82、1.83、1.84、1.85、1.88、1.91、1.94、1.95、

50

1.96、1.98、1.100、1.101、1.102、1.103、1.105、
1.106、1.109、1.113、1.120、1.122、1.126、1.128、
1.129、1.130、1.137、1.140、1.144、1.145、1.
151、1.153、1.158、1.160、1.161、1.164、1.166、
1.168、1.169、1.176及び1.177。

【0258】

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

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

【0259】

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

【0260】

化合物(表T1より)1.1、1.4、1.6、1.13、1.14、1.17、1.19、1.21、1.23、1.24、1.25、1.30、1.32、1.33、1.34、1.35、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42、1.43、1.44、1.45、1.46、1.47、1.48、1.49、1.50、1.51、1.52、1.53、1.54、1.55、1.56、1.57、1.58、1.59、1.60及び1.61。

【0261】

実施例4：グロメララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレトトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)) に対する殺菌・殺カビ活性、液体培養/キュウリ/予防(炭疽病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地(PDB-ジャガイモブドウ糖液体培地)に直接混合する。テスト化合物の(DMSO)溶液をマイクロタイタープレート(96ウェル型)に入れた後、真菌孢子を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを24でインキュベートし、適用から3~4日後に、成長の阻害を測光法により計測する。

【0262】

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

【0263】

化合物(表T1より)1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.12、1.13、1.14、1.15、1.16、1.17、1.18、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.27、1.28、1.29、1.30、1.31、1.32、1.33、1.34、1.35、1.36、1.37、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42、1.43、1.44、1.45、1.46、1.47、1.48、1.49、1.50、1.51、1.52、1.53、1.54、1.55、1.56、1.57、1.59、1.60、1.61、1.62、1.64、1.66、1.68、1.70、1.71、1.73、1.79、1.82、1.84、1.85、1.88、1.91、1.94、1.95、1.96、1.98、1.100、1.101、1

10

20

30

40

50

. 1 0 2、1 . 1 0 3、1 . 1 0 5、1 . 1 0 6、1 . 1 0 9、1 . 1 1 5、1 . 1 2 0
、1 . 1 2 2、1 . 1 2 6、1 . 1 2 8、1 . 1 2 9、1 . 1 3 0、1 . 1 3 7、1 . 1
4 0、1 . 1 4 4、1 . 1 4 5、1 . 1 4 9、1 . 1 5 1、1 . 1 5 3、1 . 1 5 5、1
. 1 5 6、1 . 1 5 7、1 . 1 5 8、1 . 1 5 9、1 . 1 6 0、1 . 1 6 1、1 . 1 6 2
、1 . 1 6 3、1 . 1 6 4、1 . 1 6 5、1 . 1 6 6、1 . 1 6 7、1 . 1 6 8 及び 1 .
1 6 9。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2018/055042

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D413/14 A01N43/72 C07D413/04 C07D417/14 C07D471/04 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, BIOSIS, CHEM ABS Data, EMBASE, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2015/185485 A1 (BASF SE [DE]) 10 December 2015 (2015-12-10) cited in the application Formula (I); Table A, groupe A-3; claims; examples -----	1-15
A	EP 0 276 432 A2 (CIBA GEIGY AG [CH]) 3 August 1988 (1988-08-03) Formula (I); claims; examples -----	1-15
A	WO 2009/029632 A1 (HELICON THERAPEUTICS INC [US]; KAPLAN ALAN P [US]; KEENAN TERENCE P [U] 5 March 2009 (2009-03-05) Formula (I); claims; example 10 -----	1-15
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
6 April 2018		02/05/2018
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 Kirsch, Cécile

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2018/055042

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2015185485 A1	10-12-2015	AR 100770 A1	02-11-2016
		AU 2015270651 A1	22-12-2016
		CA 2950084 A1	10-12-2015
		CN 106455572 A	22-02-2017
		EP 3151669 A1	12-04-2017
		US 2017144980 A1	25-05-2017
		WO 2015185485 A1	10-12-2015
EP 0276432 A2	03-08-1988	AU 8246587 A	16-06-1988
		BR 8706756 A	19-07-1988
		DK 650787 A	13-06-1988
		EP 0276432 A2	03-08-1988
		NZ 222868 A	26-09-1990
		PT 86329 A	01-01-1988
		US 4871753 A	03-10-1989
WO 2009029632 A1	05-03-2009	AU 2008293542 A1	05-03-2009
		AU 2014202864 A1	19-06-2014
		CA 2696609 A1	05-03-2009
		CA 2974477 A1	05-03-2009
		CN 101820764 A	01-09-2010
		CN 104072489 A	01-10-2014
		EP 2182809 A1	12-05-2010
		EP 3311813 A1	25-04-2018
		HK 1147938 A1	19-06-2015
		IL 203910 A	30-06-2014
		IL 226702 A	24-09-2015
		JP 5718053 B2	13-05-2015
		JP 6250746 B2	20-12-2017
		JP 2010538001 A	09-12-2010
		JP 2015110666 A	18-06-2015
		JP 2017002062 A	05-01-2017
		KR 20100046060 A	04-05-2010
		KR 20150059810 A	02-06-2015
		US 2009062252 A1	05-03-2009
		US 2012202786 A1	09-08-2012
		US 2013053361 A1	28-02-2013
US 2015336941 A1	26-11-2015		
US 2017204111 A1	20-07-2017		
WO 2009029632 A1	05-03-2009		

フロントページの続き

(51) Int. Cl. F I テーマコード (参考)
A 0 1 N 43/836 (2006.01) A 0 1 N 43/836

(31) 優先権主張番号 17160411.9

(32) 優先日 平成29年3月10日(2017.3.10)

(33) 優先権主張国・地域又は機関
 欧州特許庁(EP)

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

(特許庁注：以下のものは登録商標)

1 . T W E E N

(74) 代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74) 代理人 100136249

弁理士 星野 貴光

(72) 発明者 ホフマン トマス ジェイムズ

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

(72) 発明者 スティエルリ ダニエル

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

(72) 発明者 ピッテルナ トマス

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

(72) 発明者 ラジャン ラムヤ

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム シンジェンタ バイオサイエンスーズ プラ
 イベート リミテッド サンタ モニカ ワークス内

Fターム(参考) 4C063 AA01 AA03 AA05 BB01 BB03 CC94 DD02 DD12 DD22 DD25

DD26 DD41 DD47 DD51 DD58 EE03

4C065 AA04 BB04 CC01 DD02 EE02 HH01 JJ01 KK09 LL01 PP06

PP16

4H011 AA01 BA01 BB10 BC06 DA16 DD03