(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2015 年 4 月 30 日(30.04.2015)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2015/060378 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 213/80 (2006.01) *A01P 3/00* (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2014/078204

(22) 国際出願日: 2014 年 10 月 23 日(23.10.2014)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2013-222613 2013 年 10 月 25 日(25.10.2013) JP

(71) 出願人: 日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1008165 東京都千代田区大手町二丁目２番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 稲垣　準(INAGAKI Jun); 〒2500280 神奈川県小田原市高田３４５　日本曹達株式会社小田原研究所内 Kanagawa (JP). 藤井　孝行(FUJII Takayuki); 〒2500280 神奈川県小田原市高田３４５　日本曹達株式会社　小田原研究所内 Kanagawa (JP). 池田　庸二(IKEDA Yoji); 〒2500280 神奈川県小田原市高田３４５　日本曹達株式会社　小田原研究所内 Kanagawa (JP).

(74) 代理人: 志賀　正武, 外(SHIGA Masatake et al.); 〒1006620 東京都千代田区丸の内一丁目９番２号 Tokyo (JP).

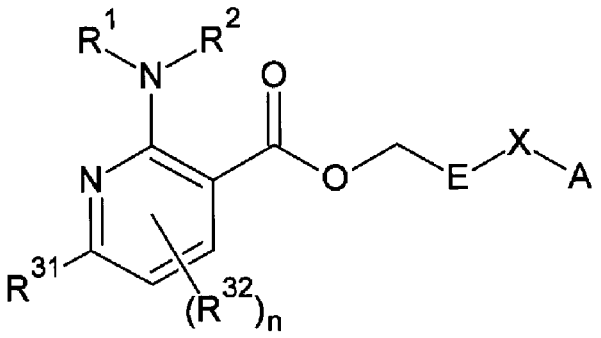
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (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), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

(54) **Title**: AMINOPYRIDINE DERIVATIVE AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL FUNGICIDE

(54) 発明の名称 : アミノピリジン誘導体および農園芸用殺菌剤



（１）

(57) **Abstract**: Provided is an aminopyridine compound represented by formula (1), or a salt of said compound. [In formula (1), R^1 represents a hydrogen atom, a formyl group, a C1-8 alkylcarbonyl group or the like. R^2 represents a hydrogen atom, a C1-8 alkyl group or the like. R^{31} represents a hydrogen atom, a halogen group, a cyano group, a C1-8 alkyl group or the like. R^{32} represents a halogen group, a cyano group, a C1-8 alkyl group or the like. n represents the number of R^{32} groups, and is an integer between 0 and 2, inclusive. E represents a divalent group comprising a ring selected from the group consisting of a benzene ring, a pyridine ring, a furan ring, a pyrroline ring, a tetrazoline ring, a thiazoline ring, and a pyrazoline ring. X represents -CH_2-, -O-, -S-, -NH- or the like. A represents an optionally substituted C6-10 aryl group, or an optionally substituted 5- to 10-membered heterocyclyl group.]

(57) 要約: 式（１）で表されるアミノピリジン化合物またはその塩。［式（１）中、R^1は、水素原子、ホルミル基、Ｃ１～８アルキルカルボニル基などを示す。R^2は、水素原子、Ｃ１～８アルキル基などを示す。R^{31}は、水素原子、ハロゲノ基、シアノ基、Ｃ１～８アルキル基などを示す。R^{32}は、ハロゲノ基、シアノ基、Ｃ１～８アルキル基などを示す。ｎはR^{32}の個数を示し、０～２のいずれかの整数である。Ｅは、ベンゼン環、ピリジン環、フラン環、ピロリン環、テトラゾリン環、チアゾリン環、およびピラゾリン環からなる群より選ばれる環からなる２価の基などを示す。Ｘは、－CH_2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＨ－などを示す。Ａは、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基を示す。］

WO 2015/060378 A1

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

明　細　書

発明の名称 ： アミノピリジン誘導体および農園芸用殺菌剤

技術分野

[0001] 本発明は、効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺菌剤および農園芸用殺菌剤の有効成分として有用なアミノピリジン誘導体に関する。

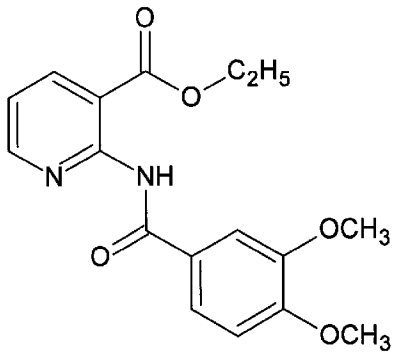
本願は、２０１３年１０月２５日に、日本に出願された特願２０１３－２２２６１３号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

背景技術

[0002] 農園芸作物の病害に対して多数の防除薬剤が使用されている。しかし、従来の防除薬剤の多くは、その防除効力が不十分であったり、薬剤耐性の病原菌の出現によりその使用が制限されたり、植物体に薬害や汚染を生じさせたり、若しくは人畜魚類に対する毒性や環境への影響が大きかったりなどで、十分に満足できるものではなかった。そのため、かかる欠点の少ない薬剤の出現が強く要望されている。

[0003] 本発明に関連して、特許文献１には、式（I）で表される化合物などが開示され、抗アレルギー作用を有することが記載されている。

[0004] [化1]

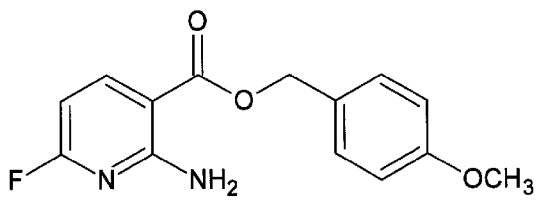


(I)

[0005] 特許文献２および３には、各々式（II）、式（III）で表される化合物などが開示され、いずれも除草効果を有することが記載されている。

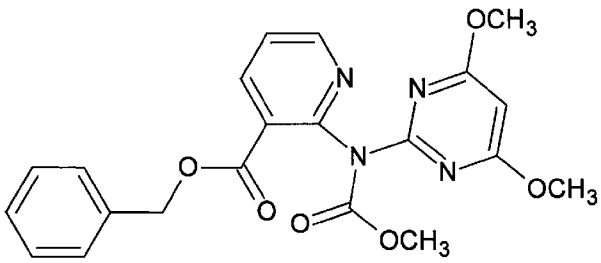
[0006]

[化2]



(II)

[0007] [化3]



(III)

先行技術文献

特許文献

[0008] 特許文献1：特開昭５５－２２６３４号公報

特許文献2：米国特許　４３８３８５１

特許文献3：特開平６－４１１１６号公報

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0009] 本発明は、効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺菌剤、並びに農園芸用殺菌剤の有効成分として有用なアミノピリジン誘導体を提供することを課題とする。

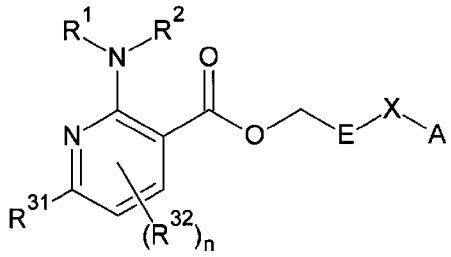
課題を解決するための手段

[0010] 本発明者らは、前記課題を解決すべく鋭意検討した結果、以下の形態を包含する本発明を完成するに至った。

[0011] 〔１〕　式（１）で表されるアミノピリジン化合物またはその塩。

[0012]

[化4]



（１）

［式（１）中、

Ｒ[1]は、水素原子、ホルミル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルキニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルチオカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するジＣ１～８アルキルスルファモイル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールスルホニル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルス

ルホニル基を示す。

R^2は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、または無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニル基を示す。

R^{31}は、水素原子、ハロゲノ基、シアノ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

R^{32}は、ハロゲノ基、シアノ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基を示す。ｎはR^{32}の個数を示し、０～２のいずれかの整数である。ｎが２のとき、R^{32}は互いに同じでも異なってもよい。

Ｅは、無置換の若しくは置換基を有するベンゼン環からなる２価の基、または無置換の若しくは置換基を有する５～６員のヘテロ環からなる２価の基を示す。

Ｘは、－CH_2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＨ－、－CH_2CH_2－、－CH_2O－、－OCH_2－、－CH_2S－、－SCH_2－、－CH_2NH－、または－ＮＨCH_2－を示す。

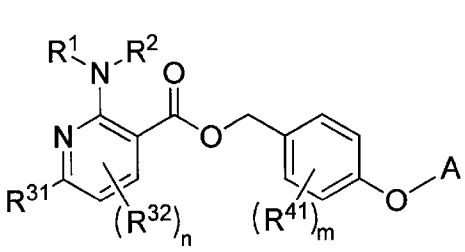
Ａは、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、または無

置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基を示す。]

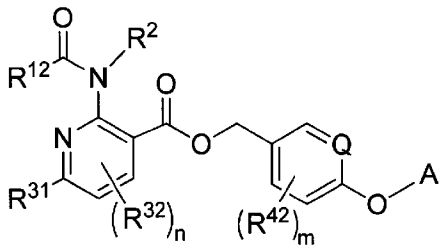
[0013] 〔２〕 Ｒ[1]及びＲ[2]が共に水素原子でないか、又は、Ｒ[1]及びＲ[2]が共に水素原子の場合はＸが－Ｏ－ではない、請求項１に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

〔３〕 下記式（１－１）～（１－８）のいずれかで表される、請求項１または２に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

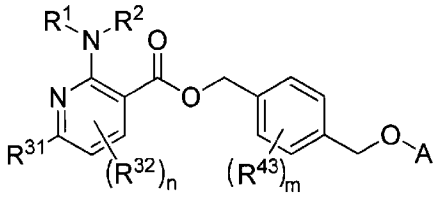
[0014] [化5]



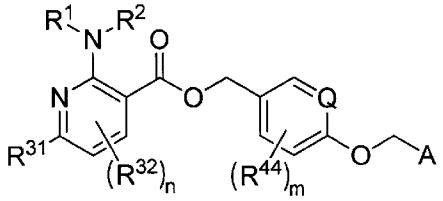
（１－１）



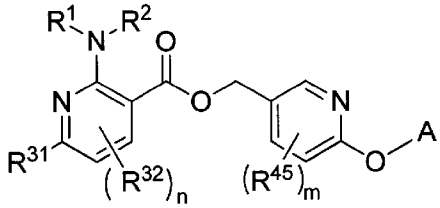
（１－２）



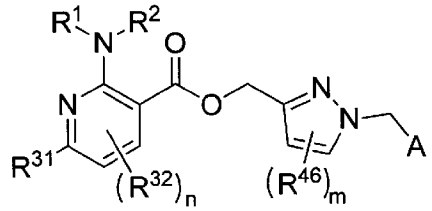
（１－３）



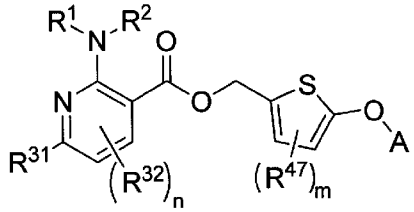
（１－４）



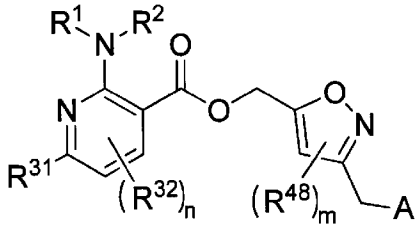
（１－５）



（１－６）



（１－７）



（１－８）

[式（１－１）～（１－８）中、

Ｒ[1]、Ｒ[2]、Ｒ[31]、Ｒ[32]、ｎ、Ａは前記同様である。

Ｒ[12]は、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基を示す。

R^{41}～R^{48}は、それぞれ独立にハロゲノ基を示す。

mはR^{41}～R^{48}の個数を示し、０～２のいずれかの整数である。mが２のとき、R^{41}～R^{48}は互いに同じであってもよく異なっていてもよい。

ＱはＣＨ、または窒素原子を示す。]

[0015] 〔４〕　R^{31}が、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基である、〔１〕～〔３〕のいずれかひとつに記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

〔５〕　Ｅが、ベンゼン環、ピリジン環、フラン環、ピロリン環、テトラゾリン環、チアゾリン環、およびピラゾリン環からなる群より選ばれる環からなる２価の基である、〔１〕または〔２〕に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

〔６〕　Ｅがベンゼン環からなる２価の基であり、Ｘが－Ｏ－である、〔１〕または〔２〕に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

〔７〕　前記〔１〕～〔６〕のいずれかひとつに記載のアミノピリジン化合物またはその塩から選ばれる少なくとも１つを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

発明の効果

[0016] 本発明のアミノピリジン誘導体は、農園芸用殺菌剤の有効成分などとして有用な新規化合物である。

本発明の農園芸用殺菌剤は、確実で優れた防除効果を有し、植物体に薬害を生じることがなく、人畜魚類に対する毒性や環境への影響が少ない、安全な薬剤である。

発明を実施するための形態

[0017] 本発明に係るアミノピリジン誘導体は、式（１）で表される化合物（以下、「化合物（１）」と表記することがある。）、またはその塩である。

[0018] まず、式（１）における、「無置換の」および「置換基を有する」の意味を説明する。

「無置換の」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。「置換

基を有する」との記載がなく母核となる基の名称のみで記載しているときは、別段の断りがない限り「無置換の」意味である。

一方、「置換基を有する」の用語は、母核となる基のいずれかの水素原子が、母核と同種または異種の構造の基で置換されていることを意味する。従って、「置換基」は、母核となる基に結合した他の基である。置換基は１つであってもよいし、２つ以上であってもよい。２つ以上の置換基は同じでも異なってもよい。

「Ｃ１～６」などの用語は、母核となる基の炭素原子数が１～６個などであることを示している。この炭素原子数には、置換基の中に在る炭素原子の数を含まない。例えば、置換基としてエトキシ基を有するブチル基は、Ｃ２アルコキシＣ４アルキル基に分類する。

[0019] 「置換基」は化学的に許容され、本発明の効果を有する限りにおいて特に制限されない。

「置換基」となり得る基としては、 フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などのハロゲノ基； メチル基、エチル基、ｎ－プロピル基、ｉ－プロピル基、ｎ－ブチル基、ｓ－ブチル基、ｉ－ブチル基、ｔ－ブチル基、ｎ－ペンチル基、ｎ－ヘキシル基などのＣ１～６アルキル基； シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのＣ３～６シクロアルキル基； ビニル基、１－プロペニル基、２－プロペニル基、１－ブテニル基、２－ブテニル基、３－ブテニル基、１－メチル－２－プロペニル基、２－メチル－２－プロペニル基、１－ペンテニル基、２－ペンテニル基、３－ペンテニル基、４－ペンテニル基、１－メチル－２－ブテニル基、２－メチル－２－ブテニル基、１－ヘキセニル基、２－ヘキセニル基、３－ヘキセニル基、４－ヘキセニル基、５－ヘキセニル基などのＣ２～６アルケニル基； ２－シクロプロペニル基、２－シクロペンテニル基、３－シクロヘキセニル基などのＣ３～６シクロアルケニル基； エチニル基、１－プロピニル基、２－プロピニル基、１－ブチニル基、２－ブチニル基、３－ブチニル基、１－メチル－２－プロピニル基、２－メチル－３－ブチニル

基、１－ペンチニル基、２－ペンチニル基、３－ペンチニル基、４－ペンチニル基、１－メチル－２－ブチニル基、２－メチル－３－ペンチニル基、１－ヘキシニル基、１，１－ジメチル－２－ブチニル基などのＣ２～６アルキニル基；

[0020] メトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、ｉ－プロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、ｓ－ブトキシ基、ｉ－ブトキシ基、ｔ－ブトキシ基などのＣ１～６アルコキシ基； ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのＣ２～６アルケニルオキシ基； エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのＣ２～６アルキニルオキシ基； フェニル基、ナフチル基などのＣ６～１０アリール基； フェノキシ基、１－ナフトキシ基などのＣ６～１０アリールオキシ基； ベンジル基、フェネチル基などのＣ７～１１アラルキル基； ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのＣ７～１１アラルキルオキシ基； ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基、シクロヘキシルカルボニル基などのＣ１～７アシル基； ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、シクロヘキシルカルボニルオキシ基などのＣ１～７アシルオキシ基； メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ｎ－プロポキシカルボニル基、ｉ－プロポキシカルボニル基、ｎ－ブトキシカルボニル基、ｔ－ブトキシカルボニル基などのＣ１～６アルコキシカルボニル基； カルボキシル基；

[0021] 水酸基； オキソ基； クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、１，２－ジクロロ－ｎ－プロピル基、１－フルオロ－ｎ－ブチル基、パーフルオロ－ｎ－ペンチル基などのＣ１～６ハロアルキル基； ２－クロロ－１－プロペニル基、２－フルオロ－１－ブテニル基などのＣ２～６ハロアルケニル基； ４，４－ジクロロ－１－ブチニル基、４－フルオロ－１－ペンチニル基、５－ブロモ－２－ペンチニル基などのＣ２～６ハロアルキニル基； ２－クロロ－ｎ－プロポキシ基、２，３－ジクロロブトキシ基などのＣ１～６ハロアルコキシ基； ２－クロロプロペニルオキシ基、３－

ブロモブテニルオキシ基などのＣ２～６ハロアルケニルオキシ基；　４－クロロフェニル基、４－フルオロフェニル基、２，４－ジクロロフェニル基などのＣ６～１０ハロアリール基；　４－フルオロフェニルオキシ基、４－クロロ－１－ナフトキシ基などのＣ６～１０ハロアリールオキシ基；　クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、４－クロロベンゾイル基などのＣ１～７ハロアシル基；

[0022] シアノ基；　イソシアノ基；　ニトロ基；　イソシアナト基；　シアナト基；　アジド基；　アミノ基；　メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのＣ１～６アルキルアミノ基；　アニリノ基、ナフチルアミノ基などのＣ６～１０アリールアミノ基；　ベンジルアミノ基、フェニルエチルアミノ基などのＣ７～１１アラルキルアミノ基；　ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチリルアミノ基、ｉ－プロピルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などのＣ１～７アシルアミノ基；　メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、ｎ－プロポキシカルボニルアミノ基、ｉ－プロポキシカルボニルアミノ基などのＣ１～６アルコキシカルボニルアミノ基；　カルバモイル基；　ジメチルカルバモイル基、フェニルカルバモイル基、Ｎ－フェニル－Ｎ－メチルカルバモイル基などの置換カルバモイル基；　イミノメチル基、（１－イミノ）エチル基、（１－イミノ）－ｎ－プロピル基などのイミノＣ１～６アルキル基；　ヒドロキシイミノメチル基、（１－ヒドロキシイミノ）エチル基、（１－ヒドロキシイミノ）プロピル基などのヒドロキシイミノＣ１～６アルキル基；メトキシイミノメチル基、（１－メトキシイミノ）エチル基などのＣ１～６アルコキシイミノＣ１～６アルキル基；

[0023] メルカプト基；　イソチオシアナト基；　チオシアナト基；　メチルチオ基、エチルチオ基、ｎ－プロピルチオ基、ｉ－プロピルチオ基、ｎ－ブチルチオ基、ｉ－ブチルチオ基、ｓ－ブチルチオ基、ｔ－ブチルチオ基などのＣ１～６アルキルチオ基；　ビニルチオ基、アリルチオ基などのＣ２～６アルケニルチオ基；　エチニルチオ基、プロパルギルチオ基などのＣ２～６アル

キニルチオ基； フェニルチオ基、ナフチルチオ基などのＣ６～１０アリールチオ基； チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などのヘテロアリールチオ基； ベンジルチオ基、フェネチルチオ基などのＣ７～１１アラルキルチオ基； （メチルチオ）カルボニル基、（エチルチオ）カルボニル基、（ｎ－プロピルチオ）カルボニル基、（ｉ－プロピルチオ）カルボニル基、（ｎ－ブチルチオ）カルボニル基、（ｉ－ブチルチオ）カルボニル基、（ｓ－ブチルチオ）カルボニル基、（ｔ－ブチルチオ）カルボニル基などの（Ｃ１～６アルキルチオ）カルボニル基；

[0024] メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ｔ－ブチルスルフィニル基などのＣ１～６アルキルスルフィニル基； アリルスルフィニル基などのＣ２～６アルケニルスルフィニル基； プロパルギルスルフィニル基などのＣ２～６アルキニルスルフィニル基； フェニルスルフィニル基などのＣ６～１０アリールスルフィニル基； チアゾリルスルフィニル基、ピリジルスルフィニル基などのヘテロアリールスルフィニル基； ベンジルスルフィニル基、フェネチルスルフィニル基などのＣ７～１１アラルキルスルフィニル基； メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ｔ－ブチルスルホニル基などのＣ１～６アルキルスルホニル基； アリルスルホニル基などのＣ２～６アルケニルスルホニル基； プロパルギルスルホニル基などのＣ２～６アルキニルスルホニル基； フェニルスルホニル基などのＣ６～１０アリールスルホニル基； チアゾリルスルホニル基、ピリジルスルホニル基などのヘテロアリールスルホニル基； ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基などのＣ７～１１アラルキルスルホニル基；

[0025] ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などの５員ヘテロアリール基； ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジル基、トリアジニル基などの６員ヘテロアリール基； アジリジニル基、エポキシ基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペリ

ジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基などの飽和ヘテロシクリル基；トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、ｔ－ブチルジメチルシリル基などのトリＣ１～６アルキルシリル基；　トリフェニルシリル基；などを挙げることができる。

[0026] また、これらの「置換基」はそれの中にさらに別の「置換基」を有するものであってもよい。例えば、置換基としてのブチル基に、別の置換基としてエトキシ基を有するもの、すなわち、エトキシブチル基のようなものであってもよい。

[0027] 〔Ｒ[1]〕

式（１）中、Ｒ[1]は、水素原子、ホルミル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルキニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルチオカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するジＣ１～８アルキルスルファモイル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シク

ロアルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールスルホニル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルスルホニル基を示す。

[0028] 「Ｃ１～８アルキル基」としては、メチル基、エチル基、ｎ－プロピル基、ｎ－ブチル基、ｎ－ペンチル基、ｎ－ヘキシル基、ｎ－ヘプチル基、ｎ－オクチル基、ｉ－プロピル基、ｉ－ブチル基、ｓ－ブチル基、ｔ－ブチル基、ｉ－ペンチル基、ネオペンチル基、２－メチルブチル基、２，２－ジメチルプロピル基、ｉ－ヘキシル基などを挙げることができる。これらのうち、Ｃ１～６アルキル基が好ましい。

[0029] 「置換基を有するＣ１～８アルキル基」としては、 シクロプロピルメチル基、２－シクロプロピルエチル基、シクロペンチルメチル基、２－シクロヘキシルエチル基などのシクロアルキルアルキル基、好ましくはＣ３～６シクロアルキルＣ１～６アルキル基； シクロペンテニルメチル基、３－シクロペンテニルメチル基、３－シクロヘキセニルメチル基、２－（３－シクロヘキセニル）エチル基などのシクロアルケニルアルキル基、好ましくはＣ４～６シクロアルケニルＣ１～６アルキル基；

[0030] フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、２，２，２－トルフルオロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、４－フルオロブチル基、４－クロロブチル基、３，３，３－トリフルオロプロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－トリフルオロメチルエチル基、パーフルオロヘキシル基、パークロロヘキシル基、パーフルオロオクチル基、パークロロオクチル基、２，４，６－トリクロロヘキシル基、パーフルオロデシル基、２，２，４，４，６，６－ヘキサクロロオクチル基などのハロアルキル基、好ましくはＣ１～６ハロアルキル基；

[0031] ベンジル基、フェネチル基、３－フェニルプロピル基、１－ナフチルメチル基、２－ナフチルメチル基などのアリールアルキル基（アラルキル基）、

好ましくはＣ６～１０アリールＣ１～６アルキル基；　２－ピリジルメチル基、３－ピリジルメチル基、４－ピリジルメチル基、２－（２－ピリジル）エチル基、２－（３－ピリジル）エチル基、２－（４－ピリジル）エチル基、３－（２－ピリジル）プロピル基、３－（３－ピリジル）プロピル基、３－（４－ピリジル）プロピル基、２－ピラジニルメチル基、３－ピラジニルメチル基、２－（２－ピラジニル）エチル基、２－（３－ピラジニル）エチル基、３－（２－ピラジニル）プロピル基、３－（３－ピラジニル）プロピル基、２－ピリミジルメチル基、４－ピリミジルメチル基、２－（２－ピリミジル）エチル基、２－（４－ピリミジル）エチル基、３－（２－ピリミジル）プロピル基、３－（４－ピリミジル）プロピル基、２－フリルメチル基、３－フリルメチル基、２－（２－フリル）エチル基、２－（３－フリル）エチル基、３－（２－フリル）プロピル基、３－（３－フリル）プロピル基などのヘテロアリールアルキル基、好ましくは５～６員ヘテロアリールＣ１～６アルキル基；

[0032] ヒドロキシメチル基、１－ヒドロキシエチル基、２－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、３－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－１－メチルエチル基、２－ヒドロキシ－１，１－ジメチルエチル基、２－ヒドロキシ－１，１－ジメチルプロピル基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基などのヒドロキシアルキル基、好ましくはヒドロキシＣ１～６アルキル基；　メトキシメチル基、エトキシメチル基、２－メトキシエチル基、２－エトキシエチル基、メトキシｎ－プロピル基、ｎ－プロポキシメチル基、ｉ－プロポキシエチル基、ｓ－ブトキシメチル基、ｔ－ブトキシエチル基、２，２－ジメトキシエチル基、２，２－ジメトキシ－１，１－ジメチルエチル基などのアルコキシアルキル基、好ましくはＣ１～６アルコキシＣ１～６アルキル基；

[0033] ホルミルオキシメチル基、アセトキシメチル基、２－アセトキシエチル基、プロピオニルオキシメチル基、プロピオニルオキシエチル基などのアシルオキシアルキル基、好ましくはＣ１～７アシルオキシＣ１～６アルキル基；

ホルミルメチル基、２－ホルミルエチル基、３－ホルミルプロピル基、１－ホルミル－１－メチルエチル基、２－ホルミル－１，１－ジメチルエチル基、アセチルメチル基、２－アセチルエチル基、３－アセチルプロピル基、１－アセチル－１－メチルエチル基、２－アセチル－１，１－ジメチルエチル基などのアシルアルキル基、好ましくはＣ１～７アシルＣ１～６アルキル基；

[0034] アセチルメチル基、２－アセチルエチル基、３－アセチルプロピル基、１－アセチル－１－メチルエチル基、２－アセチル－１，１－ジメチルエチル基などのアシルアルキル基、好ましくはＣ１～７アシルＣ１～６アルキル基；　カルボキシメチル基、２－カルボキシエチル基、３－カルボキシプロピル基、１－カルボキシ－１－メチルエチル基、２－カルボキシ－１，１－ジメチルエチル基などのカルボキシアルキル基、好ましくはカルボキシＣ１～６アルキル基；　メトキシカルボニルメチル基、２－メトキシカルボニルエチル基、３－メトキシカルボニルプロピル基、１－メトキシカルボニル－１－メチルエチル基、２－メトキシカルボニル－１，１－ジメチルエチル基などのアルコキシカルボニルアルキル基、好ましくはＣ１～６アルコキシカルボニルＣ１～６アルキル基；などを挙げることができる。

[0035] 「Ｃ１～８アルコキシ基」とは、酸素原子に前記Ｃ１～８アルキル基が結合した基である。「Ｃ１～８アルコキシ基」としては、メトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、ｉ－プロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、ｉ－ブトキシ基、ｔ－ブトキシ基、ｎ－ペンチルオキシ基、ｎ－ヘキシルオキシ基などを挙げることができる。「置換基を有するＣ１－８アルコキシ基」としては、フルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、ジブロモメトキシ基などを挙げることができる。

[0036] 「Ｃ１～８アルキルカルボニル基」とは、カルボニルに前記Ｃ１～８アルキル基が結合した基である。「Ｃ１～８アルキルカルボニル基」としては、アセチル基、プロピオニル基、ｎ－プロピルカルボニル基、ｎ－ブチルカル

ボニル基、ｔ－ブチルカルボニル基などを挙げることができる。「置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニル基」としては、モノフルオロアセチル基、モノクロロアセチル基、モノブロモアセチル基、ジフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、ジブロモアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、トリブロモアセチル基、３，３，３－トリフルオロプロピオニル基、３，３，３－トリクロロプロピオニル基、２，２，３，３，３－ペンタフルオロプロピオニル基などのＣ１～８ハロアルキルカルボニル基；メトキシメチルカルボニル基、エトキシメチルカルボニル基、メトキシエチルカルボニル基、エトキシエチルカルボニル基などのＣ１～８アルコキシＣ１～８アルキルカルボニル基；フェノキシメチルカルボニル基、１－ナフトキシメチルカルボニル基などのＣ６～１０アリールオキシＣ１～８アルキルカルボニル基などを挙げることができる。

[0037] 「Ｃ３～８シクロアルキルカルボニル基」とは、カルボニルにＣ３～８シクロアルキル基が結合した基である。カルボニル基と結合する「Ｃ３～８シクロアルキル基」は、環状部分を有する炭素原子３～８個で構成されるアルキル基である。「Ｃ３～８シクロアルキル基」としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基などを挙げることができる。これらのうち、Ｃ３～６シクロアルキル基が好ましい。カルボニル基と結合する「置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基」としては、２，３，３－トリメチルシクロブチル基、４，４，６，６－テトラメチルシクロヘキシル基、１，３－ジブチルシクロヘキシル基などのアルキル置換シクロアルキル基、好ましくはＣ１～６アルキル基が１～３個置換したＣ３～６シクロアルキル基などを挙げることができる。

[0038] 「Ｃ６～１０アリールカルボニル基」とは、カルボニルにＣ６～１０アリール基が結合した基である。カルボニル基と結合する「Ｃ６～１０アリール基」は、単環または多環の炭素数６～１０のアリール基である。なお、多環アリール基は、少なくとも一つの環が芳香環であれば、残りの環が飽和脂環

、不飽和脂環または芳香環のいずれであってもよい。Ｃ６～１０アリール基としては、フェニル基、ナフチル基、アズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げることができる。これらのうち、フェニル基が好ましい。カルボニル基と結合する「置換基を有するＣ６～１０アリール基」としては、２－クロロフェニル基、３，５－ジクロロフェニル基、４－フルオロフェニル基、３，５－ジフルオロフェニル基、４－トリフルオロメチルフェニル基、２－メトキシ－１－ナフチル基などの、アルキル置換アリール基、ハロゲノ置換アリール基、アルコキシ置換アリール基、好ましくはＣ１～６アルキル置換Ｃ６～１０アリール基、ハロゲノ置換Ｃ６～１０アリール基、Ｃ１～６アルコキシ置換アリール基を挙げることができる。

[0039] 「５～１０員ヘテロシクリルカルボニル基」とは、カルボニルに５～１０員ヘテロシクリル基が結合した基である。カルボニル基と結合する「５～１０員ヘテロシクリル基」は、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる１～４個のヘテロ原子を環の構成原子として含む５～１０員環の基である。ヘテロシクリル基は、単環であってもよいし、多環であってもよい。

ヘテロシクリル基としては、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、縮合ヘテロアリール基、飽和ヘテロシクリル基、部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げることができる。

[0040] ５員ヘテロアリール基としては、 ピロール－１－イル基、ピロール－２－イル基、ピロール－３－イル基などのピロリル基； フラン－２－イル基、フラン－３－イル基などのフリル基； チオフェン－２－イル基、チオフェン－３－イル基などのチエニル基； イミダゾール－１－イル基、イミダゾール－２－イル基、イミダゾール－４－イル基、イミダゾール－５－イル基などのイミダゾリル基； ピラゾール－１－イル基、ピラゾール－３－イル基、ピラゾール－４－イル基、ピラゾール－５－イル基などのピラゾリル基；オキサゾール－２－イル基、オキサゾール－４－イル基、オキサゾール－５－イル基などのオキサゾリル基； イソオキサゾール－３－イル基、イソオキサゾール－４－イル基、イソオキサゾール－５－イル基などのイソオ

キサゾリル基； チアゾール－２－イル基、チアゾール－４－イル基、チアゾール－５－イル基などのチアゾリル基；

[0041] イソチアゾール－３－イル基、イソチアゾール－４－イル基、イソチアゾール－５－イル基などのイソチアゾリル基； １，２，３－トリアゾール－１－イル基、１，２，３－トリアゾール－４－イル基、１，２，３－トリアゾール－５－イル基、１，２，４－トリアゾール－１－イル基、１，２，４－トリアゾール－３－イル基、１，２，４－トリアゾール－５－イル基などのトリアゾリル基； １，２，４－オキサジアゾール－３－イル基、１，２，４－オキサジアゾール－５－イル基、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル基などのオキサジアゾリル基； １，２，４－チアジアゾール－３－イル基、１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、１，３，４－チアジアゾール－２－イル基などのチアジアゾリル基； テトラゾール－１－イル基、テトラゾール－２－イル基などのテトラゾリル基；などを挙げることができる。

[0042] ６員ヘテロアリール基としては、 ピリジン－２－イル基、ピリジン－３－イル基、ピリジン－４－イル基などのピリジル基； ピラジン－２－イル基、ピラジン－３－イル基などのピラジニル基； ピリミジン－２－イル基、ピリミジン－４－イル基、ピリミジン－５－イル基などのピリミジニル基； ピリダジン－３－イル基、ピリダジン－４－イル基などのピリダジニル基；トリアジニル基；などを挙げることができる。

[0043] 縮合ヘテロアリール基としては、 インドール－１－イル基、インドール－２－イル基、インドール－３－イル基、インドール－４－イル基、インドール－５－イル基、インドール－６－イル基、インドール－７－イル基；ベンゾフラン－２－イル基、ベンゾフラン－３－イル基、ベンゾフラン－４－イル基、ベンゾフラン－５－イル基、ベンゾフラン－６－イル基、ベンゾフラン－７－イル基； ベンゾチオフェン－２－イル基、ベンゾチオフェン－３－イル基、ベンゾチオフェン－４－イル基、ベンゾチオフェン－５－イル基、ベンゾチオフェン－６－イル基、ベンゾチオフェン－７－イル基；

ベンゾイミダゾール－１－イル基、ベンゾイミダゾール－２－イル基、ベンゾイミダゾール－４－イル基、ベンゾイミダゾール－５－イル基、ベンゾオキサゾール－２－イル基、ベンゾオキサゾール－４－イル基、ベンゾオキサゾール－５－イル基、ベンゾチアゾール－２－イル基、ベンゾチアゾール－４－イル基、ベンゾチアゾール－５－イル基； キノリン－２－イル基、キノリン－３－イル基、キノリン－４－イル基、キノリン－５－イル基、キノリン－６－イル基、キノリン－７－イル基、キノリン－８－イル基；などを挙げることができる。

[0044] その他の飽和ヘテロシクリル基としては、 アジリジン－１－イル基、アジリジン－２－イル基、オキシラニル基などの３員飽和ヘテロシクリル基；

ピロリジン－１－イル基、ピロリジン－２－イル基、ピロリジン－３－イル基、テトラヒドロフラン－２－イル基、テトラヒドロフラン－３－イル基、［１，３］ジオキシラン－２－イル基などの５員飽和ヘテロシクリル基；

ピペリジン－１－イル基、ピペリジン－２－イル基、ピペリジン－３－イル基、ピペリジン－４－イル基、ピペラジン－１－イル基、ピペラジン－２－イル基、モルホリン－２－イル基、モルホリン－３－イル基、モルホリン－４－イル基などの６員飽和ヘテロシクリル基；などを挙げることができる。

その他の部分飽和ヘテロシクリル基としては、 １，３－ベンゾジオキソール－４－イル基、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル基、１，４－ベンゾジオキサン－５－イル基、１，４－ベンゾジオキサン－６－イル基、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－１，５－ベンゾジオキセピン－６－イル基、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－１，５－ベンゾジオキセピン－７－イル基、２，３－ジヒドロベンゾフラン－４－イル基、２，３－ジヒドロベンゾフラン－５－イル基、２，３－ジヒドロベンゾフラン－６－イル基、２，３－ジヒドロベンゾフラン－７－イル基；などを挙げることができる。

[0045] カルボニル基と結合する「置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基」としては、４－クロロ－２－ピリジニル基、３－クロロ－２－ピラジニル基

、４－メチル－２－ピリジニル基、５－トリフルオロメチル－２－ピリミジニル基、３－メチル－２－キノリル基などを挙げることができる。

[0046] 「Ｃ３～８シクロアルキルＣ１～６アルキルカルボニル基」とは、Ｃ３～８シクロアルキル基がＣ１～６アルキルカルボニル基と結合した基である。

無置換の又は置換基を有するＣ１～６アルキルカルボニル基と結合する「Ｃ３～８シクロアルキル基」及び「置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基」としては、それぞれ、前記「Ｃ３～８シクロアルキルカルボニル基」の説明の中で挙げた「Ｃ３～８シクロアルキル基」及び「置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基」と同じものを挙げることができる。また、「Ｃ１～６アルキルカルボニル基」及び「置換基を有するＣ１～６アルキルカルボニル基」としては、それぞれ、前記「Ｃ１～８アルキルカルボニル基」の説明の中で挙げたもののうちＣ１～６の「アルキルカルボニル基」及び「置換基を有するアルキルカルボニル基」と同じものを挙げることができる。

[0047] 「無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールＣ１～６アルキルカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基がＣ１～６アルキルカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基は既に述べたものと同じものを挙げることができる。

[0048] 「無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルＣ１～６アルキルカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基がＣ１～６アルキルカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基は既に述べたものと同じものを挙げることができる。

[0049] 「無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルオキシカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルオキシ基がカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルオキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ｎ－プロポキシカルボニル基、ｉ－プロポキシカルボニル基、ｎ

－ブトキシカルボニル基、ｔ－ブトキシカルボニル基などを挙げることができる。

[0050] 「無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルケニルオキシカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルケニルオキシ基がカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルケニルオキシ基としては、ビニルオキシ基、１－プロペニルオキシ基、２－プロペニルオキシ基、１－ブテニルオキシ基、２－ブテニルオキシ基、３－ブテニルオキシ基、１－メチル－２－プロペニルオキシ基、２－メチル－２－プロペニルオキシ基、１－ペンテニルオキシ基、２－ペンテニルオキシ基、３－ペンテニルオキシ基、４－ペンテニルオキシ基、１－メチル－２－ブテニルオキシ基、２－メチル－２－ブテニルオキシ基、１－ヘキセニルオキシ基、２－ヘキセニルオキシ基、３－ヘキセニルオキシ基、４－ヘキセニルオキシ基、５－ヘキセニルオキシ基などを挙げることができる。

[0051] 「無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルキニルオキシカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルキニルオキシ基がカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルキニルオキシ基としては、エチニルオキシ基、１－プロピニルオキシ基、２－プロピニルオキシ基、１－ブチニルオキシ基、２－ブチニルオキシ基、３－ブチニルオキシ基、１－メチル－２－プロピニルオキシ基、２－メチル－３－ブチニルオキシ基、１－ペンチニルオキシ基、２－ペンチニルオキシ基、３－ペンチニルオキシ基、４－ペンチニルオキシ基、１－メチル－２－ブチニルオキシ基、２－メチル－３－ペンチニルオキシ基、１－ヘキシニルオキシ基、１，１－ジメチル－２－ブチニルオキシ基などを挙げることができる。

[0052] 「無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルオキシカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルオキシ基がカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルオキシ基としては、シクロプロピルオキシ基、シ

クロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基などを挙げることができる。「置換基を有するＣ３～８シクロアルコキシ基」としては、クロロシクロヘキシルオキシ基、ブロモシクロヘキシルオキシ基、２－メチルシクロプロピルオキシ基、２，３－ジメチルシクロプロピルオキシ基、スピロ［２．２］ペンター１－イルオキシ基、１－メチル－スピロ［２．２］ペンター１－イルオキシ基、１－ヒドロキシメチルスピロ［２．２］ペンター１－イルオキシ基、４，４－ジフルオロ－スピロ［２．２］ペンター１－イルオキシ基、ビシクロプロピル－２－イル基オキシなどを挙げることができる。

[0053] 「無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシ基がカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシ基としては、フェノキシ基、１－ナフトキシ基などを挙げることができる。

[0054] 「無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシカルボニル基」とは、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基がカルボニル基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基は、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基がオキシ基と結合した基である。無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基は既に述べたとおりのものと同じものを挙げることができる。「５～１０員ヘテロシクリルオキシ基」としては、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基などを挙げることができる。

[0055] 無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルチオカルボニル基としては（メチルチオ）カルボニル基、（エチルチオ）カルボニル基、（ｎ－プロピルチオ）カルボニル基、（ｉ－プロピルチオ）カルボニル基、（ｎ－ブチルチオ）カルボニル基、（ｉ－ブチルチオ）カルボニル基、（ｓ－ブチルチオ）カルボニル基、（ｔ－ブチルチオ）カルボニル基などを挙げることが

できる。

[0056] 無置換の若しくは置換基を有するジＣ１～８アルキルスルファモイル基としては、Ｎ－メチルスルファモイル基、Ｎ－エチルスルファモイル基などを挙げることができる。

無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ｔ－ブチルスルホニル基などを挙げることができる。

無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルスルホニル基としては、シクロプロピルスルホニル基、シクロブチルスルホニル基、シクロペンチルスルホニル基、シクロヘキシルスルホニル基などを挙げることができる。

[0057] 無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールスルホニル基としては、フェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基などを挙げることができる。

無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルスルホニル基は、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基がスルホニル基と結合してなる基である。無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基は既に述べたものと同じものを挙げることができる。

[0058] 〔R^2〕

R^2は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、または無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニル基を示す。これらはR^1の説明において既に述べたものと同じものを挙げることができる。

[0059] なかでも、R^1及びR^2が共に水素原子でないか、又は、R^1及びR^2が共に水素原子の場合は、後述するＸが－Ｏ－以外であることが好ましい。

すなわち、R^2が水素原子の場合、R^1はホルミル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニ

ル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルキニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルチオカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するジＣ１～８アルキルスルファモイル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールスルホニル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルスルホニル基であることが好ましい。また、R^1及びR^2が共に水素原子の場合、Ｘは、－CH_2－、－Ｓ－、－ＮＨ－、－CH_2CH_2－、－CH_2O－、－OCH_2－、－CH_2S－、－SCH_2－、－CH_2NH－、または－$NHCH_2$－であることが好ましい。

[0060] 〔R^{31}〕

R^{31}は、水素原子、ハロゲノ基、シアノ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、無置換の若しくは置換基を有するＣ

６～１０アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

[0061] なかでも、R^{31}としては、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、または無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基が好ましく；水素原子、無置換のＣ１～８アルキル基、または無置換のＣ１～８アルコキシ基がより好ましく；無置換のＣ１～８アルキル基または無置換のＣ１～８アルコキシ基がさらに好ましく；無置換のＣ１～８アルキル基が特に好ましい。また、無置換のＣ１～８アルキル基としてはメチル基が好ましく、無置換のＣ１～８アルコキシ基としてはメトキシ基が好ましい。

[0062] 〔R^{32}〕

R^{32}は、ハロゲノ基、シアノ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基を示す。これらはR^{1}の説明において既に述べたものと同じものを挙げることができる。

[0063] ｎはR^{32}の個数を示し、０～２のいずれかの整数である。ｎが２のとき、R^{32}は互いに同じでも異なってもよい。

[0064] 〔Ｅ〕

Ｅは、無置換の若しくは置換基を有するベンゼン環からなる２価の基、または無置換の若しくは置換基を有する５～６員のヘテロ環からなる２価の基を示す。これらのうち、ベンゼン環、ピリジン環、フラン環、ピロリン環、テトラゾリン環、チアゾリン環、およびピラゾリン環からなる群より選ばれ

る環からなる２価の基が好ましく、ベンゼン環からなる２価の基がより好ましい。

[0065] 〔Ｘ〕

Ｘは、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＨ－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$Ｏ－、－ＯＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$Ｓ－、－ＳＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＮＨ－、または－ＮＨＣＨ$_2$－を示す。これらのうち、－Ｏ－が好ましい。

[0066] 〔Ａ〕

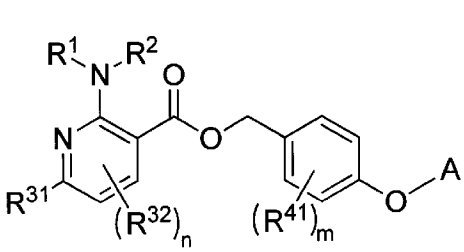
Ａは、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基を示す。これらはＲ^{1}の説明において既に述べたものと同じものを挙げることができる。

[0067] なかでも、Ａの好ましい具体例としては、フェニル基、２－フルオロフェニル基、３－フルオロフェニル基、４－フルオロフェニル基、ピリジン－２－イル基、チオフェン－３－イル基等が挙げられる。これらの中でも、フェニル基、２－フルオロフェニル基、３－フルオロフェニル基、４－フルオロフェニル基、またはピリジン－２－イル基が好ましく；フェニル基、２－フルオロフェニル基、またはピリジン－２－イル基がより好ましい。

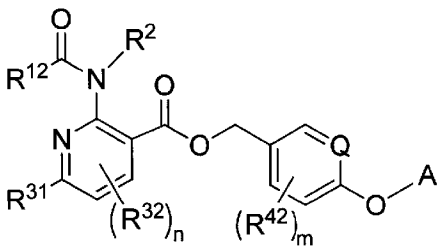
[0068] また、本発明に係るアミノピリジン化合物としては、下記式（１－１）～（１－８）で表される化合物も好ましい。

[0069]

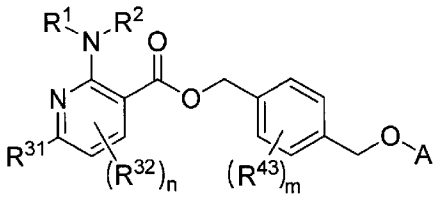
[化6]



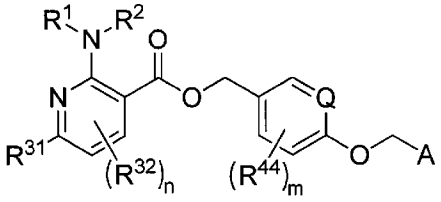
（1－1）



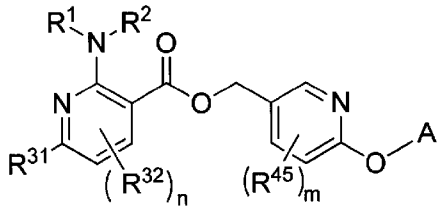
（1－2）



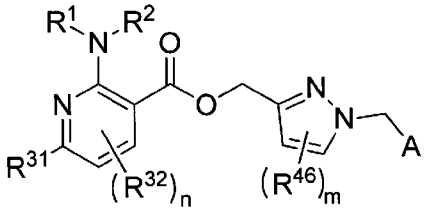
（1－3）



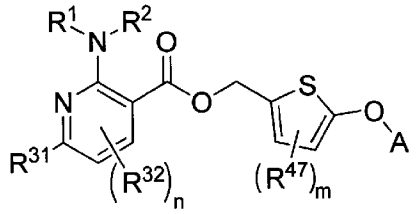
（1－4）



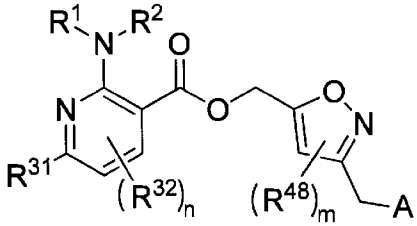
（1－5）



（1－6）



（1－7）



（1－8）

［式（1－1）～（1－8）中、

R^1、R^2、R^{31}、R^{32}、n、Aは前記同様である。

R^{12}は、無置換の若しくは置換基を有するC1～8アルキル基を示す。

R^{41}～R^{48}は、それぞれ独立にハロゲノ基を示す。

mはR^{41}～R^{48}の個数を示し、0～2のいずれかの整数である。mが2のとき、R^{41}～R^{48}は互いに同じであってもよく異なっていてもよい。

QはCH、または窒素原子を示す。］

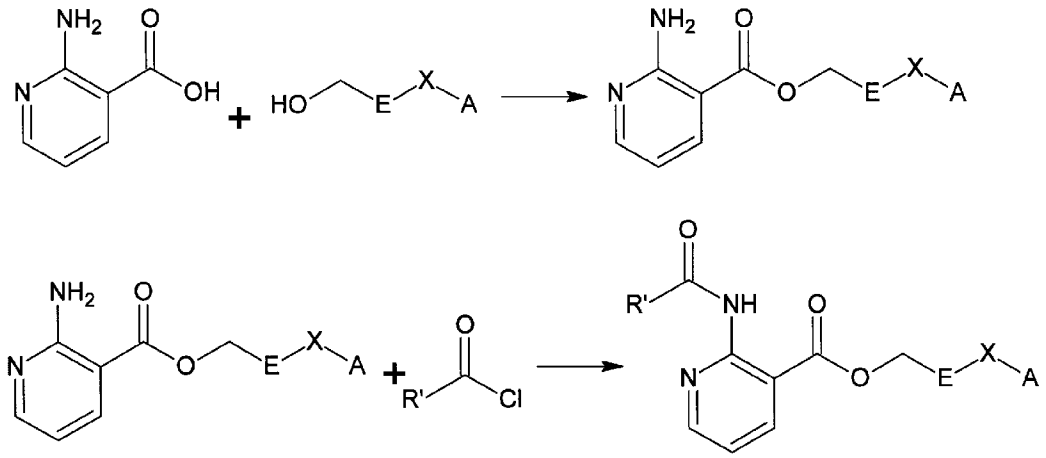
[0070] 上記式中、無置換の若しくは置換基を有するC1～8アルキル基、ハロゲノ基は前記同様である。

[0071] 本発明に係るアミノピリジン化合物には、水和物、各種溶媒和物や結晶多形などが含まれる。さらに、本発明に係るアミノピリジン化合物は、不斉炭素原子、二重結合などに基づく立体異性体およびそれらの混合物を包含する。

[0072] 本発明に係るアミノピリジン化合物の塩は、化合物（１）の塩である。塩としては、農園芸学的に許容される塩であれば、特に制限されない。例えば、塩酸、硫酸などの無機酸の塩；酢酸、乳酸などの有機酸の塩；リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属の塩；カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属の塩；鉄、銅などの遷移金属の塩；アンモニア、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ヒドラジンなどの有機塩基の塩などを挙げることができる。化合物（１）の塩は、化合物（１）から公知の手法によって得ることができる。

[0073] 本発明に係るアミノピリジン誘導体は、その製造方法によって特に限定されない。本発明に係るアミノピリジン誘導体は、例えば、特許文献２などに記載されている公知の方法や、他の公知の方法を組み合わせることにより製造することができる。例えば、前記式（１）において、R^1がアルキルカルボニル基であり、R^2、R^{31}が水素原子であり、ｎが０である本発明に係るアミノピリジン誘導体は、下式で表わされる合成方法によって製造することができる。

[0074] [化7]



（式中、Ｅ、ＸおよびＡは、それぞれ、前記式（１）に記載されたＥ、ＸおよびＡと同じものを示し、Ｒ’は、無置換の若しくは置換基を有するアルキル基等を示す。）

[0075] 合成反応終了後は、有機合成化学における通常の後処理操作、および、必要により従来公知の分離精製手段を施すことによって、目的物を効率よく単離することができる。

目的物の構造は、^{1}H-NMRスペクトル、IRスペクトル、マススペクトルの測定や、元素分析などにより、同定・確認することができる。

[0076] 本発明に係る農園芸用殺菌剤は、化合物（１）またはその塩からなる群から選ばれる少なくとも１つを有効成分として含有するものである。

本発明の殺菌剤に含有される有効成分の量は、製剤全体に対して、好ましくは０．０１～９０質量%、より好ましくは０．０５～８５質量%、より更に好ましくは０．０５～８０質量%程度である。

[0077] 前記農園芸用殺菌剤は、農薬としてとり得る形態、例えば、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤などの形態で使用することができる。

[0078] 本発明の農園芸用殺菌剤には、本発明の効果に影響を与えない範囲において、肥料、固体担体、増粘剤、界面活性剤、展着剤、添加剤、溶剤などが含まれていてもよい。

[0079] 肥料としては、堆肥、油粕、魚粉、牛糞、鶏糞等あるいはこれらを加工してなる有機資材；硫酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、硝酸石灰、尿素等の窒素肥料；過リン酸石灰、リン酸第一アンモニウム、熔成リン肥等のリン酸肥料；塩化カリウム、硫酸カリウム、硝酸カリウム等のカリ肥料；苦土石灰等の苦土肥料；消石灰等の石灰肥料；ケイ酸カリウム等のケイ酸肥料；ホウ酸塩等のホウ素肥料；各種無機肥料を含有してなる化成肥料；等が挙げられる。

[0080] 固体担体としては、大豆粒、小麦粉などの植物性粉末；二酸化ケイ素、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレー

、目土などの鉱物性微粉末等が挙げられる。

[0081] 添加剤としては、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝などの有機および無機化合物など；ナタネ油、大豆油、ヒマワリ油、ヒマシ油、マツ（ｐｉｎｅ）油、綿実油、並びにこれらの油の誘導体や、これらの油濃縮物などが挙げられる。

[0082] 溶剤としては、ケロシン、キシレン；ソルベントナフサなどの石油留分；シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水などが挙げられる。

[0083] 界面活性剤としては、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテルなどの非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、高級アルコールの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン－無水マレイン酸共重合体などを挙げることができる。

[0084] 増粘剤としては、特に限定されない。例えば、澱粉、デキストリン、セルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドキシプロピルセルロース、カルボキシメチルデンプン、プルラン、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸アンモニウム、アルギン酸プロピレングリコールエステル、グアーガム、ローカストビーンガム、アラビアゴム、キサンタンガム、ゼラチン、カゼイン、ポリビニルアルコール、ポリエチレンオキサイド、ポリエチレングリコール、エチレン・プロピレンブロックポリマー、ポリアクリル酸ナトリウム、ポリビニルピロリドン、カラギーナン等が挙げられる。

[0085] 展着剤としては、アルキル硫酸ソーダ、アルキルベンゼンスルホン酸ソーダ、リグニンスルホン酸ソーダ、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリオキシエチレンラウリルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルなどが挙げられる。

[0086] 前記式（Ｉ）で表される化合物およびその塩から選ばれる少なくとも１つを含有する、水和剤、乳剤、フロアブル剤、水溶剤、若しくは顆粒水和剤は、水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液として植物に散布する方法で使用することができる。また、粉剤・粒剤はそのまま植物に散布する方法で使用することができる。

[0087] 本発明の農園芸用殺菌剤の処理の対象となる有用な植物としては、穀物類、野菜類、根菜類、イモ類、樹木類、牧草類、芝類などが挙げられる。ここにおいては、これら植物類の各部位を対象として処理することもできる。植物類の各部位としては、葉、茎、柄、花、蕾、果実、種子、スプラウト、根、塊茎、塊根、苗条、挿し木などが挙げられる。また、これら植物類の改良品種・変種、栽培品種、さらには突然変異体、ハイブリッド体、遺伝子組み換え体（ＧＭＯ）を対象として処理することもできる。

[0088] 化合物（１）またはその塩は、優れた殺菌作用を有することから、これを含む前記農園芸用殺菌剤は、広範囲の種類の糸状菌、例えば、藻菌類（Oomycetes）、子のう（嚢）菌類（Ascomycetes）、不完全菌類（Deuteromycetes）、担子菌類（Basidiomycetes）に属する菌に由来する植物病害の防除に使用できる。

したがって、本発明の農園芸用殺菌剤は、花卉、芝、牧草を含む農園芸作物に発生する種々の病害の防除をするために行われる種子処理、茎葉散布、土壌施用、水面施用などに使用することができる。

[0089] 防除の対象となる植物病害の例を以下に示す。

テンサイ：褐斑病（Cercospora beticola）、黒根病（Aphanomyces cochlioides）、根腐病（Thanatephorus cucumeris）、葉腐病（Thanatephorus cuc

umeris) など

ラッカセイ：褐斑病 (Mycosphaerella arachidis) 、黒渋病 (Mycosphaerella berkeleyi) など

[0090] キュウリ：うどんこ病 (Sphaerotheca fuliginea) 、べと病 (Pseudoperonospora cubensis) 、つる枯病 (Mycosphaerella melonis) 、つる割病 (Fusarium oxysporum) 、菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、炭そ病 (Colletotrichum orbiculare) 、黒星病 (Cladosporium cucumerinum) 、褐斑病 (Corynespora cassicola) 、苗立枯病 (Pythium debaryanam、Rhizoctonia solani Kuhn) 、斑点細菌病 (Pseudomonas syringae pv. Lecrymans) など

トマト：灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、葉かび病 (Cladosporium fulvum) 、疫病 (Phytophthora infestans) 、半身萎凋病 (Verticillium albo-atrum) など

ナス：灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、黒枯病 (Corynespora melongenae) 、うどんこ病 (Erysiphe cichoracearum) 、すすかび病 (Mycovellosiella nattrassii) 、菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) など

イチゴ：灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、うどんこ病 (Sohaerotheca humuli) 、炭そ病 (Colletotrichum acutatum、Colletotrichum fragariae) 、疫病 (Phytophthora cactorum) など

タマネギ：灰色腐敗病 (Botrytis allii) 、灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、白斑葉枯病 (Botrytis squamosa) 、べと病 (Peronospora destructor) 、白色疫病 (Phytophthora porri) など

キャベツ：根こぶ病 (Plasmodiophora brassicae) 、軟腐病 (Erwinia carotovora) 、黒腐病 (Xanthomonas campesrtis pv. campestris) 、黒斑細菌病 (Pseudomonas syringae pv. maculicala、Pseudomonas syringae pv. alisalensis) 、べと病 (Peronospora parasitica) 、菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) など

インゲン：菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、灰色かび病 (Botrytis

cinerea) など

[0091] りんご：うどんこ病 (Podosphaera leucotricha) 、黒星病 (Venturia inaequalis) 、モニリア病 (Monilinia mali) 、黒点病 (Mycosphaerella pomi) 、腐らん病 (Valsa mali) 、斑点落葉病 (Alternaria mali) 、赤星病 (Gymnosporangium yamadae) 、輪紋病 (Botryosphaeria berengeriana) 、炭そ病 (Glomerella cingulata、Colletotrichum acutatum) 、褐斑病 (Diplocarpon mali) 、すす点病 (Zygophiala jamaicensis) 、すす斑病 (Gloeodes pomigena) 、紫紋羽病 (Helicobasidium mompa) など

カキ：うどんこ病 (Phyllactinia kakicola) 、炭そ病 (Gloeosporium kaki) 、角斑落葉病 (Cercospora kaki) など

モモ：灰星病 (Monilinia fructicola) 、黒星病 (Cladosporium carpophilum) 、ホモプシス腐敗病 (Phomopsis sp.) 、穿孔細菌病 (Xanthomonas campestris pv. pruni) など

オウトウ：灰星病 (Monilinia fructicola) 、炭そ病 (Colletotrichum acutatum) など

ブドウ：灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、うどんこ病 (Uncinula necator) 、晩腐病 (Glomerella cingulata、Colletotrichum acutatum) 、べと病 (Plasmopara viticola) 、黒とう病 (Elsinoe ampelina) 、褐斑病 (Pseudocercospora vitis) 、黒腐病 (Guignardia bidwellii) など

ナシ：黒星病 (Venturia nashicola) 、赤星病 (Gymnosporangium asiaticum) 、黒斑病 (Alternaria kikuchiana) 、輪紋病 (Botryosphaeria berengeriana) 、うどんこ病 (Phyllactinia mali) 、胴枯病 (Phomopsis fukushii) 、褐色斑点病 (Stemphylium vesicarium) 、炭そ病 (Glomerella cingulata) など

チャ：輪斑病 (Pestalotia theae) 、炭そ病 (Colletotrichum theae-sinensis) など

カンキツ：そうか病 (Elsinoe fawcetti) 、青かび病 (Penicillium italicum) 、緑かび病 (Penicillium digitatum) 、灰色かび病 (Botrytis cinere

a)、黒点病 (Diaporthe citri)、かいよう病 (Xanthomonas campestris pv.Citri) など

[0092] コムギ：うどんこ病 (Erysiphe graminis f.sp.Tritici)、赤かび病 (Gibberella zeae)、赤さび病 (Puccinia recondita)、褐色雪腐病 (Pythium iwayamai)、紅色雪腐病 (Monographella nivalis)、眼紋病 (Pseudocercosporella herpotrichoides)、葉枯病 (Septoria tritici)、ふ枯病 (Leptosphaeria nodorum)、雪腐小粒菌核病 (Typhula incarnata)、雪腐大粒菌核病 (Myriosclerotinia borealis)、立枯病 (Gaeumanomyces graminis) など

オオムギ：斑葉病 (Pyrenophora graminea)、網斑病 (Pyrenophora teres)、雲形病 (Rhynchosporium secalis)、裸黒穂病 (Ustilago tritici、U.nuda) など

イネ：いもち病 (Pyricularia oryzae)、紋枯病 (Rhizoctonia solani)、馬鹿苗病 (Gibberella fujikuroi)、ごま葉枯病 (Cochliobolus miyabeanus)、苗立枯病 (Pythium graminicolum)、白葉枯病 (Xanthomonas oryzae)、苗立枯細菌病 (Burkholderia plantarii)、褐条病 (Acidovorax avenae)、もみ枯細菌病 (Burkholderia glumae)、すじ葉枯病 (Cercospora oryzae)、稲こうじ病 (Ustilaginoidea virens)、褐色米 (Alternaria alternata、Curvularia intermedia)、腹黒米 (Alternaria padwickii)、紅変米 (Epicoccam purpurascenns) など

タバコ：菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum)、うどんこ病 (Erysiphe cichoracearum) など

チューリップ：灰色かび病 (Botrytis cinerea) など

ベントグラス：雪腐大粒菌核病 (Sclerotinia borealis)、ラージパッチ (Rhizoctonia solani)、ダラースポット (Sclerotinia homoeocarpa)、いもち病 (Pyricularia sp.)、赤焼病 (Pythium aphanidermatum)、炭そ病(Colletotrichum graminicola)など

オーチャードグラス：うどんこ病 (Erysiphe graminis) など

ダイズ：紫斑病 (Cercospora kikuchii)、べと病 (Peronospora Manshuri

ca）、茎疫病（Phytophthora sojae）、さび病（Phakopsora pachyrhizi）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、炭そ病（Colletotrichum truncatum）など

ジャガイモ：疫病（Phytophthora infestans）など

バナナ：パナマ病（Fusarium oxysporum）、シガトカ病（Mycosphaerella fijiensis、Mycosphaerella musicola）など

ナタネ：菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、根朽病（Phoma lingam）、黒斑病（Alternaria brassicae）など

[0093] 本発明の殺菌剤は、他の殺菌剤、殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、植物調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料、他の殺菌剤などと混用または併用してもよい。

[0094] 本発明の殺菌剤の施用量は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用方法、施用場所、防除対象病害、対象作物などにより異なるが、通常１ヘクタール当たり有効成分量にして１～１，０００ｇ、好ましくは１０～１００ｇである。

水和剤、乳剤、懸濁剤、水溶剤、顆粒水和剤などを水で希釈して施用する場合、その施用濃度は１～１，０００ｐｐｍ、好ましくは１０～２５０ｐｐｍである。

[0095] 本発明の殺菌剤は薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

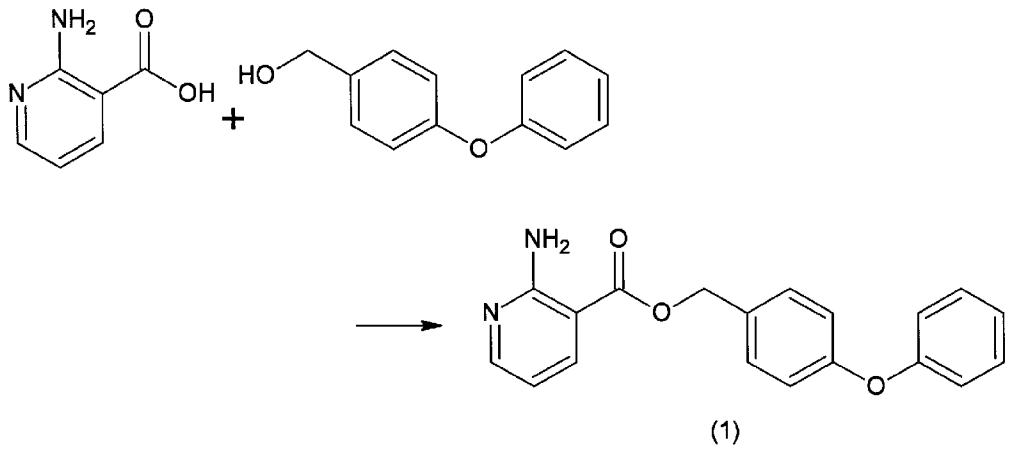
実施例

[0096] 次に、実施例を挙げて本発明を更に詳細に説明するが、本発明は以下の実施例により何ら限定されることはない。

[0097] 合成例１

[0098]

[化8]



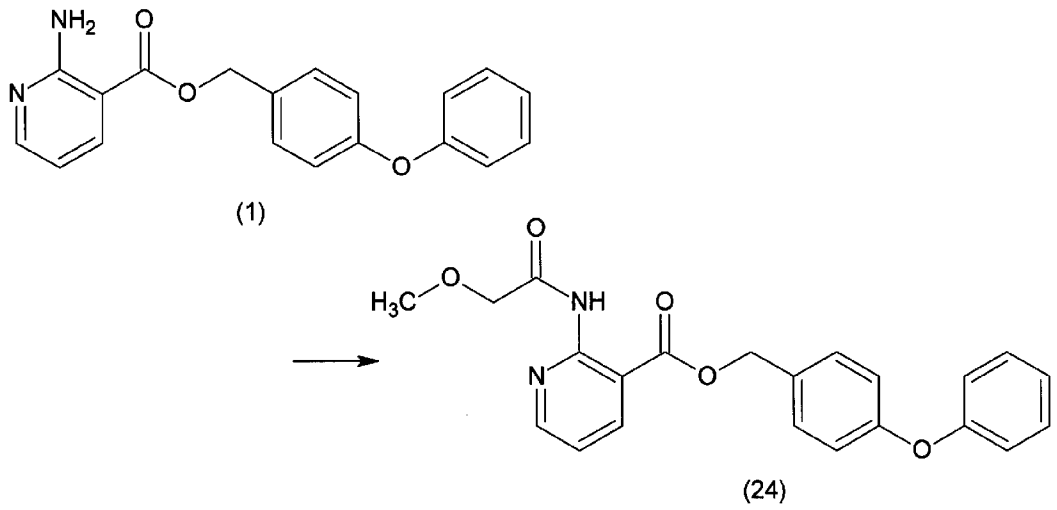
(1)

[0099] フラスコに２－アミノニコチン酸０．６０ｇ（４．３４ｍｍｏｌ）を入れ、これにＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド２０ｍＬを加えた。これに４－フェノキシベンジルアルコール０．９４ｇ（４．３４ｍｍｏｌ）、トリエチルアミン１．３２ｇ（１３．０２ｍｍｏｌ）、およびベンゾトリアゾール-1-イルオキシ-トリスジメチルアミノホスホニウム塩（(Benzotriazol-1-yloxy)-tris(dimetylamino)phosphonium hexafluorophosphate; 略号ＢＯＰ）２．１１ｇ（４．７７ｍｍｏｌ）を室温で加え、窒素雰囲気下、室温で２４時間攪拌した。得られた液を酢酸エチル１００ｍＬと水１００ｍＬの混合液に注ぎ、分液操作で有機層を回収した。一方で水層を酢酸エチル１００ｍＬで抽出し、有機層を回収した。２つの有機層を一つに集め、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた残渣を山善カラムで精製し、無色の結晶として化合物(1)を１．２８ｇ（収率９２％）得た。

[0100] 合成例２

[0101]

[化9]

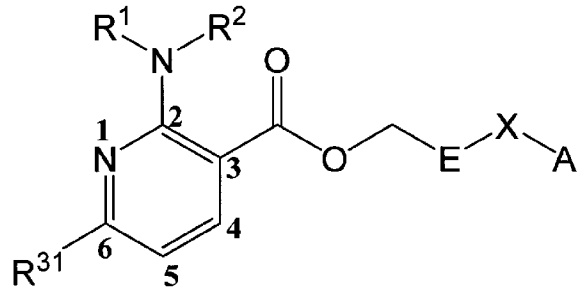


[0102] フラスコに化合物(1) ０．３０ｇ（０．９４ｍｍｏｌ）を入れ、これにピリジン１０ｍＬを加えた。これにメトキシアセチルクロリド０．１５ｇ（１．４０ｍｍｏｌ）を室温で加え、窒素雰囲気下、６０～７０℃で６時間攪拌した。得られた液を室温まで冷却した。その後、該液を濃縮した。濃縮液を酢酸エチル１００ｍＬと水１００ｍＬの混合液に注ぎ、分液操作で有機層を回収した。一方で水層を酢酸エチル１００ｍＬで抽出し、有機層を回収した。二つの有機層を一つに集め、ブライン５０ｍＬで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた残渣を山善カラムで精製し、無色の油状物質として化合物(24)を０．２８ｇ（収率７７％）得た。

[0103] 合成例１や合成例２と同様の方法で各種のアミノピリジン誘導体を製造した。製造されたアミノピリジン誘導体の一部を表１に示す。表１中のR^1、R^2、R^{31}、R^{32}、Ｅ、Ｘ、およびＡは、式（１）中のそれらを示す。表１のＥの欄中、＊はＸとの結合手、＋は炭素原子との結合手を示す。表１のＡの欄中、＊はＸとの結合手を示す。表１中、Ｐｈはフェニル基を、Ｐｙはピリジル基を、Ｍｅはメチル基を、Ｅｔはエチル基をそれぞれ示す。また、表１のR^{32}の欄中の「５－Ｆ」は、

[0104]

[化10]

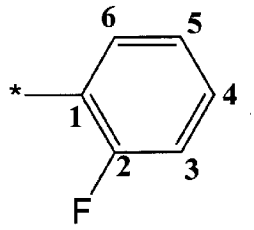


[0105] の構造の５位に置換基としてＦが接続していることを表す。「５－ＣｌＩ」も同様の表記方法である。

表１のＲ[31]およびＲ[32]の欄中の「－」は、置換基を有していないことを示し、具体的には水素原子を表している。

表１のＡの欄中の「２－Ｆ－Ｐｈ」は、

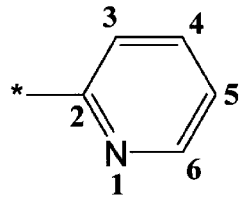
[0106] [化11]



[0107] の構造を示し、数字は置換基の位置を示し、ＦはＰｈの置換基の種類を表す。「３－Ｆ－Ｐｈ」および「４－Ｆ－Ｐｈ」ならびに「４－ＣｌＩ－Ｐｈ」も同様の表記方法である。

表１のＡの欄中の「２－Ｐｙ」は、

[0108] [化12]

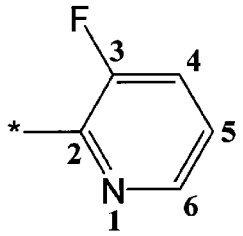


[0109] の構造を示し、数字はＸとの結合手の位置を示す。「３－Ｐｙ」および「４

－Ｐｙ」も同様の表記方法である。

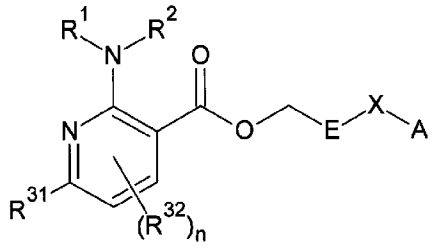
表１のＡの欄中の「２－（３－Ｆ－Ｐｙ）」は、

[0110] [化13]



[0111] の構造を示し、最初の数字はＸとの結合手の位置を示し、括弧内の数字は置換基の位置を示し、ＦはＰｙの置換基の種類を表す。「２－（４－Ｆ－Ｐｙ）」、「２－（５－Ｆ－Ｐｙ）」および「２－（６－Ｆ－Ｐｙ）」も同様の表記方法である。

[0112] [化14]

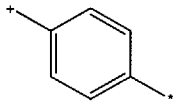
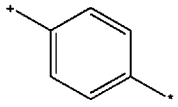
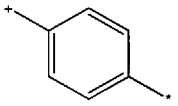
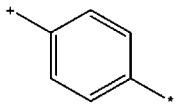
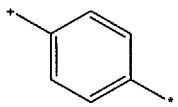
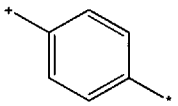
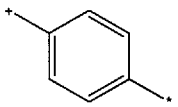
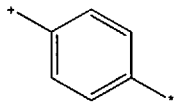
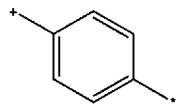
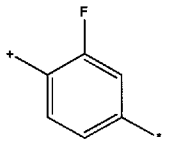
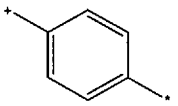
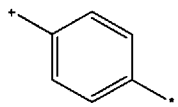


（１）

[0113]

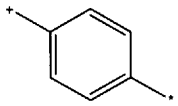
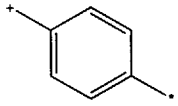
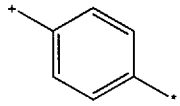
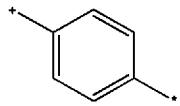
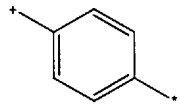
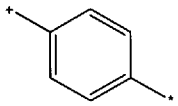
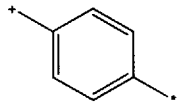
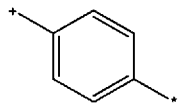
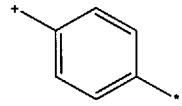
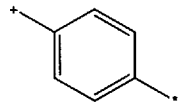
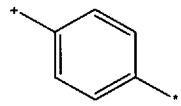
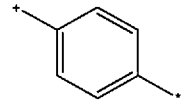
[表1]

表1

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
1	H	H	–	–		O	Ph
2	H	H	Me	–		O	Ph
3	H	H	CH_2OMe	–		O	Ph
4	H	H	NH_2	–		O	Ph
5	H	H	Cl	–		O	Ph
6	H	H	F	–		O	Ph
7	H	H	–	5-F		O	Ph
8	H	H	Me	5-F		O	Ph
9	H	H	Me	5-Cl		O	Ph
10	H	H	–	–		O	Ph
11	H	H	Me	5-F		O	Ph
12	CHO	H	–	–		O	Ph

[0114] [表2]

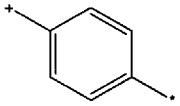
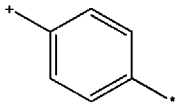
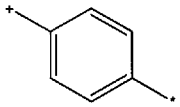
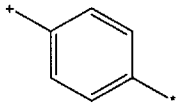
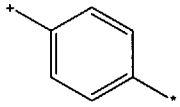
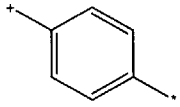
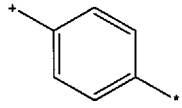
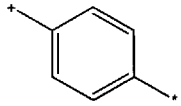
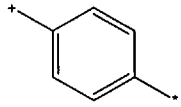
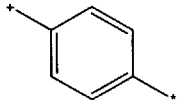
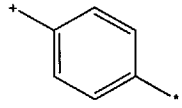
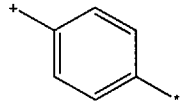
表1（続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
13	CHO	H	Me	-		O	Ph
14	CHO	Me	-	-		O	Ph
15	COMe	H	-	-		O	Ph
16	COMe	H	-	5-F		O	Ph
17	COMe	H	Me	-		O	Ph
18	COMe	H	CH_2OMe	-		O	Ph
19	COMe	Me	-	-		O	Ph
20	COMe	Me	-	5-F		O	Ph
21	COMe	Me	Me	-		O	Ph
22	COMe	Me	Me	5-F		O	Ph
23	COOMe	H	-	-		O	Ph
24	$COCH_2OMe$	H	-	-		O	Ph

[0115]

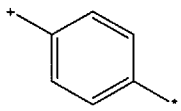
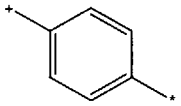
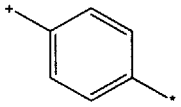
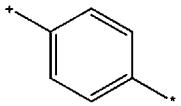
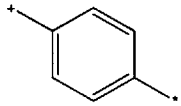
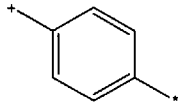
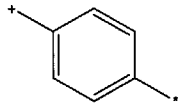
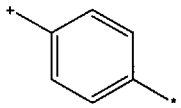
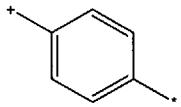
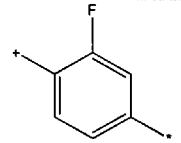
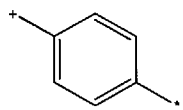
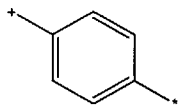
[表3]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
25	$COCH_2OMe$	H	Me	-		O	Ph
26	$COCH_2OMe$	H	Me	5-F		O	Ph
27	$COCH_2OMe$	H	Me	5-Cl		O	Ph
28	$COCH_2OMe$	H	Cl	-		O	Ph
29	$COCH_2OMe$	H	CH_2OMe	-		O	Ph
30	$COCH_2OMe$	H	CH_2OMe	5-F		O	Ph
31	H	H	-	-		O	2-F-Ph
32	H	H	-	-		O	3-F-Ph
33	H	H	-	-		O	4-F-Ph
34	H	H	Me	-		O	4-F-Ph
35	H	H	-	-		O	2-Py
36	H	H	-	5-F		O	2-Py

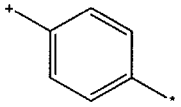
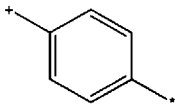
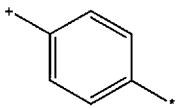
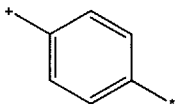
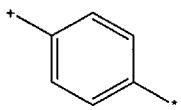
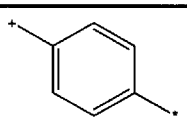
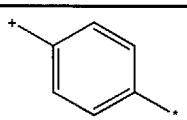
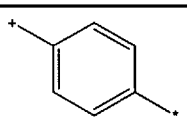
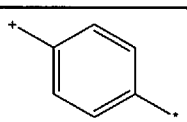
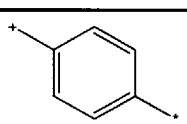
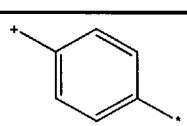
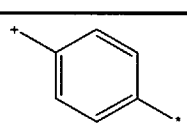
[0116] [表4]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
37	H	H	Me	–		O	2-Py
38	H	H	Me	5-F		O	2-Py
39	H	H	Me	5-Cl		O	2-Py
40	H	H	Cl	–		O	2-Py
41	H	H	Cl	5-Cl		O	2-Py
42	$COCH_2OMe$	H	–	–		O	2-Py
43	$COCH_2OMe$	H	Me	–		O	2-Py
44	$COCH_2OMe$	H	Me	5-F		O	2-Py
45	$COCH_2OMe$	H	Cl	–		O	2-Py
46	H	H	–	–		O	3-Py
47	H	H	Me	–		O	3-Py
48	H	H	–	–		O	4-Py

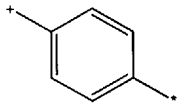
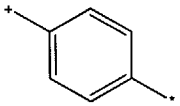
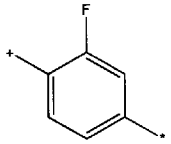
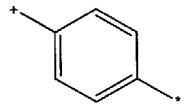
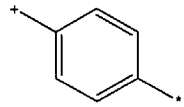
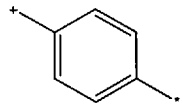
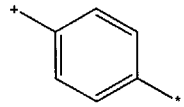
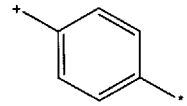
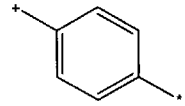
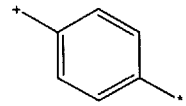
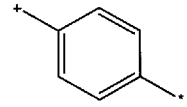
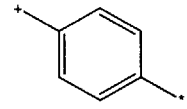
[0117] [表5]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
49	H	H	Me	–		O	4-Py
50	H	H	CH_2OMe	–		O	4-Py
51	H	H	Me	5-F		O	4-Py
52	H	H	–	–		O	2-(3-F-Py)
53	H	H	–	–		O	2-(4-F-Py)
54	H	H	–	–		O	2-(5-F-Py)
55	H	H	–	–		O	2-(6-F-Py)
56	H	H	–	–		CH_2O	Ph
57	H	H	Me	–		CH_2O	Ph
58	H	H	CH_2OMe	–		CH_2O	Ph
59	H	H	–	–		CH_2O	2-F-Ph
60	H	H	–	–		CH_2O	3-F-Ph

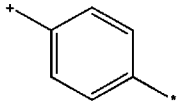
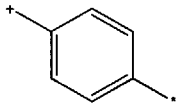
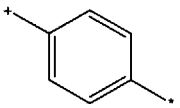
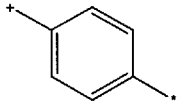
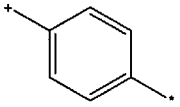
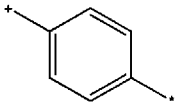
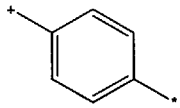
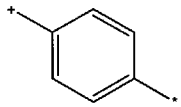
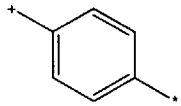
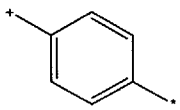
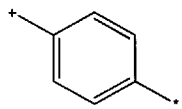
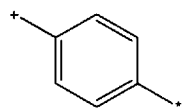
[0118] [表6]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
61	H	H	–	–		CH_2O	4-F-Ph
62	H	H	Me	–		CH_2O	4-F-Ph
63	H	H	–	–		CH_2O	2-Py
64	H	H	–	–		CH_2O	4-Py
65	H	H	Me	–		CH_2O	4-Py
66	H	H	–	5-F		CH_2O	4-Py
67	H	H	–	–		CH_2O	2-(3-F-Py)
68	H	H	–	–		CH_2O	2-(4-F-Py)
69	H	H	–	–		CH_2O	2-(5-F-Py)
70	H	H	–	–		CH_2O	2-(6-F-Py)
71	H	H	Me	–		CH_2O	2-(6-F-Py)
72	H	H	CH_2OMe	5-F		CH_2O	2-(6-F-Py)

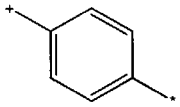
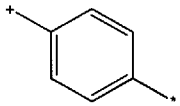
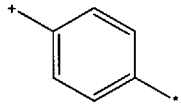
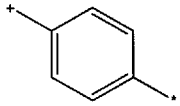
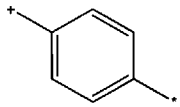
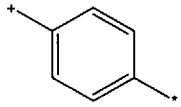
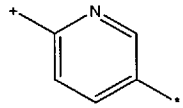
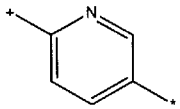
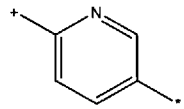
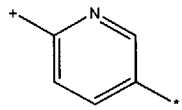
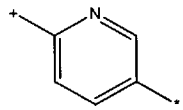
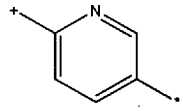
[0119] [表7]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
73	H	H	Me	5-F		CH_2O	2-(6-F-Py)
74	H	H	CH_2OMe	-		CH_2O	2-(6-F-Py)
75	H	H	-	-		OCH_2	Ph
76	H	H	Me	-		OCH_2	Ph
77	H	H	CH_2OMe	-		OCH_2	Ph
78	H	H	-	-		OCH_2	2-F-Ph
79	H	H	-	-		OCH_2	3-F-Ph
80	H	H	-	-		OCH_2	4-F-Ph
81	H	H	Me	-		OCH_2	4-F-Ph
82	H	H	-	-		OCH_2	2-Py
83	H	H	-	-		OCH_2	3-Py
84	H	H	-	-		OCH_2	4-Py

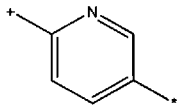
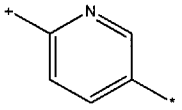
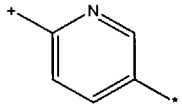
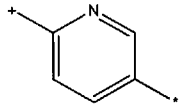
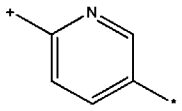
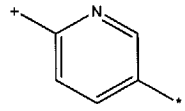
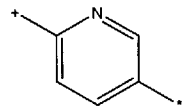
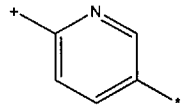
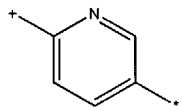
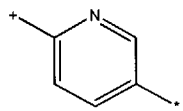
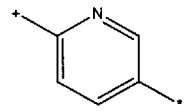
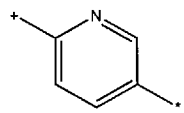
[0120] [表8]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
85	H	H	Me	–		OCH_2	4-Py
86	H	H	CH_2OMe	–		OCH_2	4-Py
87	H	H	–	–		OCH_2	2-(3-F-Py)
88	H	H	–	–		OCH_2	2-(4-F-Py)
89	H	H	–	–		OCH_2	2-(5-F-Py)
90	H	H	–	–		OCH_2	2-(6-F-Py)
91	H	H	–	–		O	Ph
92	H	H	Me	–		O	Ph
93	H	H	Me	5-F		O	Ph
94	H	H	CH_2OMe	–		O	Ph
95	H	H	Cl	–		O	Ph
96	H	H	–	–		O	2-Py

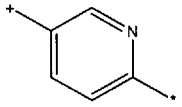
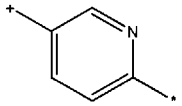
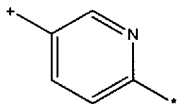
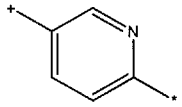
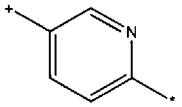
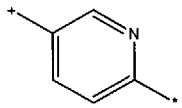
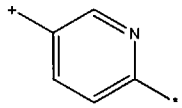
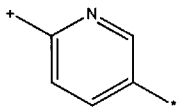
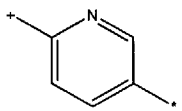
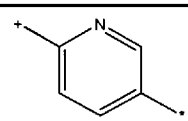
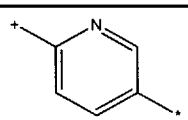
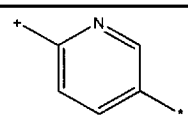
[0121] [表9]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
97	H	H	Me	-		O	2-Py
98	H	H	-	5-F		O	2-Py
99	H	H	Me	5-F		O	2-Py
100	H	H	CH_2OMe	-		O	2-Py
101	H	H	-	-		O	2-(6-F-Py)
102	H	H	Me	-		O	2-(6-F-Py)
103	H	H	-	-		OCH_2	Ph
104	H	H	-	-		OCH_2	2-Py
105	H	H	Me	-		OCH_2	2-(6-F-Py)
106	H	H	Me	5-F		OCH_2	2-(6-F-Py)
107	H	H	CH_2OMe	-		OCH_2	2-(6-F-Py)
108	H	H	Cl	-		OCH_2	2-(6-F-Py)

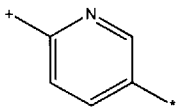
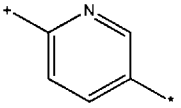
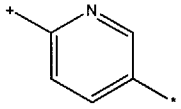
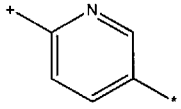
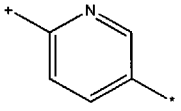
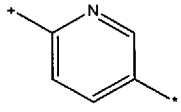
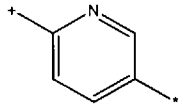
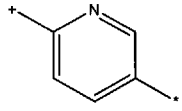
[0122] [表10]

表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
109	H	H	–	–		O	Ph
110	H	H	Me	–		O	Ph
111	H	H	CH_2OMe	–		O	Ph
112	H	H	–	–		O	2-Py
113	H	H	Me	–		O	2-Py
114	H	H	–	–		O	2-(6-F-Py)
115	H	H	Me	–		O	2-(6-F-Py)
116	H	H	–	–		CH_2O	Ph
117	H	H	Me	–		CH_2O	Ph
118	$COCH_2OMe$	H	Me	–		CH_2O	Ph
119	H	H	–	–		CH_2O	2-Py
120	H	H	Me	–		CH_2O	2-(6-F-Py)

[0123] [表11]

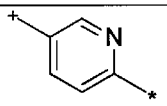
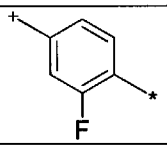
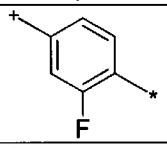
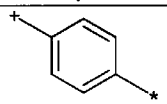
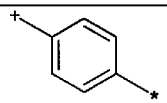
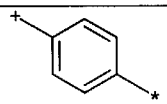
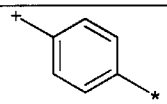
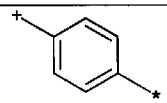
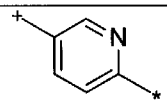
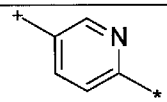
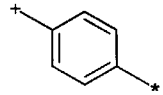
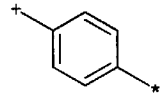
表1 （続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
121	H	H	-	-		OCH_2	Ph
122	H	H	Me	-		OCH_2	Ph
123	H	H	Me	5-F		OCH_2	Ph
124	H	H	-	-		OCH_2	2-Py
125	H	H	Me	-		OCH_2	2-Py
126	H	H	Me	5-F		OCH_2	2-Py
127	$COCH_2OMe$	H	Me	-		OCH_2	2-Py
128	H	H	Me	-		OCH_2	2-(6-F-Py)

[0124]

[表12]

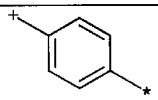
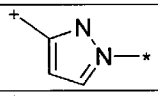
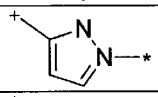
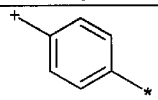
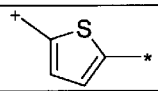
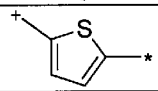
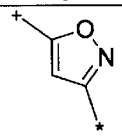
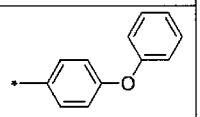
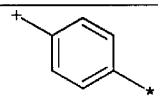
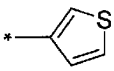
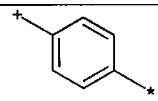
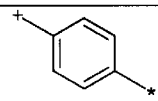
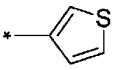
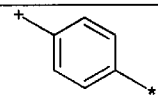
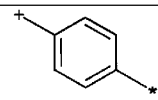
表１（続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
129	H	H	-	-		OCH_2	Ph
130	H	H	Me	-		O	Ph
131	$COCH_2OMe$	H	Me	-		O	Ph
132	H	H	Me	-		O	3-F-Ph
133	$COCH_2OMe$	H	Me	-		O	3-F-Ph
134	$COCH_2OMe$	H	Me	-		O	2-Py
135	H	H	Me	-		O	2-F-Ph
136	$COCH_2OMe$	H	Me	-		O	2-F-Ph
137	H	H	Me	-		O	Ph
138	$COCH_2OMe$	H	Me	-		O	Ph
139	OMe	H	-	-		O	Ph
140	$COCH_2OMe$	OMe	-	-		O	Ph

[0125]

[表13]

表１（続き）

化合物番号	R^1	R^2	R^{31}	R^{32}	E	X	A
141	$COCH_2OMe$	H	Me	-		OCH_2	Ph
142	H	H	Me	-		CH_2	Ph
143	$COCH_2OMe$	H	Me	-		CH_2	Ph
144	$COCH_2OMe$	H	-	5-F		O	Ph
145	H	H	Me	-		O	4-F-Ph
146	$COCH_2OMe$	H	Me	-		O	4-F-Ph
147	H	H	-	-		CH_2	
148	H	H	Me	-		OCH_2	
149	H	H	CF_3	-		O	Ph
150	$COCH_2OMe$	H	Me	-		OCH_2	
151	$COCH_2OMe$	H	-	-		OCH_2	2-Py
152	H	H	-	-		OCH_2	4-Cl-Ph

[0126] 表１に示した化合物の一部につき、融点または屈折率を測定した。その結果を以下に示す。

化合物番号 1 融点（℃） 130-132

化合物番号 2 融点（℃） 124-125

化合物番号　3　融点（℃）　124-125

化合物番号　5　融点（℃）　155-157

化合物番号　7　融点（℃）　119-121

化合物番号　24　屈折率（nD）　1.5920（20.8℃）

化合物番号　25　屈折率（nD）　1.5935（20.7℃）

化合物番号　29　屈折率（nD）　1.5867（20.7℃）

化合物番号　34　融点（℃）　112-113

化合物番号　35　融点（℃）　116-117

化合物番号　37　融点（℃）　129-130

化合物番号　42　融点（℃）　101-103

化合物番号　70　融点（℃）　105-108

化合物番号　75　融点（℃）　114-115

化合物番号　76　融点（℃）　143-144

化合物番号　82　融点（℃）　117-120

化合物番号　129　融点（℃）　119-120

化合物番号　130　融点（℃）　135-137

化合物番号　131　融点（℃）　77-78

化合物番号　132　融点（℃）　112-113

化合物番号　133　屈折率（nD）　1.5822（21.9℃）

化合物番号　134　屈折率（nD）　1.5832（22.2℃）

化合物番号　135　融点（℃）　112-113

化合物番号　136　屈折率（nD）　1.2782（20.7℃）

化合物番号　137　融点（℃）　121-123

化合物番号　138　屈折率（nD）　1.5873（19.4℃）

化合物番号　139　融点（℃）　48-50

化合物番号　140　屈折率（nD）　1.5687（20.4℃）

化合物番号　141　屈折率（nD）　1.5926（20.0℃）

化合物番号　142　融点（℃）　136-138

化合物番号　143　屈折率（nD）　1.5767（19.2℃）

化合物番号　144　融点（℃）　99-100

化合物番号　145　融点（℃）　104-105

化合物番号　146　屈折率（nD）　1.5819（20.7℃）

化合物番号　147　融点（℃）　116-118

化合物番号　148　融点（℃）　155-156

化合物番号　149　融点（℃）　135-136

化合物番号　152　融点（℃）　141-144

[0127] また、表１に示した化合物のうち、化合物番号２８、１５０及び１５１の^{1}Ｈ－ＮＭＲの測定結果を下記に示す。

化合物番号２８：　3.55（s, 3H), 4.15（s, 2H), 5.34（s, 2H), 7.01-7.04（m, 4H), 7.09（d, 1H), 7.14（m, 1H), 7.34-7.40（m, 4H), 8.26（d, 1H), 11.40（bs, 1H)

化合物番号１５０：　2.60（s, 3H), 3.55（s, 3H), 4.16（s, 2H), 5.09（s, 2H), 5.30（s, 2H), 6.92（d, 1H), 6.97-7.00（m, 2H), 7.15（dd, 1H), 7.33-7.38（m, 4H), 8.19（d, 1H), 11.36（bs, 1H)

化合物番号１５１：　3.56（s, 3H), 4.13（s, 2H), 5.23（s, 2H), 5.32（s, 2H), 7.00-7.10（m, 3H), 7.20-7.30（m, 1H), 7.38（d, 2H), 7.52（d, 1H), 7.70-7.75（m, 1H), 8.33（dd, 1H), 8.60-8.67（m, 2H), 11.6（brs, 1H)

[0128] 次に、本発明に係る農園芸用殺菌剤の製剤実施例を若干示すが、添加物および添加割合は、これら製剤実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。また、製剤実施例中の部は質量部を示す。

[0129] 製剤実施例１　（水和剤）

本発明化合物	４０部
クレー	４８部
ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩	４部
リグニンスルホン酸ナトリウム塩	８部

以上を均一に混合して微細に粉砕し、有効成分４０％の水和剤を得る。

[0130] 製剤実施例２　（乳剤）

本発明化合物	１０部
ソルベッソ２００	５３部
シクロヘキサノン	２６部
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム塩	１部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	１０部

以上を混合溶解し、有効成分１０％の乳剤を得る。

[0131] 製剤実施例３　（粉剤）

本発明化合物	１０部
クレー	９０部

以上を均一に混合して微細に粉砕し、有効成分１０％の粉剤を得る。

[0132] 製剤実施例４　（粒剤）

本発明化合物	５部
クレー	７３部
ベントナイト	２０部
ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩	１部
リン酸カリウム	１部

以上をよく粉砕混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分５％の粒剤を得る。

[0133] 製剤実施例５　（懸濁剤）

本発明化合物	１０部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	４部
ポリカルボン酸ナトリウム塩	２部
グリセリン	１０部
キサンタンガム	０．２部
水	７３．８部

以上を混合し、粒度が３ミクロン以下になるまで湿式粉砕し、有効成分１

０％の懸濁剤を得る。

[0134] 製剤実施例６　（顆粒水和剤）

本発明化合物　４

０部

クレー　３

６部

塩化カリウム　１

０部

アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩

１部

リグニンスルホン酸ナトリウム塩

８部

アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩のホルムアルデヒド縮合物

５部

以上を均一に混合して微細に粉砕後，適量の水を加えてから練り込んで粘土状にする。粘土状物を造粒した後乾燥し、有効成分４０％の顆粒水和剤を得る。

[0135] （生物試験例１）キュウリ灰色かび病防除試験

素焼きポットで栽培したキュウリ幼苗（品種「ときわ地這」、子葉期）に、製剤実施例２の処方で得た乳剤を有効成分１２５ｐｐｍの濃度で散布し、室温で自然乾燥させた。その後、キュウリ灰色かび病菌（Botrytis cinerea）の分生胞子懸濁液を滴下接種し、２０℃、高湿度の暗い部屋に４日間保持した。葉上の病斑出現状態を無処理と比較調査し、防除効果を調べた。

番号１、２、３、７、２４、２５、２８～２９、３４、３５、３７、４２、７５～７６、１２９～１３８、１４１、１４４、１４８及び１５０の化合物についてキュウリ灰色かび病防除試験を行った。その結果、いずれの化合物も７５％以上の防除価を示した。

[0136] （生物試験例２）コムギうどんこ病防除試験

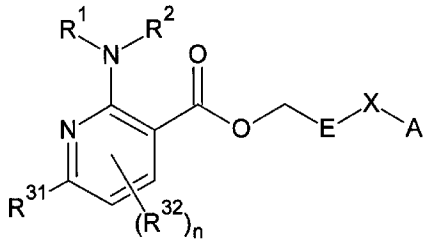
素焼きポットで栽培したコムギ幼苗（品種「チホク」、１．０～１．２葉期）に、製剤実施例１の処方で得た水和剤を有効成分１２５ｐｐｍの濃度で散布し、室温で自然乾燥させた。その後、コムギうどんこ病菌（Erysiphe graminis f.sp.tritici）の分生胞子を振り払い接種し、２２～２５℃の温室で７日間保持した。葉上の病斑出現状態を無処理と比較調査し、防除効果を調べた。

番号１、２、３、７、２４、２５、２８～２９、３５、３７、４２、７０、７５～７６、１３０、１３２～１３８及び１４０～１４５の化合物についてコムギうどんこ病防除試験を行った。その結果、いずれの化合物も７５％以上の優れた防除価を示した。

請求の範囲

[請求項1] 式（１）で表されるアミノピリジン化合物またはその塩。

[化1]



（１）

[式（１）中、

R^1は、水素原子、ホルミル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルＣ１～６アルキルカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ２～８アルキニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルチオカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するジＣ１～８アルキルスルファモイル基

、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキルスルホニル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールスルホニル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルスルホニル基を示す。

R^2は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、または無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキルカルボニル基を示す。

R^{31}は、水素原子、ハロゲノ基、シアノ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

R^{32}は、ハロゲノ基、シアノ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するＣ３～８シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリルオキシ基を示す。ｎはR^{32}の個数を示し、０～２のいずれかの整数である。ｎが２のとき、R^{32}は互いに同じでも異なってもよい。

Ｅは、無置換の若しくは置換基を有するベンゼン環からなる２価の基、または無置換の若しくは置換基を有する５～６員のヘテロ環からなる２価の基を示す。

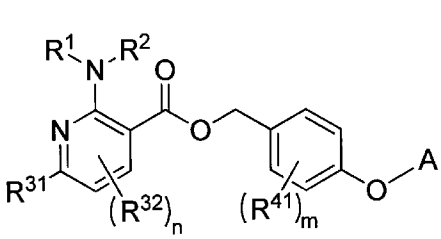
Ｘは、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＨ－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$Ｏ－、－ＯＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$Ｓ－、－ＳＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＮＨ－、または－ＮＨＣＨ$_2$－を示す。

Ａは、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基、または無置換の若しくは置換基を有する５～１０員ヘテロシクリル基を示す。］

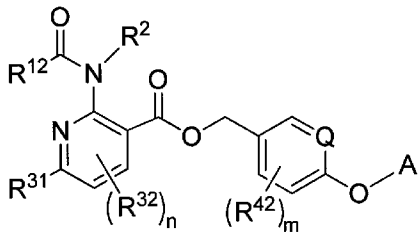
[請求項2] Ｒ^{1}及びＲ^{2}が共に水素原子でないか、又は、Ｒ^{1}及びＲ^{2}が共に水素原子の場合はＸが－Ｏ－ではない、請求項１に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

[請求項3] 下記式（１－１）～（１－８）のいずれかで表される、請求項１または２に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

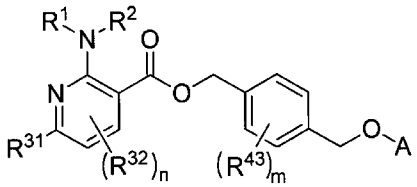
[化2]



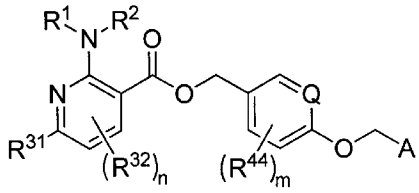
（１－１）



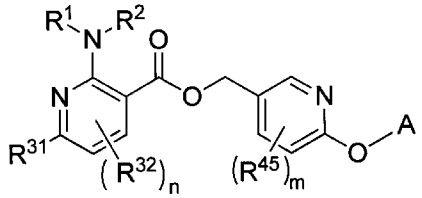
（１－２）



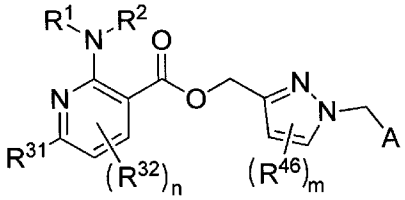
（１－３）



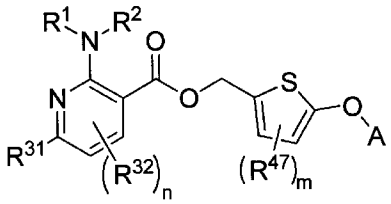
（１－４）



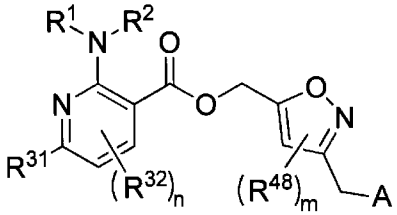
（１－５）



（１－６）



（１－７）



（１－８）

[式（１－１）～（１－８）中、

R^1、R^2、R^{31}、R^{32}、ｎ、Ａは前記同様である。

R^{12}は、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基を示す。

R^{41}～R^{48}は、それぞれ独立にハロゲノ基を示す。

ｍはR^{41}～R^{48}の個数を示し、０～２のいずれかの整数である。ｍが２のとき、R^{41}～R^{48}は互いに同じであってもよく異なっていてもよい。

ＱはＣＨ、または窒素原子を示す。]

[請求項4] R^{31}が、無置換の若しくは置換基を有するＣ１～８アルキル基であ

る、請求項１～３のいずれかひとつに記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

[請求項5] Ｅが、ベンゼン環、ピリジン環、フラン環、ピロリン環、テトラゾリン環、チアゾリン環、およびピラゾリン環からなる群より選ばれる環からなる２価の基である、請求項１または２に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

[請求項6] Ｅがベンゼン環からなる２価の基であり、Ｘが－Ｏ－である、請求項１または２に記載のアミノピリジン化合物またはその塩。

[請求項7] 請求項１～６のいずれかひとつに記載のアミノピリジン化合物またはその塩から選ばれる少なくとも１つを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/078204

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
C07D213/80(2006.01)i, *A01N43/40*(2006.01)i, *A01P3/00*(2006.01)i

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)
C07D213/80, A01N43/40, A01P3/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched
Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2015
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2015 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2015

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAplus/REGISTRY(STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO 2014/006945 A1 (Agro-Kanesho Co., Ltd.), 09 January 2014 (09.01.2014), entire text; particularly, claims; table 1, compound no.1 to 37, 40 to 49 (Family: none)	1,3-7
A	JP 2010-83861 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 15 April 2010 (15.04.2010), entire text & US 2011/0009454 A1 & EP 2248423 A1 & WO 2009/107764 A1 & FR 2928070 A & AU 2009218058 A & CA 2716647 A & MX 2010009284 A & KR 10-2010-0125265 A & CN 101951771 A	1-7

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ 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
08 January 2015 (08.01.15)	20 January 2015 (20.01.15)
Name and mailing address of the ISA/ Japan Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/078204

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 9-510471 A (Agrevo UK Ltd.), 21 October 1997 (21.10.1997), entire text & US 5756524 A & EP 750611 A & WO 1995/025723 A1 & AU 1898195 A & BR 9507105 A & PL 316289 A & MX 9603735 A & HU 74778 A & IL 113027 A & ZA 9502205 A & CZ 9602690 A & CN 1143954 A & AU 688473 B & TW 318829 B	1-7
A	JP 6-279417 A (Shionogi & Co., Ltd.), 04 October 1994 (04.10.1994), entire text & US 5439911 A & US 5519139 A & EP 606011 A1	1-7

国際調査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ２０１４／０７８２０４

Ａ．　発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07D213/80(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01P3/00(2006.01)i

Ｂ．　調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07D213/80, A01N43/40, A01P3/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	１９２２－１９９６年
日本国公開実用新案公報	１９７１－２０１５年
日本国実用新案登録公報	１９９６－２０１５年
日本国登録実用新案公報	１９９４－２０１５年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAplus/REGISTRY(STN)

Ｃ．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
Ｐ，Ｘ	WO 2014/006945 A1（アグロカネショウ株式会社）2014.01.09，全文、とくに特許請求の範囲、表１化合物 No. １～37、40～49　参照（ファミリーなし）	1,3-7
Ａ	JP 2010-83861 A（住友化学株式会社）2010.04.15，全文 & US 2011/0009454 A1 & EP 2248423 A1 & WO 2009/107764 A1 & FR 2928070 A & AU 2009218058 A & CA 2716647 A & MX 2010009284 A & KR 10-2010-0125265 A & CN 101951771 A	1-7

☑　Ｃ欄の続きにも文献が列挙されている。

☐　パテントファミリーに関する別紙を参照。

＊　引用文献のカテゴリー
「Ａ」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「Ｅ」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「Ｌ」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「Ｏ」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「Ｐ」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
「Ｔ」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「Ｘ」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Ｙ」特に関連のある文献であって、当該文献と他の１以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「＆」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
０８．０１．２０１５	２０．０１．２０１５

国際調査機関の名称及びあて先
日本国特許庁（ＩＳＡ／ＪＰ）
郵便番号１００－８９１５
東京都千代田区霞が関三丁目４番３号

特許庁審査官（権限のある職員）　４Ｈ　９７０９
東　裕子
電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４４３

C（続き）．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
A	JP 9-510471 A（アグレボ・ユー・ケイ・リミテツド）1997.10.21, 全文 & US 5756524 A & EP 750611 A & WO 1995/025723 A1 & AU 1898195 A & BR 9507105 A & PL 316289 A & MX 9603735 A & HU 74778 A & IL 113027 A & ZA 9502205 A & CZ 9602690 A & CN 1143954 A & AU 688473 B & TW 318829 B	1-7
A	JP 6-279417 A（塩野義製薬株式会社）1994.10.04, 全文 & US 5439911 A & US 5519139 A & EP 606011 A1	1-7