(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
2024年7月4日(04.07.2024)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2024/143336 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 213/65 (2006.01)	*C07D 237/24* (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)	*C07D 237/26* (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)	*C07D 237/28* (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)	*C07D 239/34* (2006.01)
A01N 47/24 (2006.01)	*C07D 249/04* (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)	*C07D 253/07* (2006.01)
C07D 213/81 (2006.01)	*C07D 401/12* (2006.01)
C07D 213/84 (2006.01)	*C07D 403/12* (2006.01)
C07D 213/86 (2006.01)	*C07D 405/12* (2006.01)
C07D 231/18 (2006.01)	*C07D 409/12* (2006.01)
C07D 231/20 (2006.01)	*C07D 487/04* (2006.01)

(21) 国際出願番号： PCT/JP2023/046585

(22) 国際出願日： 2023年12月26日(26.12.2023)

(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：

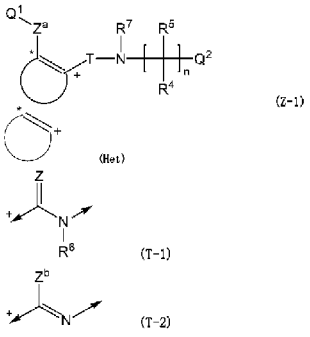
特願 2022-212728	2022年12月28日(28.12.2022)	JP
特願 2023-069619	2023年4月20日(20.04.2023)	JP
特願 2023-131664	2023年8月10日(10.08.2023)	JP

(71) 出願人: 日本曹達株式会社(**NIPPON SODA CO., LTD.**) [JP/JP]; 〒1007010 東京都千代田区丸の内二丁目７番２号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 鈴木 寛人(**SUZUKI Hiroto**); 〒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). 中村 優花(**NAKAMURA Yuka**); 〒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). 錦 はるか(**NISHIKI Haruka**); 〒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). 小林 寛幸(**KOBAYASHI Hiroyuki**); 〒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). 斎賀 睦幸(**SAIGA Tomoyuki**); 〒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). キム ジェヒョン(**KIM JaeHyun**); 〒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). 柴山 耕太郎(**SHIBAYAMA Kotaro**); 〒2500280 神奈

(54) **Title:** HYDRAZIDE COMPOUND AND AGRICULTURAL/HORTICULTURAL BACTERICIDAL AGENT

(54) 発明の名称： ヒドラジド化合物および農園芸用殺菌剤



(57) **Abstract:** In the present invention, a compound represent by formula Z-I has excellent bactericidal activity and has excellent stability. (In the formula: Q^1 represents a phenyl group, or the like; Q^2 represents a phenyl group, or the like; partial structure Het represents a six-membered heteroaryl ring, or the like; Z^a represents an oxygen atom, or the like; T represents a partial structure (T-1) or (T-2); Z represents an oxygen atom, or the like; R^6 represent a hydrogen atom, a C1-6 alkyl group, or the like; Z^b represents a C1-6 alkoxy group, or the like; R^4 represents a hydrogen atom, or the like; R^5 represents a hydrogen atom, or the like; n represents any integer from 1 to 3; and R^7 represents a hydrogen atom, a C1-6 alkyl group, or the like.)

(57) 要約： 式(Z-I)(式中、Q^1はフェニル基等を示し、Q^2はフェニル基等を示し、部分構造Hetは6員ヘテロアリール環等を示し、Z^aは酸素原子等を示し、Tは部分構造(T-1)又は(T-2)を示し、Zは酸素原子等を示し、R^6は水素原子、C1～6アルキル基等を示し、Z^bはC1～6アルコキシ基等を示し、R^4は水素原子等を示し、R^5は水素原子等を示し、nは1～3のいずれかの整数を示し、R^7は水素原子、C1～6アルキル基等を示す)で示される化合物は、優れた殺菌活性を有し、安全性に優れる。

［続葉有］

WO 2024/143336 A1

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：松沼 泰史，外(MATSUNUMA Yasushi 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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, 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, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, 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, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, 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, ME, 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).

添付公開書類：

一 国際調査報告（条約第21条(3)）

明　細　書

発明の名称 ： ヒドラジド化合物および農園芸用殺菌剤

技術分野

[0001] 本発明は、ヒドラジド化合物および農園芸用殺菌剤に関する。より詳細に、本発明は、農園芸植物に影響を及ぼす病原菌に対して優れた殺菌活性を有し、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるヒドラジド化合物およびこれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

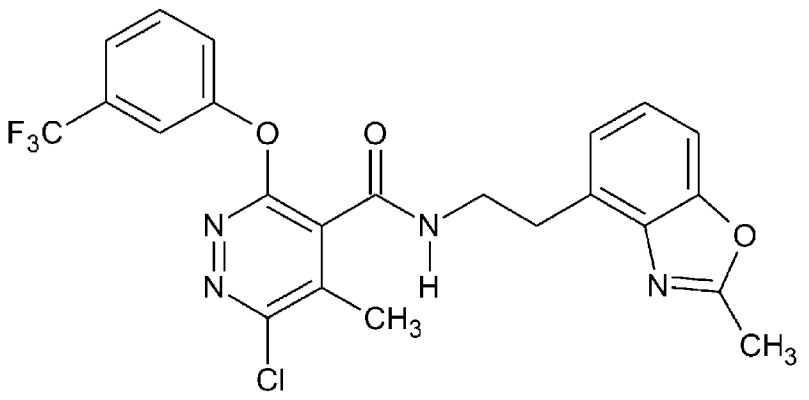
本願は、２０２２年１２月２８日に日本に出願された特願２０２２－２１２７２８号、２０２３年４月２０日に日本に出願された特願２０２３－０６９６１９号、および、２０２３年８月１０日に日本に出願された特願２０２３－１３１６６４号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

背景技術

[0002] 農園芸植物に影響を及ぼす病原菌に対して殺菌活性を有する化合物が種々提案されている。そのような化合物を農園芸用殺菌剤として実用するためには、効力が十分に高いだけでなく、薬剤抵抗性が生じ難いこと、植物に対する薬害や土壌汚染を生じさせないこと、家畜や魚類などに対する毒性が低いことなどが要求される。

[0003] ところで、特許文献１には、式（Ａ）などで表される化合物が開示されている。

[0004] [化1]



(A)

先行技術文献

特許文献

[0005] 特許文献1：特表２０２２－５０８２７７号公報

発明の概要

発明が解決しようとする課題

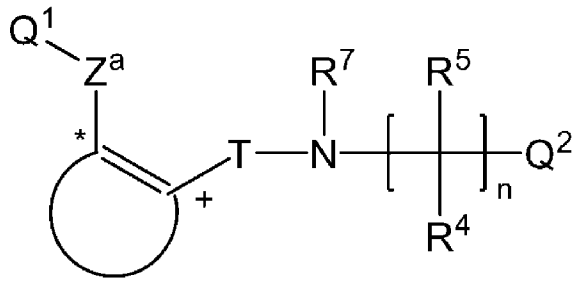
[0006] 本発明の課題は、農園芸植物に影響を及ぼす病原菌に対して優れた殺菌活性を有し、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるヒドラジド化合物およびこれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤を提供することである。

課題を解決するための手段

[0007] 上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。

（１） 式（Ｚ－Ｉ）で表される化合物またはその塩。

[0008] [化2]



（Ｚ－Ｉ）

[0009] 〔式（Ｚ－Ｉ）中、

Q^1は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

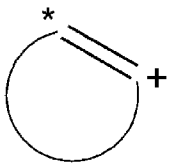
Q^2は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2中の環を形成する炭素原子は、R^7を有する窒素原子とR^7に代わり結合

してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[0010] [化3]



(Het)

[0011] は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

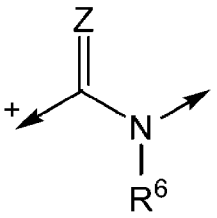
部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

Z^aは、酸素原子、硫黄原子、または式：NR^aで表される基を示し、

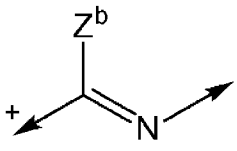
R^aは、水素原子、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基を示し、

Ｔは、部分構造（Ｔ－１）または部分構造（Ｔ－２）を示し、

[0012] [化4]



（Ｔ－１）



（Ｔ－２）

[0013] 部分構造（Ｔ－１）中、Ｚは、酸素原子、硫黄原子、または式：NR^bで表される基を示し、＋を付した矢印は部分構造中の＋を付した炭素原子と結合し、他方の矢印はR^7を有する窒素原子と結合し、

R^bは、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、水酸基、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基を示し、

R^6は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基を示し、

部分構造（Ｔ－２）中、Z^bは、Ｃ１～６アルコキシ基、またはＣ１～６アルキルチオ基を示し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

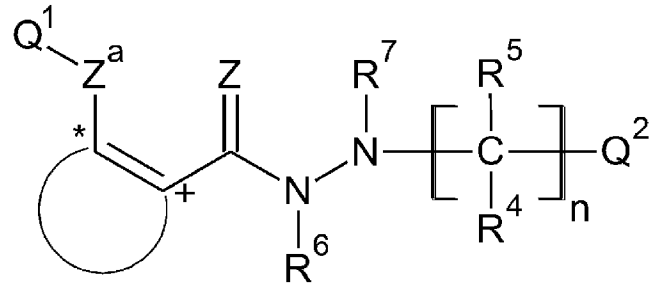
R^7は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、R^c－SO_2－で表される基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６

員ヘテロシクリル基、またはシアノ基を示し、

R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。〕

（２）　前記式（Ｚ－Ｉ）が式（Ｉ）で表される前記（１）に記載の化合物またはその塩。

[0014] [化5]



(I)

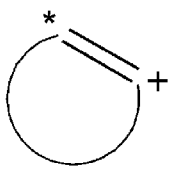
[0015] 〔式（Ｉ）中、

Q^1、Q^2、Z^a、R^4、R^5、R^7およびｎは、前記式（Ｚ－Ｉ）におけるQ^1、Q^2、Z^a、R^4、R^5、R^7およびｎと同じ意味を示し、

ＺおよびＲ^{6}は、前記部分構造（Ｔ－１）におけるＺおよびＲ^{6}と同じ意味を示す。〕

（３）　前記部分構造Ｈｅｔ：

[0016] [化6]

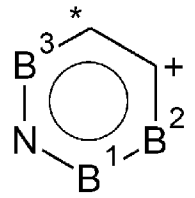


(IIet)

[0017] が、式（ＩＩ）で表される６員ヘテロアリール環である、前記（１）または

（２））に記載の化合物またはその塩。

[0018] [化7]



(II)

[0019] 〔式（ＩＩ）中、

B^1は、窒素原子、または式：CR^1で表される基を示し、

R^1は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、

B^2は、窒素原子、または式：CR^2で表される基を示し、

R^2は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６ア

ルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、

R^1とR^2は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

B^3は、窒素原子、または式：CR^3で表される基を示し、

R^3は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋

を付した炭素原子に対応する。〕

（４）　前記Ｚ^{a}が、酸素原子であり、

前記Ｚが、酸素原子であり、

前記Ｒ^{6}が、水素原子であり、

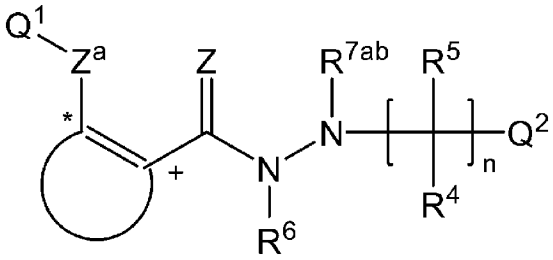
前記Ｒ^{7}が、ホルミル基、式：Ｒ^{c}－ＣＯ－で表される基、式：Ｒ^{c}－ＣＳ－で表される基、式：Ｒ^{c}－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはＲ^{c}－ＳＯ$_{2}$－で表される基である、

前記（３）に記載の化合物またはその塩。

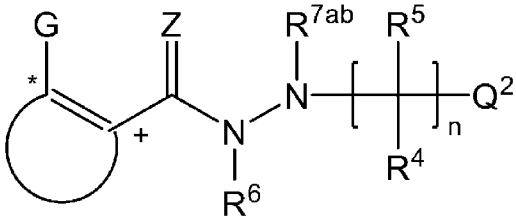
（５）前記（１）～（４）のいずれかひとつに記載の化合物およびその塩からなる群から選ばれる少なくとも１つを有効成分として含有する、農園芸用殺菌剤。

（６）　式（Ｉ－１）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－１）で表される化合物と、式（ｉｍ－２）で表される化合物とを、酸捕捉剤の存在下、反応させる工程を含む、方法。

[0020] [化8]



（Ｉ－１）



（ｉｍ－１）



（ｉｍ－２）

[0021] 〔上記の各式中、

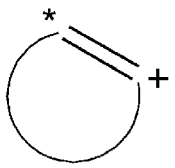
Ｑ^{1}は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2中の環を形成する炭素原子は、R^{7ab}を有する窒素原子とR^{7ab}に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[0022] [化9]



(IIet)

[0023] は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

Z^aは、酸素原子、硫黄原子、または式：NR^aで表される基を示し、

R^aは、水素原子、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基を示し、

Ｚは、酸素原子、硫黄原子、または式：NR^bで表される基を示し、

R^bは、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、水酸基、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基を示し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換の

Ｃ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^6は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基を示し、

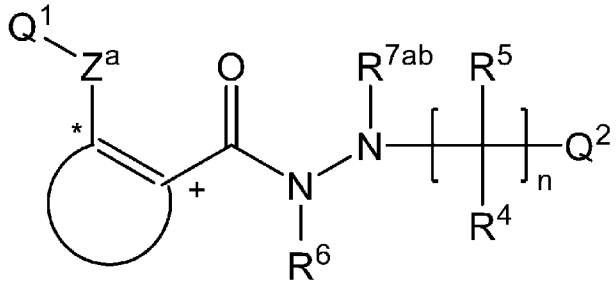
R^{7ab}は、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、R^c－SO_2－で表される基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはシアノ基を示し、

R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

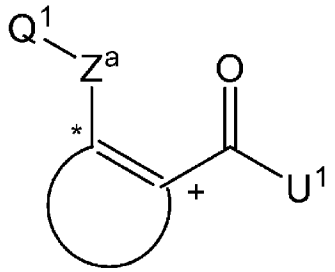
Ｇは、ハロゲノ基を示す。〕

（７）　式（Ｉ－３）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－５）で表される化合物と、式（ｉｍ－６）で表される化合物とを、式（ｉｍ－５）中のＵ[1]が水酸基である場合は縮合試薬の存在下で、Ｕ[1]がハロゲノ基である場合は酸捕捉剤の存在下で、反応させる工程を含む、方法。

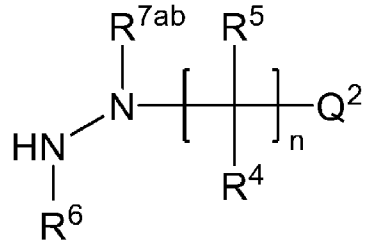
[0024] [化10]



（Ｉ－３）



（ｉｍ－５）



（ｉｍ－６）

[0025] 〔上記の各式中、

Ｑ[1]は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

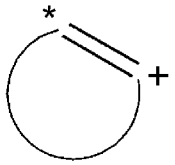
Ｑ[2]は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Ｑ[2]中の環を形成する炭素原子は、Ｒ[7ab]を有する窒素原子とＲ[7ab]に代わ

り結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[0026] [化11]



(IIet)

[0027] は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

前記部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

Z^aは、酸素原子、硫黄原子、または式：NR^aで表される基を示し、

R^aは、水素原子、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基を示し、

R^bは、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、水酸基、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基を示し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^6は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基を示し、

R^{7ab}は、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、R^c－SO_2－で表される基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはシアノ基を示し、

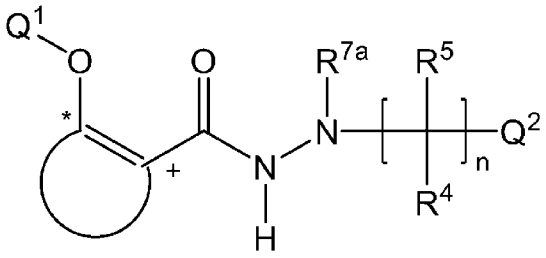
R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

U^1は、水酸基またはハロゲノ基を示す。〕

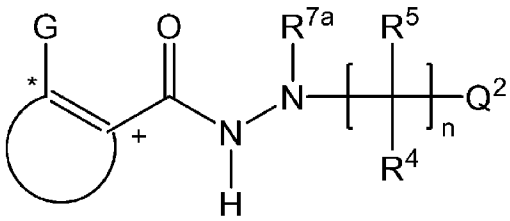
（８）　式（Ｉ－Ａ１）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－Ａ１）で表される化合物と、式（ｉｍ－Ａ２）で表される化合物とを、酸捕捉剤の存在下、反応させる工程を含む、方法。

[0028]

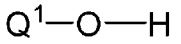
[化12]



（Ｉ－Ａ１）



（ｉｍ－Ａ１）



（ｉｍ－Ａ２）

[0029] 〔上記の各式中、

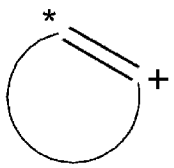
Ｑ^{1}は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Ｑ^{2}は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Ｑ^{2}中の環を形成する炭素原子は、Ｒ^{7a}を有する窒素原子とＲ^{7a}に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[0030] [化13]



(Het)

[0031] は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^{7a}は、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはR^c－SO_2－で表される基を示し、

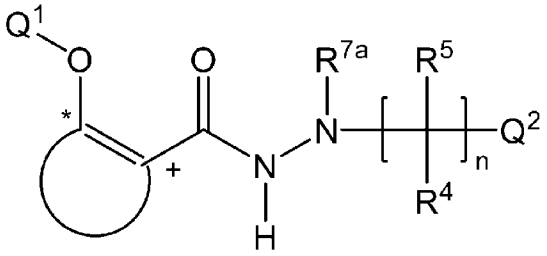
R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

Ｇは、ハロゲノ基を示す。〕

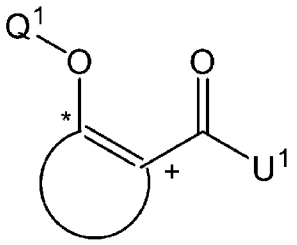
（９）　式（Ｉ－Ａ１）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－Ａ５）で表される化合物と、式（ｉｍ－６ａ）で表される化合

物とを、式（ｉｍ－Ａ５）中のＵ[1]が水酸基である場合は縮合試薬の存在下で、Ｕ[1]がハロゲノ基である場合は酸捕捉剤の存在下で、反応させる工程を含む、方法。

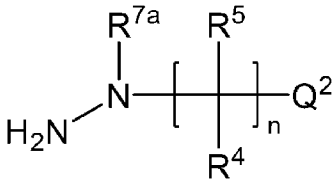
[0032] [化14]



（Ｉ－Ａ１）



（ｉｍ－Ａ５）



（ｉｍ－６ａ）

[0033] 〔上記の各式中、

Ｑ[1]は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

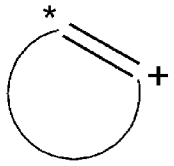
Ｑ[2]は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Ｑ[2]中の環を形成する炭素原子は、Ｒ[7a]を有する窒素原子とＲ[7a]に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[0034]

[化15]



(Hct)

[0035] は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^{7a}は、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはR^c－SO_2－で表される基を示し、

R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若

しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

Ｕ[1]は、水酸基またはハロゲノ基を示す。〕

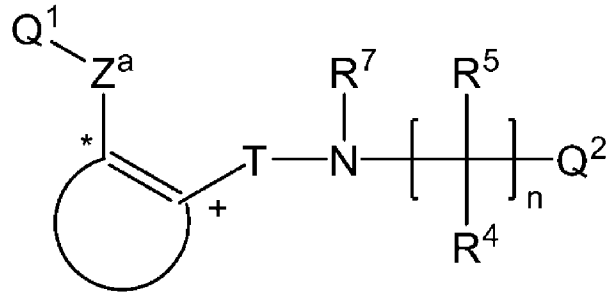
発明の効果

[0036] 本発明のヒドラジド化合物は、農園芸植物に影響を及ぼす病原菌に対して優れた殺菌活性を有し、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できる。本発明の農園芸用殺菌剤は農園芸植物の病害を効果的に防除することができる。

発明を実施するための形態

[0037] 本発明のヒドラジド化合物は、式（Ｚ－Ｉ）で表される化合物（以下、化合物（Ｚ－Ｉ）と表記することがある。）若しくは化合物（Ｚ－Ｉ）の塩である。

[0038] [化16]



（Ｚ－Ｉ）

[0039] 本発明において、「無置換（unsubstituted）」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。「置換」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（substituted）」の用語は、母核となる基のいずれかの水素原子が、母核と同一または異なる構造の基（置換基）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

換基は同一であってもよいし、異なるものであってもよい。

「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表している。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。

「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。

[0040] 以下に「置換基」となり得る基を例示する。

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；

ビニル基、１－プロペニル基、２－プロペニル基（アリル基）、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－プロペニル基などのＣ２～６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－プロピニル基などのＣ２～６アルキニル基；

[0041] 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；

フェニル基、トリル基、キシリル基、トリメチルフェニル基、ナフチル基などのアリール基；

ベンジル基、フェネチル基などのフェニルＣ１～６アルキル基；

３～６員ヘテロシクリル基；

３～６員ヘテロシクリルＣ１～６アルキル基；

[0042] 水酸基；

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；

フェノキシ基、ナフトキシ基；

ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのフェニルＣ１～６アルコキシ基；

チアゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基などの５～６員ヘテロアリールオキシ基；

チアゾリルメチルオキシ基、ピリジルメチルオキシ基などの５～６員ヘテロアリールＣ１～６アルキルオキシ基；

[0043] ホルミル基；

アセチル基、プロピオニル基などのＣ１～６アルキルカルボニル基；

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などのＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基；

ベンゾイル基；

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；

メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、ｎ－プロポキシカルボニルオキシ基、ｉ－プロポキシカルボニルオキシ基、ｎ－ブトキシカルボニルオキシ基、ｔ－ブトキシカルボニルオキシ基などのＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基；

カルボキシル基；

[0044] 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；

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；

トリフルオロメトキシ基、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；

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などのＣ１～６ハロアルキルカルボニル基；

[0045] 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アルキル置換アミノ基；

アニリノ基、ナフチルアミノ基；

ベンジルアミノ基、フェネチルアミノ基などのフェニルＣ１～６アルキルアミノ基；

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などのＣ１～６アルキルカルボニルアミノ基；

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；

アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、Ｎ－フェニル－Ｎ－メチルアミノカルボニル基などの無置換若しくは置換基を有するアミノカルボニル基；

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；

Ｎ－ヒドロキシ－イミノメチル基、（１－（Ｎ－ヒドロキシ）－イミノ）エチル基、（１－（Ｎ－ヒドロキシ）－イミノ）プロピル基、Ｎ－メトキシ－イミノメチル基、（１－（Ｎ－メトキシ）－イミノ）エチル基などの置換若しくは無置換のＮ－ヒドロキシイミノＣ１～６アルキル基；

アミノカルボニルオキシ基；

エチルアミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基などのＣ１～６アルキル置換アミノカルボニルオキシ基；

[0046] メルカプト基；

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；

トリフルオロメチルチオ基、２，２，２－トリフルオロエチルチオ基などのＣ１～６ハロアルキルチオ基；

フェニルチオ基、ナフチルチオ基；

チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などの５～６員ヘテロアリールチオ基；

[0047] 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；

トリフルオロメチルスルフィニル基、２，２，２－トリフルオロエチルスルフィニル基などのＣ１～６ハロアルキルスルフィニル基；

フェニルスルフィニル基；

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５～６員ヘテロアリールスルフィニル基；

[0048] 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；

トリフルオロメチルスルホニル基、２，２，２－トリフルオロエチルスルホニル基などのＣ１～６ハロアルキルスルホニル基；

フェニルスルホニル基；

チアゾリルスルホニル基、ピリジルスルホニル基などの５～６員ヘテロアリールスルホニル基；

メチルスルホニルオキシ基、エチルスルホニルオキシ基、ｔ－ブチルスルホニルオキシ基などのＣ１～６アルキルスルホニルオキシ基；

トリフルオロメチルスルホニルオキシ基、２，２，２－トリフルオロエチルスルホニルオキシ基などのＣ１～６ハロアルキルスルホニルオキシ基；

[0049] 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アルキル置換シリル基；

トリフェニルシリル基；

シアノ基；ニトロ基。

[0050] また、これらの「置換基」は、当該置換基中のいずれかの水素原子が、異なる構造の基で置換されていてもよい。その場合の「置換基」としては、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、ハロゲノ基、シアノ基、ニトロ基などを挙げることができる。

[0051] また、上記の「３～６員ヘテロシクリル基」とは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる１～４個のヘテロ原子を環の構成原子として含むものである。ヘテロシクリル基は、単環および多環のいずれであってもよい。多環ヘテロシクリル基は、少なくとも一つの環がヘテロ環であれば、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。「３～６員ヘテロシクリル基」としては、３～６員飽和ヘテロシクリル基、５～６員ヘテロアリール基、５～６員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。

[0052] 「３～６員飽和ヘテロシクリル基」としては、アジリジニル基、エポキシ基、アゼチジニル基、オキセタニル基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、チアゾリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキソラニル基、ジオキサニル基などを挙げることができる。

[0053] 「５員ヘテロアリール基」としては、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を挙げることができる。

「６員ヘテロアリール基」としては、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、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。

「５～６員部分不飽和ヘテロシクリル基」としては、ピロリニル基、ジヒドロフラニル基、ジヒドロチオフェニル基、イミダゾリニル基、ピラゾリニル基、オキサゾリニル基、イソオキサゾリニル基、チアゾリニル基、イソチアゾリニル基などの５員部分不飽和ヘテロシクリル基；ジヒドロピラニル基などの６員部分不飽和ヘテロシクリル基を挙げることができる。

[0054] 式（Ｚ－Ｉ）中のＱ[1]は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示す。

[0055] 式（Ｚ－Ｉ）中のＱ[2]は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示す。

[0056] 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なる群から選ばれる少なくとも１個のヘテロ原子を環の構成原子として含むものである。ヘテロシクリル基は、単環および多環のいずれであってもよい。多環ヘテロシクリル基は、少なくとも一つの環がヘテロ環であれば、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。

[0057] Ｑ[1]またはＱ[2]における「５～６員ヘテロシクリル基」としては、５～６員飽和ヘテロシクリル基、５～６員ヘテロアリール基、５～６員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。

[0058] Ｑ[1]またはＱ[2]における「５～６員飽和ヘテロシクリル基」としては、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、テトラヒドロピラニル基、チアゾリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキソラニル基、ジオキサニル基などを挙げることができ、テトラヒドロピラニル基ま

たはピペリジル基が好ましい。

[0059] Q¹またはQ²における「５員ヘテロアリール基」としては、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を挙げることができ、チエニル基、ピラゾリル基、またはチアゾリル基が好ましい。

[0060] Q¹またはQ²における「６員ヘテロアリール基」としては、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、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、ピリジル基が好ましい。

[0061] Q¹またはQ²における「５～６員部分不飽和ヘテロシクリル基」としては、ピロリニル基、ジヒドロフラニル基、ジヒドロチオフェニル基、イミダゾリニル基、ピラゾリニル基、オキサゾリニル基、イソオキサゾリニル基、チアゾリニル基、イソチアゾリニル基などの５員部分不飽和ヘテロシクリル基；ジヒドロピラニル基などの６員部分不飽和ヘテロシクリル基を挙げることができる。

[0062] Q¹またはQ²における「９員ヘテロシクリル基」としては、インドリル基、イソインドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、インダゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾイソオキサオゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、ベンゾジオキソラニル基などを挙げることができ、、ベンゾチアゾリル基、ベンゾジオキソラニル基が好ましい。

[0063] Q¹またはQ²における「１０員ヘテロシクリル基」としては、キノリニル基、イソキノリニル基、シンノリニル基、フタラジニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基などを挙げることができ、キノリニル基が好ましい。

[0064] Q¹またはQ²における「５～６員ヘテロシクリル基」、「フェニル基」、「ナフチル基」または「９～１０員ヘテロシクリル基」上の置換基としては、 ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、水酸基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ１～６アルコキシ基

で置換されたＣ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６アルキルカルボニル基、Ｃ１～６アルキルチオ基、Ｃ１～６アルキルスルホニル基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、フェニルオキシ基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、シアノ基、ニトロ基、トリＣ１～６アルキルシリル基；　Ｃ１～６アルキル基またはＣ１～６アルキルカルボニル基で置換されたアミノ基；Ｃ１～６アルキルで置換されたカルボキサミド基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；または　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基が好ましい。

[0065]　Q^1またはQ^2における「５～６員ヘテロシクリル基」、「フェニル基」、「ナフチル基」または「９～１０員ヘテロシクリル基」上の二つの置換基が一緒になって、二価の有機基を形成してもよいし、二つの置換基で置換されたフェニル基、二つの置換基で置換された５員ヘテロアリール基または二つの置換基で置換された６員ヘテロアリール基における二つの置換基が一緒になって、二価の有機基を形成してもよい。二価の有機基としては、トリメチレン基、テトラメチレン基などのＣ３～６アルキレン基；　メチレンジオキシ基、ジメチレンジオキシ基などのＣ１～３アルキレンジオキシ基などを挙げることができる。

例えば、フェニル基上の二つの置換基が一緒になってトリメチレン基を形成し、Q^1またはQ^2としてインダニル基を形成することが好ましい。

[0066]　Q^2中の環を形成する炭素原子は、式（Ｚ－Ｉ）中のR^7を有する窒素原子とR^7に代わり結合してもよい。例えば、Q^2中の環を形成する炭素原子は、式（Ｚ－Ｉ）中のR^7を有する窒素原子とR^7に代わり結合し、ジヒドロキノ

リン環を形成することが好ましい。

[0067] これらの中でも、式（Ｚ－Ｉ）中のＱ[1]は、より好ましくは、置換若しくは無置換のフェニル基、置換若しくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換のテトラヒドロピラニル基、置換若しくは無置換のピペリジル基、置換若しくは無置換のチエニル基、置換若しくは無置換のピリジル基、置換若しくは無置換のベンゾジオキソラニル基、または置換若しくは無置換のキノリニル基を示し、よりさらに好ましくは、置換若しくは無置換のフェニル基、置換若しくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換のチエニル基、置換若しくは無置換のピリジル基、置換若しくは無置換のベンゾジオキソラニル基、または置換若しくは無置換のキノリニル基を示す。

Ｑ[1]における「５～６員ヘテロシクリル基」、「フェニル基」、「ナフチル基」または「９～１０員ヘテロシクリル基」上の置換基は、より好ましくは、ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ１～６アルキルカルボニル基、Ｃ１～６アルキルチオ基、Ｃ１～６アルキルスルホニル基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、フェニルオキシ基、シアノ基、ニトロ基、トリＣ１～６アルキルシリル基；　Ｃ１～６アルキル基若しくはＣ１～６アルキルカルボニル基で置換されたアミノ基；および／または、Ｃ１～６アルキルで置換されたカルボキサミド基；であり、よりさらに好ましくは、ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ１～６アルキルカルボニル基、Ｃ１～６アルキルチオ基、Ｃ３～６シクロアルキル基、シアノ基、ニトロ基；および／または、　Ｃ１～６アルキル基で置換されたアミノ基である。

Ｑ[1]における「５～６員ヘテロシクリル基」、「フェニル基」、「ナフチル基」または「９～１０員ヘテロシクリル基」が置換基を有する場合、置換基の数は１または２であることが好ましい。

また、Ｑ[1]は、フェニル基上の二つの置換基が一緒になってトリメチレン基を形成してなるインダニル基を示すことも好ましい。

[0068] 式（Ｚ－Ｉ）中のＱ^{2}は、より好ましくは、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換のチエニル基、置換若しくは無置換のチアゾリル基、置換若しくは無置換のピリジル基、置換若しくは無置換のベンゾジオキソラニル基、置換若しくは無置換のベンゾチアゾリル基、または置換若しくは無置換のキノリニル基を示す。

Ｑ^{2}における「フェニル基」、「ナフチル基」、「５～６員ヘテロシクリル基」、または「９～１０員ヘテロシクリル基」上の置換基は、より好ましくは、　ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、水酸基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６アルコキシ基で置換されたＣ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニルオキシ基、ピラゾリル基、シアノ基、ニトロ基；　Ｃ１～６アルキル基で置換されたアミノ基；　および／またはハロゲノ基で置換されたフェニル基である。

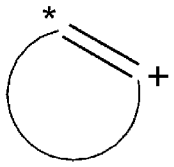
Ｑ^{2}における「フェニル基」、「ナフチル基」、「５～６員ヘテロシクリル基」または「９～１０員ヘテロシクリル基」が置換基を有する場合、置換基の数は１または２であることが好ましい。

また、Ｑ^{2}は、フェニル基上の二つの置換基が一緒になってトリメチレン基を形成してなるインダニル基を示すことも好ましい。

また、Ｑ^{2}中の環を形成する炭素原子が、式（Ｚ－Ｉ）中のＲ^{7}を有する窒素原子とＲ^{7}に代わり結合し、ジヒドロキノリン環を形成することも好ましい。

[0069] 式（Ｚ－Ｉ）中、部分構造Ｈｅｔは、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示す。

[0070] [化17]



(Het)

[0071] 部分構造Ｈｅｔ中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応する。

[0072] ヘテロアリール環は、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも１個のヘテロ原子を環の構成原子として含む芳香環である。ヘテロアリール環は、単環および多環のいずれであってもよい。多環ヘテロアリール環は、少なくとも一つの環がヘテロアリール環であれば、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。

[0073] 部分構造Ｈｅｔにおける「６員ヘテロアリール環」としては、ピリジン環、ピラジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、トリアジン環などを挙げることができる。これらの中でも、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、トリアジン環が好ましい。

[0074] 部分構造Ｈｅｔにおける「９員ヘテロアリール環」としては、インドール環、イソインドール環、インダゾール環、ベンゾイミダール環、イミダゾピリジン環、イミダゾピリダジン環、イミダゾピリミジン環などを挙げることができる。これらの中でも、イミダゾピリダジン環、イミダゾピリミジン環が好ましい。

[0075] 部分構造Ｈｅｔにおける「１０員ヘテロアリール環」としては、キノリン環、イソキノリン環、キナゾリン環、キノキサリン環、ジヒドロピラノピリジン環、ピラノピリジン環などを挙げることができる。これらの中でも、ジヒドロピラノピリジン環、ピラノピリジン環が好ましい。

[0076] 部分構造Ｈｅｔにおける「６員ヘテロアリール環」、または「９～１０員ヘテロアリール環」上の置換基としては、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換

若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、ニトロ基、シアノ基、およびハロゲノ基からなる群から選択される少なくとも一つが挙げられ、好ましくは、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換若しくは無置換の５員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、シアノ基、およびハロゲノ基からなる群から選択される少なくとも一つが挙げられ、より好ましくは、ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ２～６アルケニル基、Ｃ１～６アルコキシ基で置換されたＣ２～６アルケニル基、水酸基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ１～６アルキルカルボニル基、Ｃ１～６アルコキシカルボニル基、Ｃ３～６シクロアルキル基、Ｃ１～６アルキルチオ基、Ｃ１～６アルキルスルフィニル基、Ｃ１～６アルキルスルホニル基、フェニル基、フェニルオキシ基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、シアノ基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基若しくは５員ヘテロアリール基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基；　ハロゲノ

基で置換されたフェニルオキシ基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；または　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基；およびＣ１～６アルキル基若しくはＣ１～６アルコキシカルボニル基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたアミノ基からなる群から選択される少なくとも一つを挙げることができる。

[0077]　これらの中でも、部分構造Ｈｅｔにおける「６員ヘテロアリール環」上の置換基としては、ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ２～６アルケニル基、Ｃ１～６アルコキシ基で置換されたＣ２～６アルケニル基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６アルキルカルボニル基、Ｃ１～６アルコキシカルボニル基、Ｃ１～６アルキルチオ基、Ｃ１～６アルキルスルホニル基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、ハロゲノ基で置換されたフェニル基、ハロゲノ基で置換されたフェニルオキシ基、ピラゾリル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、Ｃ１～６アルキル基で置換されたアミノ基、Ｃ１～６アルコキシカルボニル基で置換されたアミノ基、およびシアノ基から選択される少なくとも一つであることが好ましい。

部分構造Ｈｅｔにおける「９～１０員ヘテロアリール環」上の置換基としては、Ｃ１～６アルキル基が好ましい。

部分構造Ｈｅｔにおける「６員ヘテロアリール環」または「９～１０員ヘテロアリール環」が置換基を有する場合、置換基の数は、１または２であることが好ましい。

[0078]　なお、上記の部分構造における「６員ヘテロアリール環」、または「９～１０員ヘテロアリール環」上の二つの置換基が一緒になって、二価の有機基を形成してもよい。

例えば、二価の有機基は、「６員ヘテロアリール環」上の二つの置換基が

一緒になって、Ｃ３～６アルキレン基、Ｃ３～４アルケニレン基、Ｃ１～３アルキレンジオキシ基、プロペニレンオキシ基などを形成することができ、トリメチレン基、ジビニレン基、プロペニレンオキシ基などを形成することが好ましく、トリメチレン基またはジビニレン基を形成することが好ましい。

[0079] オキソ基を有する６員含窒素ヘテロ環は、少なくとも１個の窒素原子を環の構成原子として含む環であり、環を構成する炭素原子の少なくとも一つがオキソ基で置換されたものである。

「オキソ基を有する６員含窒素ヘテロ基」としては、２－ピリドン環、３－ピリドン環、４－ピリドン環、３－ピリダジノン環、４－ピリダジノン環、２－ピリミジノン環、４－ピリミジノン環、２－ピラジノン環などを挙げることができ、ピリダジノン環であることが好ましい。

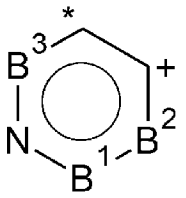
[0080] 部分構造Ｈｅｔにおける「オキソ基を有する６員含窒素ヘテロ基」上の置換基としては、ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、水酸基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、シアノ基； Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基； Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；または Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基などを挙げることができる。これらの中でも、部分構造Ｈｅｔにおける「オキソ基を有する６員含窒素ヘテロ基」上の置換基としては、Ｃ１～６アルキル基であることが好ましい。

[0081] 部分構造Ｈｅｔにおける「６員ヘテロアリール環」のひとつの例として、

式（ＩＩ）で表されるものを挙げることができる、。

式（ＩＩ）中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応する。

[0082] [化18]



(II)

[0083] 式（ＩＩ）中、Ｂ[1]は、窒素原子、または式：ＣＲ[1]で表される基を示し、好ましくは式：ＣＲ[1]で表される基を示す。

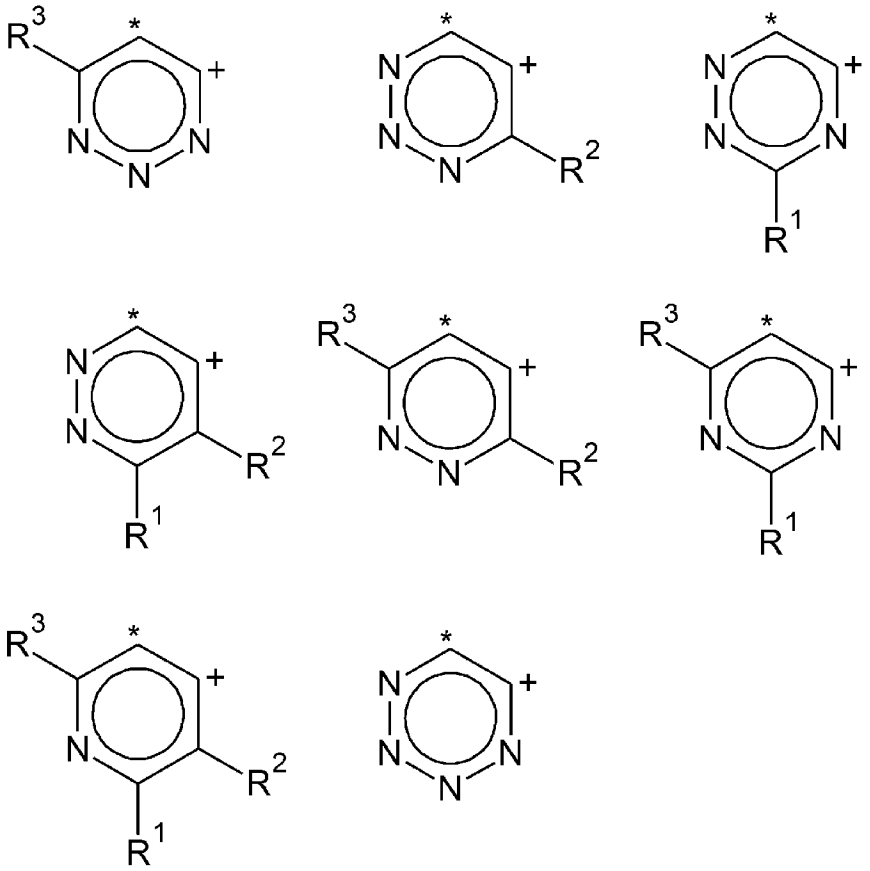
式（ＩＩ）中、Ｂ[2]は、窒素原子、または式：ＣＲ[2]で表される基を示し、好ましくは式：ＣＲ[2]で表される基を示す。

式（ＩＩ）中、Ｂ[3]は、窒素原子、または式：ＣＲ[3]で表される基を示す。

[0084] 式（ＩＩ）で表される「６員ヘテロアリール環」の具体例としては、以下のものを挙げることができる。

[0085]

[化19]



[0086] Ｒ[1]は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置

換のアミノカルボニル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

[0087] Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルキル基」は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。Ｒ１における「Ｃ１～６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、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、ｉ－ヘキシル基などを挙げることができる。

[0088] Ｒ[1]における「Ｃ２～６アルケニル基」としては、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－ヘキセニル基などを挙げることができる。

[0089] Ｒ[1]における「Ｃ２～６アルキニル基」としては、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－ブチニル基などを挙げることができる。

[0090] Ｒ[1]における「Ｃ１～６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、ｓ－ブトキシ基、ｉ－ブトキシ基、ｔ－ブトキシ基などを挙げることができる。

[0091] Ｒ[1]における「Ｃ１～６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、ｉ－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。

[0092] Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルコキシカルボニル基」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。

[0093] Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルキルカルボニルオキシ基」としては、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ｎ－プロピルカルボニルオキシ基、ｉ－プロピルカルボニルオキシ基、ｎ－ブチルカルボニルオキシ基、ｔ－ブチルカルボニルオキシ基などを挙げることができる。

[0094] Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルコキシカルボニルオキシ基」としては、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、ｎ－プロポキシカルボニルオキシ基、ｉ－プロポキシカルボニルオキシ基、ｎ－ブトキシカルボニルオキシ基、ｔ－ブトキシカルボニルオキシ基などを挙げることができる。

[0095] Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルキルチオ基」としては、メチルチオ基、エチルチオ基、ｎ－プロピルチオ基、ｎ－ブチルチオ基、ｎ－ペンチルチオ基、ｎ－ヘキシルチオ基、ｉ－プロピルチオ基、ｉ－ブチルチオ基などを挙げることができる。

[0096] Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルキルスルフィニル基」としては、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を挙げることができる。

[0097] Ｒ[1]における「Ｃ１～６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。

[0098] Ｒ[1]における、「Ｃ１～６アルキル基」、「Ｃ２～６アルケニル基」、「Ｃ２～６アルキニル基」、「Ｃ１～６アルコキシ基」、「Ｃ１～６アルキルカルボニル基」、「Ｃ１～６アルコキシカルボニル基」、「Ｃ１～６アルキルカルボニルオキシ基」、「Ｃ１～６アルコキシカルボニルオキシ基」、「Ｃ１～６アルキルチオ基」、「Ｃ１～６アルキルスルフィニル基」、または「

Ｃ１～６アルキルスルホニル基」上の置換基としては、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、水酸基、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、２－クロロ－ｎ－プロポキシ基、２，３－ジクロロブトキシ基、トリフルオロメトキシ基などのＣ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、シアノ基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；または　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基が好ましく、ハロゲノ基がより好ましい。

[0099] Ｒ[1]における「Ｃ３～６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、シクロヘキシル基などを挙げることができる。これらの中でも、シクロプロピル基またはシクロヘキシル基が好ましく、シクロプロピル基がより好ましい。

[0100] Ｒ[1]における「５～６員ヘテロシクリル基」とは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる１、２、３または４個のヘテロ原子を環の構成原子として含む基である。ヘテロ原子が２個以上であるとき、それらは同じでもよいし、異なってもよい。

「５～６員ヘテロシクリル基」としては、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキソラニル基、ジオキサニル基；ピロリニル基、ジヒドロフラニル基、イミダゾリニル基、ピラゾリニル基、オキサゾリニル基、イソオキサゾリニル基、ジヒドロピラニル基、ピ

ラゾリル基などを挙げることができ、好ましくはピラゾリル基である。

[0101] Ｒ[1]における「５～６員ヘテロシクリルオキシ基」としては、ピロリジニルオキシ基、テトラヒドロフラニルオキシ基、チアゾリジニルオキシ基、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラニルオキシ基、ピペリジルオキシ基、ピペラジニルオキシ基、モルホリニルオキシ基、ジオキソラニルオキシ基、ジオキサニルオキシ基；ピロリニルオキシ基、ジヒドロフラニルオキシ基、イミダゾリニルオキシ基、ピラゾリニルオキシ基、オキサゾリニルオキシ基、イソオキサゾリニルオキシ基；ジヒドロピラニルオキシ基などを挙げることができる。

[0102] Ｒ[1]における「Ｃ３～６シクロアルキル基」、「フェニル基」、「ナフチル基」、「５～６員ヘテロシクリル基」、「フェニルオキシ基」、「ナフチルオキシ基」、「５～６員ヘテロシクリルオキシ基」上の置換基としては、ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、水酸基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、シアノ基；Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基； Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；またはＣ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基が好ましく、ハロゲノ基がより好ましい。

[0103] Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルキル基で置換されたフェニル基」としては、トリル基、キシリル基、トリメチルフェニル基などを挙げることができる。

Ｒ[1]における「Ｃ１～６アルキル基で置換されたフェニルオキシ基」としては、トリロキシ基、キシロキシ基、トリメチルフェノキシ基などを挙げることができる。

[0104] R^1における「アミノ基」は、NH_2で表される基である。「置換アミノ基」は、NH_2で表される基中の水素原子がそれ以外のものに置換されたものである。

[0105] R^1における「アミノカルボニル基」は、NH_2COで表される基である。「置換アミノカルボニル基」は、NH_2COで表される基中の水素原子がそれ以外のものに置換されたものである。

[0106] R^1における「アミノ基」、または「アミノカルボニル基」上の置換基としては、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ１～６アルコキシカルボニル基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；または　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基が好ましく、Ｃ１～６アルキル基またはＣ１～６アルコキシカルボニル基がより好ましい。

[0107] R^1における「Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基」としては、Ｎ－（メトキシ）イミノ基、Ｎ－（エトキシ）イミノ基などを挙げることができる。

[0108] R^1における「ハロゲノ基」としては、フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などを挙げることができる。

[0109] これらの中でも、R^1は、好ましくは、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換若しくは無置換の５員ヘテロシクリル基

、置換若しくは無置換のアミノ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、より好ましくは、水素原子、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６アルキルチオ基、Ｃ１～６アルキルスルホニル基、Ｃ３～６シクロアルキル基、ハロゲノ基で置換されたフェニル基、ピラゾリル基、Ｃ１～６アルキル基で置換されたアミノ基、Ｃ１～６アルコキシカルボニル基で置換されたアミノ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

[0110] Ｒ[2]は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

[0111] Ｒ[1]とＲ[2]は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。ここで、二価の有機基としては、トリメチレン基、テトラメチレン基などのＣ３～６アルキレン基；　プロペニレン基（プロパ－１－エン－１，３－ジイル基、－ＣＨ$_2$－ＣＨ＝ＣＨ－）、ジビニレン基（ブタ－１，３－ジエン－１，４－ジイル基、－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－）などのＣ３～４アルケニレン基；　メチレンジオキシ基、ジメチレンジオキシ基などのＣ１～３アルキレンジオキ

シ基；プロペニレンオキシ基などを挙げることができる。これらの中でも、R^1とR^2が一緒になって形成する二価の有機基は、Ｃ３～６アルキレン基またはＣ３～４アルケニレン基であることが好ましく、トリメチレン基またはジビニレン基であることがより好ましい。

[0112] R^3は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

[0113] R^2およびR^3における「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基」、「置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基」、「置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基」、「置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基」、「置換若しくは無置換のフェニル基」、

「置換もしくは無置換のナフチル基」、「置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基」、「置換若しくは無置換のフェニルオキシ基」、「置換もしくは無置換のナフチルオキシ基」、「置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基」、「置換若しくは無置換のアミノ基」、「置換若しくは無置換のアミノカルボニル基」、「Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基」、「ハロゲノ基」としては、R^1において例示したものと同じものを挙げることができる。

[0114] これらの中でも、R^2は、好ましくは、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、より好ましくは、水素原子、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ２～６アルケニル基、Ｃ１～６アルコキシ基で置換されたＣ２～６アルケニル基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６アルキルカルボニル基、Ｃ１～６アルコキシカルボニル基、ハロゲノ基で置換されたフェニルオキシ基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

また、R^3は、好ましくは水素原子を示す。

[0115] 式（Ｚ－Ｉ）中のZ^aは、酸素原子、硫黄原子、または式：NR^aで表される基を示す。

[0116] R^aは、水素原子、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基を示す。

R^aにおける「Ｃ１～６アルキル基」は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。Ｒ１における「Ｃ１～６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、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、ｉ－ヘキシル基などを挙

げることができる。

「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基」としては、Ｒ[1]において例示したものと同じものを挙げることができる。

Ｒ[a]における「Ｃ１～６アルキル基」上の置換基としては、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、水酸基、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、２－クロロ－ｎ－プロポキシ基、２，３－ジクロロブトキシ基、トリフルオロメトキシ基などのＣ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、シアノ基；Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；またはＣ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基が好ましい。

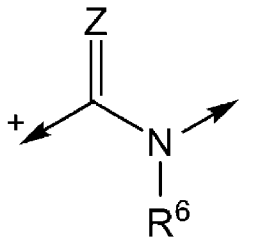
これらの中でも、Ｒ[a]は、水素原子であることが好ましい。

[0117] 式（Ｚ－Ｉ）中のＺ[a]は、酸素原子が好ましい。

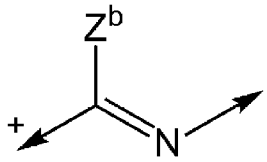
[0118] 式（Ｚ－Ｉ）中のＴは、部分構造（Ｔ－１）または部分構造（Ｔ－２）を示す。

[0119]

[化20]



（Ｔ－１）



（Ｔ－２）

[0120] 前記部分構造（Ｔ－１）中のＺは、酸素原子、硫黄原子、または式：ＮＲ^{b}で表される基を示す。

＋を付した矢印は部分構造中の＋を付した炭素原子と結合し、他方の矢印はＲ^{7}を有する窒素原子と結合する。

Ｒ^{b}は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、水酸基、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基を示す。Ｒ^{b}における「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基」としては、Ｒ^{1}において例示したものと同じものを挙げることができ、水酸基であることが好ましい。

これらの中でも、部分構造（Ｔ－１）中のＺは、酸素原子が好ましい。

[0121] 部分構造（Ｔ－１）中のＲ^{6}は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基を示す。

[0122] Ｒ^{6}における「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基」、「置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基」、「置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基」、「

置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基」、「置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基」、「置換若しくは無置換のフェニル基」、「置換もしくは無置換のナフチル基」、「置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基」としては、R^1において例示したものと同じものを挙げることができる。

これらの中でも、部分構造（Ｔ－１）中のR^6は、水素原子または無置換のＣ１～６アルキル基が好ましく、水素原子がより好ましい。

[0123] 部分構造（Ｔ－２）中、Z^bは、Ｃ１～６アルコキシ基、またはＣ１～６アルキルチオ基を示す。

＊を付した矢印は部分構造中の＊を付した炭素原子と結合し、他方の矢印はR^7を有する窒素原子と結合する。

Z^bにおける「Ｃ１～６アルキル基」、「Ｃ１～６アルキルチオ基」としては、R^1において例示したものと同じものを挙げることができる。

これらの中でも、部分構造（Ｔ－２）中のZ^bは、メトキシ基またはメチルチオ基が好ましく、メトキシ基がより好ましい。

[0124] 式（Ｚ－Ｉ）中のR^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示す。

[0125] 式（Ｚ－Ｉ）中のR^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示す。

[0126] R^4およびR^5における「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基」、「

置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基」、「置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基」、「置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基」、「置換若しくは無置換のフェニル基」、「置換もしくは無置換のナフチル基」、「置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基」、「ハロゲノ基」としては、R^1において例示したものと同じものを挙げることができる。

[0127] 同一炭素上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。ここで、二価の有機基としては、ジメチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基などのＣ２～５アルキレン基を挙げることができる。

[0128] これらの中でも、式（Ｚ－Ｉ）中のR^4およびR^5は水素原子であることが好ましい。あるいは、同一炭素上のR^4とR^5が一緒になってトリメチレン基を形成することも好ましい。

[0129] 式（Ｚ－Ｉ）中のR^7は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、R^c－SO_2－で表される基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはシアノ基を示す。

[0130] R^7における「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基」、「置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基」、「置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基」、「置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基」、「置換若しくは無置換のフェニル基」、「置換もしくは無置換のナフチル基」、「置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基」としては、R^1において例示したものと同じものを挙げることができる。

[0131] R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基

、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

[0132] Ｒ^{c}における「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基」、「置換若しくは無置換のアミノ基」、「置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基」、「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基」、「置換若しくは無置換のフェニル基」、「置換もしくは無置換のナフチル基」、「置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基」、「置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基」としては、Ｒ^{1}において例示したものと同じものを挙げることができる。

[0133] Ｒ^{c}における「Ｃ３～６シクロアルコキシ基」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などを挙げることができる。

[0134] Ｒ^{c}における「３～４員ヘテロシクリル基」としては、アジリジニル基、エポキシ基、アゼチジニル基、オキセタニル基などを挙げることができる。

[0135] Ｒ^{c}における「３～４員ヘテロシクリルオキシ基」としては、アジリジニルオキシ基、エポキシオキシ基、３－アゼチジニルオキシ基、３－オキセタニルオキシ基などを挙げることができる。

[0136] Ｒ^{c}における「Ｃ３～６シクロアルコキシ基」、「３～４員ヘテロシクリル基」、「３～４員ヘテロシクリルオキシ基」上の置換基としては、ハロゲノ基、Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６ハロアルキル基、水酸基、Ｃ１～６アルコキシ基、Ｃ１～６ハロアルコキシ基、Ｃ３～６シクロアルキル基、フェニル基、５員ヘテロアリール基、６員ヘテロアリール基、シアノ基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換されたフェニル基；　Ｃ１～６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された５員ヘテロアリール基；または　Ｃ１～

６アルキル基、Ｃ１～６アルコキシ基、ハロゲノ基、Ｃ１～６ハロアルキル基、若しくはＣ１～６ハロアルコキシ基のいずれか１つ以上の置換基で置換された６員ヘテロアリール基が好ましい。

[0137] 式（Ｚ－Ｉ）中のR^7は、水素原子；Ｃ１～６アルキル基；Ｃ１～６ハロアルキル基；ホルミル基；式：R^c－ＣＯ－で表される基；式：R^c－ＣＳ－で表される基；式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基；R^c－SO_2－で表される基；またはＣ１～６アルキル基で置換されたフェニル基が好ましく、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはR^c－SO_2－で表される基がより好ましい。

R^cは、それぞれ独立に、Ｃ１～６アルキル基；Ｃ１～６ハロアルキル基；Ｃ１～６アルコキシ基；Ｃ１～６ハロアルコキシ基；Ｃ３～６シクロアルキル基で置換されたＣ１～６アルコキシ基；フェニル基で置換されたＣ１～６アルコキシ基；Ｃ３～６シクロアルコキシ基；Ｃ１～６アルキルチオ基、；Ｃ１～６アルキル基で置換されたアミノ基；Ｃ３～６シクロアルキル基；フェニル基；Ｃ１～６アルキル基で置換されたピラゾリル基；オキセタニル基；またはオキセタニルオキシ基を示すことが好ましく、Ｃ１～６アルキル基；Ｃ１～６ハロアルキル基；Ｃ１～６アルコキシ基；Ｃ１～６ハロアルコキシ基；Ｃ３～６シクロアルキル基で置換されたＣ１～６アルコキシ基；フェニル基で置換されたＣ１～６アルコキシ基；Ｃ３～６シクロアルコキシ基；Ｃ１～６アルキルチオ基、；Ｃ１～６アルキル基で置換されたアミノ基；Ｃ３～６シクロアルキル基；フェニル基；Ｃ１～６アルキル基で置換されたピラゾリル基；オキセタニル基；またはオキセタニルオキシ基を示すことがより好ましい。

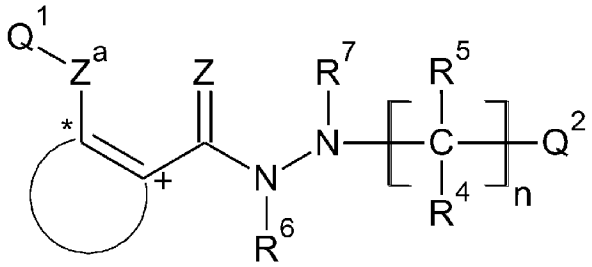
[0138] ｎは、［　］内の構造単位のくりかえし数であり、１～３のいずれかの整数を示す。

ｎは１または２であることが好ましく、１であることがより好ましい。

[0139] 本発明のヒドラジド化合物は、式（Ｉ）で表される化合物またはその塩で

あることが好ましい。式(I)中の各記号は、式（Ｚ－Ｉ）中のそれらと同じ意味である。

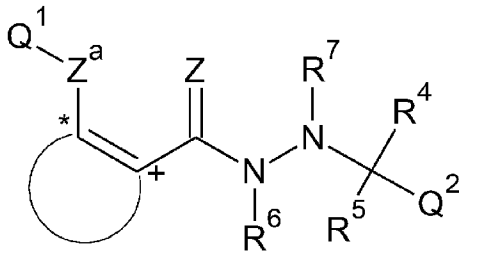
[0140] [化21]



(I)

[0141] ｎが１であるときの本発明のヒドラジド化合物は、式（Ｉａ）で表される化合物またはその塩である。式（Ｉａ）中の各記号は、式（Ｚ－Ｉ）中のそれらと同じ意味である。

[0142] [化22]



(Ia)

[0143] 本発明のヒドラジド化合物の一例としては、下記の式（Ｉ－Ａ１）で表される化合物またはその塩を挙げることができる。

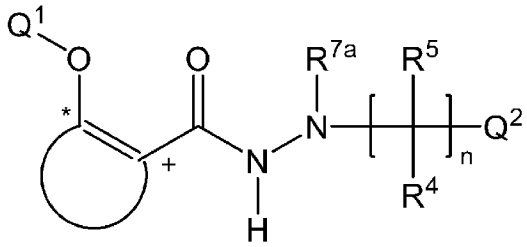
式（Ｉ－Ａ１）中の各記号は式（Ｚ－Ｉ）中のそれらと同じ意味である。

ここで、R^{7a}は、ホルミル基、式：R^{c}－ＣＯ－で表される基、式：R^{c}－ＣＳ－で表される基、式：R^{c}－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはR^{c}－SO_2－で表される基を示す。

R^{c}は、前記R^{7}において定義したものと同じである。

[0144]

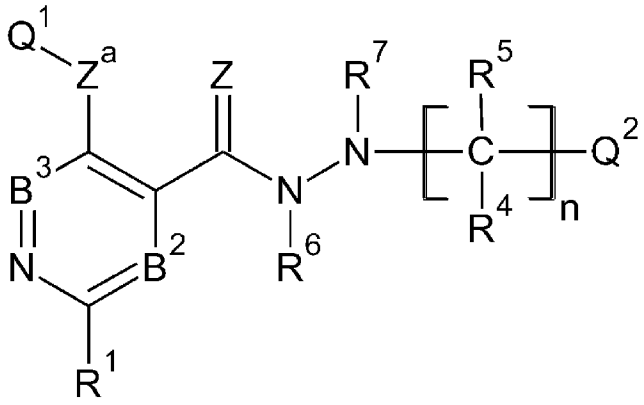
[化23]



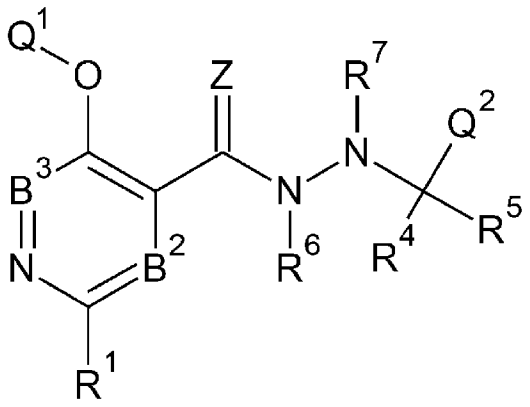
(I-A1)

[0145] 本発明のヒドラジド化合物の具体例としては、式（ＩＩａ）で表される化合物またはその塩や、式（ＩＩｂ）で表される化合物またはその塩などを挙げることができる。式（ＩＩａ）または式（ＩＩｂ）中の各記号は、式（Ｚ－Ｉ）および式（ＩＩ）中のそれらと同じ意味である。

[0146] [化24]



(IIa)



(IIb)

[0147] 化合物（Ｚ－Ｉ）の塩は、農園芸学的に許容される塩であれば、特に制限されない。化合物（Ｉ）の塩としては、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。

[0148] 化合物（Ｚ－Ｉ）または化合物（Ｚ－Ｉ）の塩の製造方法は特に限定されない。例えば、化合物（Ｚ－Ｉ）または化合物（Ｚ－Ｉ）の塩は、実施例等に記載した公知の製造方法によって得ることができる。また、化合物（Ｚ－Ｉ）の塩は、化合物（Ｚ－Ｉ）から公知の手法によって得ることができる。

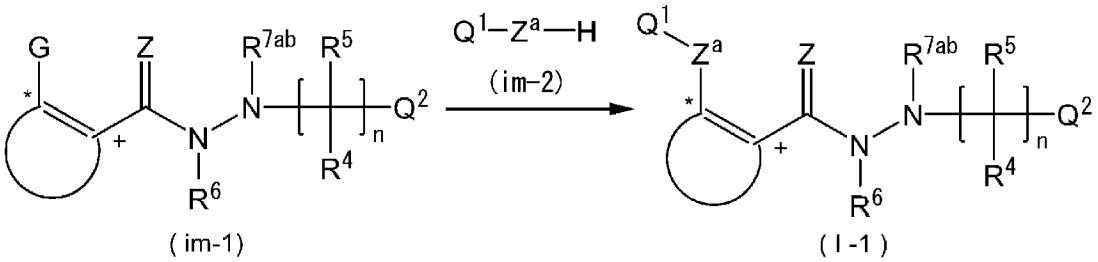
[0149] 化合物（Ｉ）の製造方法

製造方法１

式（Ｉ－１）の化合物を、スキーム１に示されているように、式（ｉｍ－１）の化合物と式（ｉｍ－２）の化合物との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0150] [化25]

スキーム1



(im-1) (I-1)

[0151] ここで、式（Ｉ－１）の化合物は、化合物（Ｉ）のうちで、Ｒ^{7}が式（Ｚ－Ｉ）において定義されたうちで水素原子以外の基（以下、Ｒ７^{ab}と表記することがある。）となる化合物である。

式（ｉｍ－１）の化合物は、Ｇはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｉ－１）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

式（ｉｍ－２）の化合物は、式中の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

[0152] 式（Ｉ－１）の化合物は、式（ｉｍ－１）の化合物を、周知の方法によって、式（ｉｍ－２）の化合物と反応させることで製造するができる。反応は

酸捕捉剤の存在下で行ってもよい。

酸捕捉剤の例としては、一般的な無機塩基および有機塩基が挙げられる。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0153] 式（ｉｍ－２）の化合物は、市販のものであってもよく、周知の方法で製造してもよい。

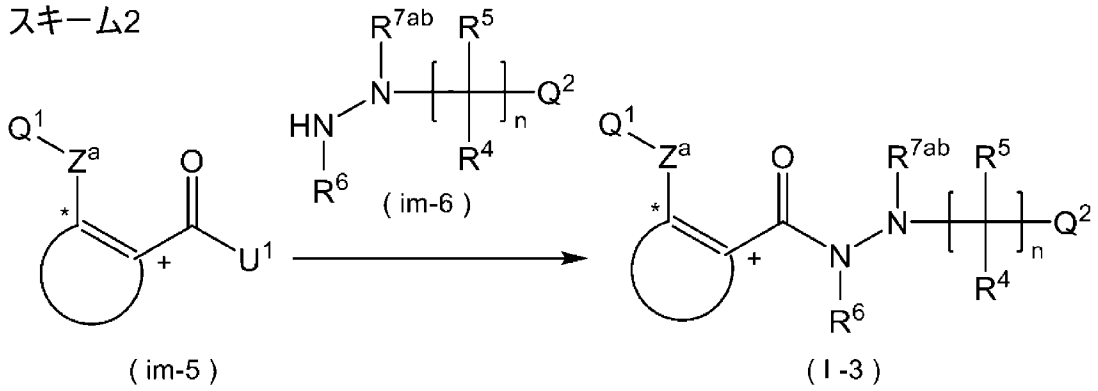
式（ｉｍ－１）の化合物は、本明細書に記載されている方法の１つ以上により製造することができる（製造方法４参照）。

[0154] 製造方法２

式（Ｉ－３）の化合物を、スキーム２に示されているように、式（ｉｍ－５）の化合物と式（ｉｍ－６）の化合物との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0155] [化26]

スキーム2



[0156] ここで、式（Ｉ－３）の化合物は、化合物（Ｉ）のうちで、Ｚが酸素原子であり、Ｒ^{7}が式（Ｚ－Ｉ）において定義されたうちで水素原子以外の基（Ｒ７^{ab}）の化合物である。

式（ｉｍ－５）の化合物は、Ｕ^{1}は水酸基またはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

式（ｉｍ－６）の化合物は、Ｒ^{7ab}は式（Ｉ－１）の化合物において定義されたものと同じであり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義

されたものと同じである化合物である。

[0157] 式（Ｉ－３）の化合物は、U^1が水酸基である式（ｉｍ－５）の化合物を、縮合試薬の存在下で、式（ｉｍ－６）の化合物と反応させることで製造するができる。

縮合試薬の例としては、ハロゲン化試薬（例えば、ホスゲン、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、三塩化リン酸化物、塩化オキサリルまたは塩化チオニル）、脱水剤（例えば、クロロギ酸エチル、クロロギ酸メチル、クロロギ酸イソプロピル、クロロギ酸イソブチルまたは塩化メタンスルホニル）、カルボニルジイミダゾールなどが挙げられるが、これらに限定されない。

その他にも、式（Ｉ－３）の化合物は、U^1が水酸基である式（ｉｍ－５）の化合物を、有機塩基と、カルボジイミド類（例えば、Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイミド（ＤＣＣ））、１－ヒドロキシ－７－アゾベンゾトリアゾール（ＨＯＡｔ）、Ｏ－（7－アザベンゾトリアゾール－１－イル）－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチルウロニウムヘキサフルオロりん酸塩（ＨＡＴＵ）、プロピルホスホン酸無水物などの縮合試薬の存在下で反応させることで製造することもできる。１－ヒドロキシベンゾトリアゾールを併用することもできる。

[0158] 式（Ｉ－３）の化合物は、U^1がハロゲン原子である式（ｉｍ－５）の化合物を、周知の方法によって、酸捕捉剤の存在下で式（ｉｍ－６）の化合物と反応させることでも製造するができる。

酸捕捉剤の例としては、一般的な無機塩基および有機塩基が挙げられる。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0159] 式（ｉｍ－５）の化合物は、市販のものであってもよく、あるいは文献（例えば、特表２０２２－５０８２７７号公報、特表２０２２－５１４６５１号公報）に記載されている方法に従って製造してもよい。また、本明細書に記載されている方法の１つ以上により製造することができる（製造方法４参照）。

式（ｉｍ－６）の化合物は、市販のものであってもよい。また、本明細書に記載されている方法の１つ以上により製造することができる（製造方法５、６、７参照）。

[0160] ここで、式（Ｉ－３）の化合物は、チオン酸化剤を用いることで、Ｚが硫黄原子である化合物に転化することができる。

チオン酸化剤としては、硫黄、硫化水素酸、硫化ナトリウム、水硫化ナトリウム、三硫化ホウ素、ビス（ジエチルアルミニウム）スルフィド、硫化アンモニウム、五硫化リン、ローソン試薬などが挙げられるが、これらに限定されない。

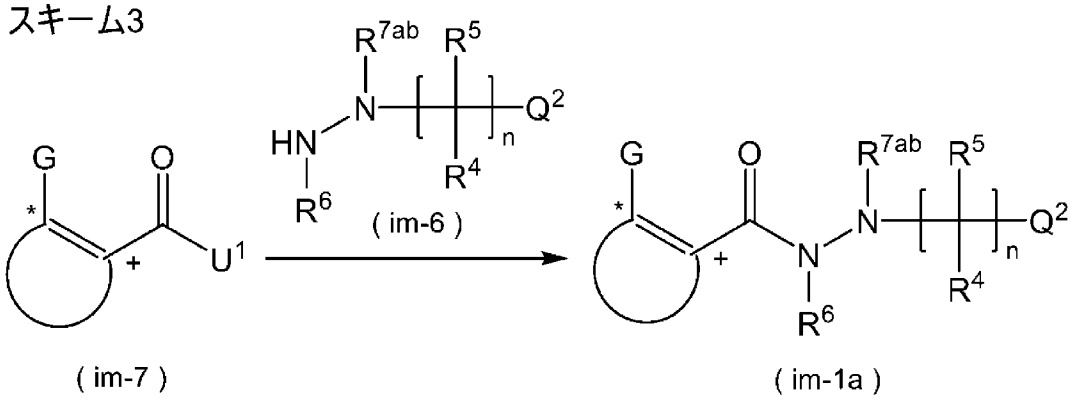
必要に応じて、無機塩基または有機塩基の存在下で、反応させてもよい。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0161] 製造方法３

式（ｉｍ－１ａ）の化合物を、スキーム３に示されているように、式（ｉｍ－７）の化合物と式（ｉｍ－６）の化合物との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0162] [化27]

スキーム3



[0163] ここで、式（ｉｍ－１ａ）の化合物は、式（ｉｍ－１）の化合物のうちで、Ｚが酸素原子である化合物である。

式（ｉｍ－７）の化合物は、Ｇはハロゲノ基であり、Ｕ[1]は水酸基またはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義された

ものと同じである化合物である。

製造方法３で用いる試薬および反応条件は、製造方法２の記載のものを用いることができる。

[0164] 式（ｉｍ－７）の化合物は、市販のものであってもよく、あるいは文献（例えば、特表２０２２－５０８２７７号公報、特表２０２２－５１４６５１号公報）に記載されている方法に従って製造してもよい。

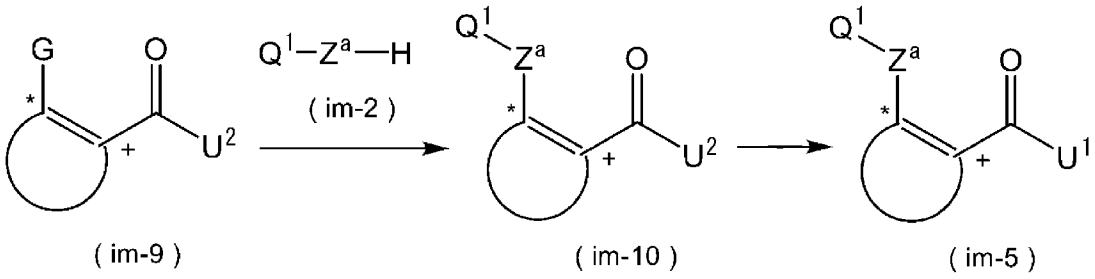
[0165] ここで、式（ｉｍ－１ａ）の化合物は、チオン酸化剤を用いることで、Ｚが硫黄原子である化合物に転化することができる。転化の方法は、製造方法２に記載の方法を用いることができる。

[0166] 製造方法４

式（ｉｍ－５）の化合物を、スキーム４に示されているように、式（ｉｍ－９）の化合物と式（ｉｍ－２）の化合物との反応工程と、その反応によって得られた式（ｉｍ－１０）の化合物を式（ｉｍ－５）の化合物へ転換する反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0167] [化28]

スキーム4



(im-9) (im-10) (im-5)

[0168] 式（ｉｍ－９）の化合物は、U^2はＣ１～６アルコキシ基であり、Ｇはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

式（ｉｍ－１０）の化合物は、U^2はＣ１～６アルコキシ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

[0169] 式（ｉｍ－１０）の化合物は、式（ｉｍ－９）の化合物を、周知の方法に

よって、式（ｉｍ－２）の化合物と反応させることで製造するができる。反応は酸捕捉剤の存在下で行ってもよい。

酸捕捉剤の例としては、一般的な無機塩基および有機塩基が挙げられる。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0170] U^1が水酸基である式（ｉｍ－５）の化合物は、式（ｉｍ－１０）の化合物を酸性条件下または塩基性条件下、加水分解することで製造することができる。

例えば、トリフルオロ酢酸を用いることで酸性条件下とする方法、テトラヒドロフラン（ＴＨＦ）と水と混合溶媒系で水酸化リチウムを用いることで塩基性条件下とする方法が挙げられる。

U^1がハロゲノ基である式（ｉｍ－５）の化合物は、U^1が水酸基である式（ｉｍ－５）の化合物をハロゲン化試薬と反応させることで製造することができる。

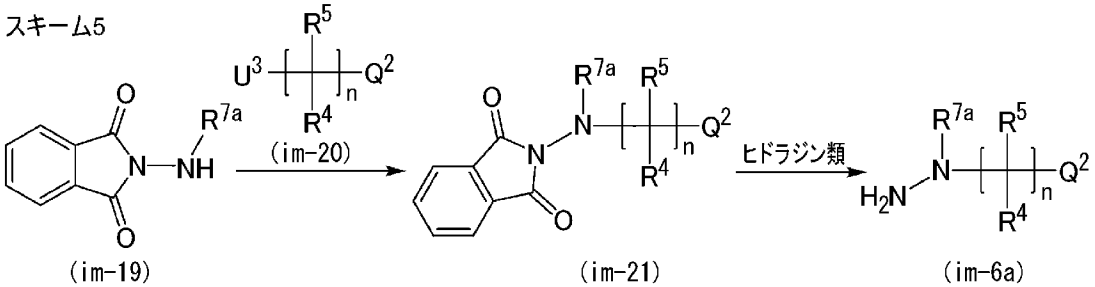
[0171] 式（ｉｍ－９）の化合物は、市販のものであってもよく、周知の方法で製造してもよい。

[0172] 製造方法５

式（ｉｍ－６ａ）の化合物を、スキーム５に示されているように、式（ｉｍ－１９）の化合物と式（ｉｍ－２０）の化合物との反応工程と、その反応によって得られた式（ｉｍ－２１）の化合物をヒドラジン類との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0173] [化29]

スキーム5



[0174] ここで、式（ｉｍ－６ａ）の化合物は、式（ｉｍ－６）化合物のうちでR^7

^{ab}が、式（Ｚ－Ｉ）において定義されたうちで「ホルミル基、式：R^{c}－ＣＯ－で表される基、式：R^{c}－ＣＳ－で表される基、式：R^{c}－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはR^{c}－SO_2－で表される基」（以下、R^{7a}と表記することがある。）であり、R^{6}が水素原子である化合物である。

式（ｉｍ－１９）の化合物は、R^{7a}は式（ｉｍ－６ａ）の化合物において定義されたものと同じである。

式（ｉｍ－２０）の化合物は、U^{3}は水酸基またはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

式（ｉｍ－２１）の化合物は、R^{7a}は式（ｉｍ－６ａ）の化合物において定義されたものと同じであり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

[0175] 式（ｉｍ－２１）の化合物は、U^{3}が水酸基である式（ｉｍ－２０）の化合物を、アゾジカルボン酸ジアルキルとトリフェニルホスフィンの存在下で、式（ｉｍ－１９）の化合物と反応させることで製造するができる。いわゆる光延反応である。

アゾジカルボン酸ジアルキルの例としては、アゾジカルボン酸ジエチル、アゾジカルボン酸ジイソプロピルなどが挙げられるが、これらに限定されない。

[0176] 式（ｉｍ－２１）の化合物は、U^{3}がハロゲン原子である式（ｉｍ－２０）の化合物を、周知の方法によって、酸捕捉剤の存在下で式（ｉｍ－１９）の化合物と反応させることで製造するができる。

酸捕捉剤の例としては、一般的な無機塩基および有機塩基が挙げられる。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0177] 式（ｉｍ－６ａ）の化合物は、式（ｉｍ－２１）の化合物を、ヒドラジン類と反応させることで製造することができる。

ヒドラジン類の例としては、ヒドラジン一水和物、メチルヒドラジンなど

が挙げられる。

式（ｉｍ－１９）の化合物は、市販のものであってもよく、あるいは式：NH_2-NH-R^{7a}で表される化合物（R^{7a}は、式（ｉｍ－６ａ）の化合物において定義されたものと同じである。）と無水フタル酸を反応することで製造してもよい。

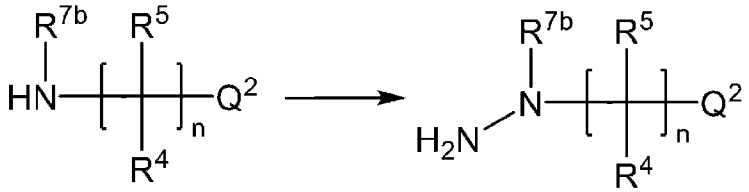
式（ｉｍ－２０）の化合物は、市販のものであってもよく、周知の方法で製造してもよい。

[0178] 製造方法６

式（ｉｍ－６ｂ）の化合物を、スキーム６に示されているように、式（ｉｍ－２２）の化合物をＮ－アミノ化する反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0179] [化30]

スキーム6



[0180] ここで、式（ｉｍ－６ｂ）の化合物は、式（ｉｍ－６）化合物のうちでR^{7ab}が、式（Ｚ－Ｉ）において定義されたうちで「置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基」（以下、R^{7b}と表記することがある。）であり、R^{6}が水素原子である化合物である。

式（ｉｍ－２２）の化合物は、R^{7b}は式（ｉｍ－６ｂ）の化合物において定義されたものと同じであり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物におい

て定義されたものと同じである化合物である。

[0181] 式（ｉｍ－６ｂ）の化合物は、式（ｉｍ－２２）の化合物をＯ－メシチレンスルホニルヒドロキシルアミン、Ｏ－（２，４－ジニトロフェニル）ヒドロキシアミノなどのアミノ化剤と反応させる方法、または酸性条件下亜硝酸ナトリウムと反応させて、Ｎ－ニトロソアミンへ転化し、さらに還元剤と反応させる方法で、製造することができる。還元剤の例としては、水素化アルミニウムリチウム、水素化ジイソブチルアルミニウムなどが挙げられるが、これらに限定されない。

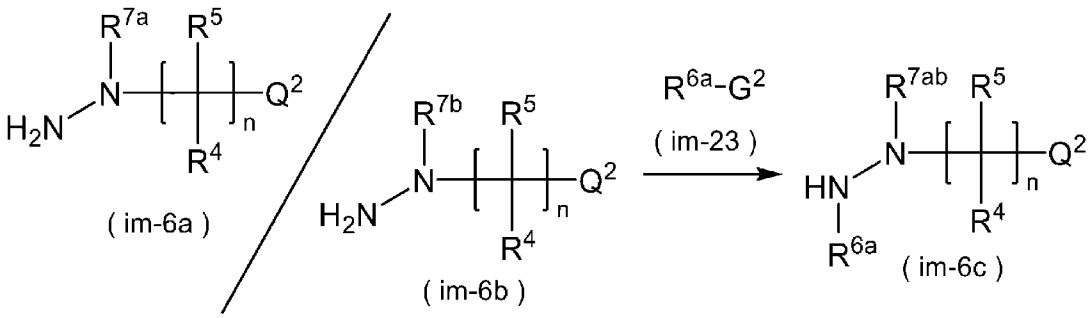
[0182] 式（ｉｍ－２２）の化合物は、市販のものであってもよく、周知の方法で製造してもよい。

[0183] 製造方法７

式（ｉｍ－６ｃ）の化合物を、スキーム７に示されているように、式（ｉｍ－６ａ）の化合物または式（ｉｍ－６ｂ）の化合物と式（ｉｍ－２３）の化合物との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0184] [化31]

スキーム7



[0185] ここで、式（ｉｍ－６ｃ）の化合物は、式（ｉｍ－６）の化合物のうちで、R^6が式（Ｚ－Ｉ）において定義されたうちで水素原子以外の基（以下、R^{6a}と表記することがある。）である化合物である。

式（ｉｍ－２３）の化合物は、G^2はハロゲノ基であり、R^{6a}は式(ｉｍ－６ｃ)において定義されたものと同じである化合物である。

[0186] 式（ｉｍ－６ｃ）の化合物は、式（ｉｍ－６ａ）の化合物または式（ｉｍ

－６ｂ）の化合物を、式（ｉｍ－２３）の化合物と反応することで製造するができる。反応は、無機塩基の存在下で行うことが好ましい。

式（ｉｍ－２３）の化合物は、市販のものであってもよく、周知の方法で製造してもよい。

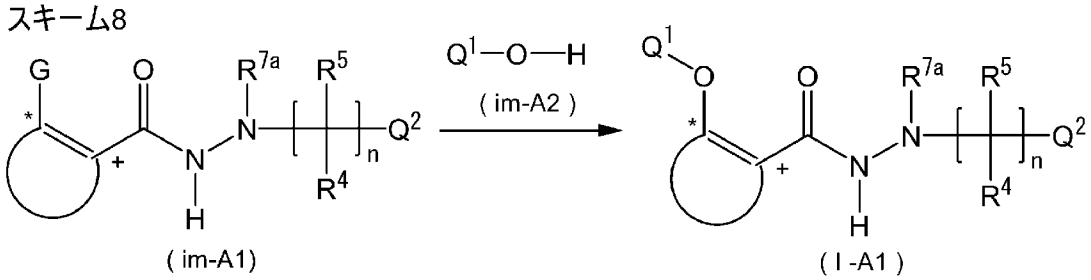
[0187] 化合物（Ｉ－Ａ１）の製造方法

製造方法８

式（Ｉ－Ａ１）の化合物を、スキーム８に示されているように、式（ｉｍ－Ａ１）の化合物と式（ｉｍ－Ａ２）の化合物との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0188] [化32]

スキーム8



[0189] 式（ｉｍ－Ａ１）の化合物は、Ｇはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｉ－Ａ１）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

式（ｉｍ－Ａ２）の化合物は、式中の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

[0190] 式（Ｉ－Ａ１）の化合物は、式（ｉｍ－Ａ１）の化合物を、周知の方法によって、式（ｉｍ－Ａ２）の化合物と反応させることで製造するができる。反応は酸捕捉剤の存在下で行ってもよい。

酸捕捉剤の例としては、一般的な無機塩基および有機塩基が挙げられる。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0191] 式（ｉｍ－Ａ２）の化合物は、市販のものであってもよく、周知の方法で製造してもよい。

式（ｉｍ－Ａ１）の化合物は、本明細書に記載されている方法の１つ以上

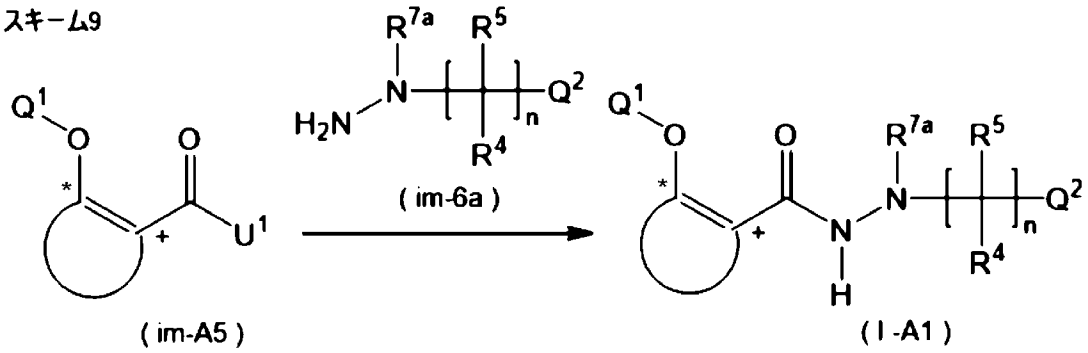
により製造することができる（製造方法１０参照）。

[0192] 製造方法９

式（Ｉ－Ａ１）の化合物を、スキーム９に示されているように、式（ｉｍ－Ａ５）の化合物と式（ｉｍ－６ａ）の化合物との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0193] [化33]

スキーム9



[0194] 式（ｉｍ－Ａ５）の化合物は、Ｕ[1]は水酸基またはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

式（ｉｍ－６ａ）の化合物は、Ｒ[7a]は式（Ｉ－Ａ１）の化合物において定義されたものと同じであり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

[0195] 式（Ｉ－Ａ１）の化合物は、Ｕ[1]が水酸基である式（ｉｍ－Ａ５）の化合物を、縮合試薬の存在下で、式（ｉｍ－６ａ）の化合物と反応させることで製造するができる。

縮合試薬の例としては、ハロゲン化試薬（例えば、ホスゲン、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、三塩化リン酸化物、塩化オキサリルまたは塩化チオニル）、脱水剤（例えば、クロロギ酸エチル、クロロギ酸メチル、クロロギ酸イソプロピル、クロロギ酸イソブチルまたは塩化メタンスルホニル）、カルボニルジイミダゾールなどが挙げられるが、これらに限定されない。

その他にも、式（Ｉ－Ａ１）の化合物は、Ｕ[1]が水酸基である式（ｉｍ－Ａ５）の化合物を、有機塩基と、カルボジイミド類（例えば、Ｎ，Ｎ’－ジシ

クロヘキシルカルボジイミド（ＤＣＣ））、１－ヒドロキシ－７－アゾベンゾトリアゾール（ＨＯＡｔ）、Ｏ－（7－アザベンゾトリアゾール－１－イル）－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチルウロニウムヘキサフルオロりん酸塩（ＨＡＴＵ）、プロピルホスホン酸無水物などの縮合試薬の存在下で反応させることで製造することもできる。１－ヒドロキシベンゾトリアゾールを併用することもできる。

[0196] 式（Ｉ－Ａ１）の化合物は、U^1がハロゲン原子である式（ｉｍ－Ａ５）の化合物を、周知の方法によって、酸捕捉剤の存在下で式（ｉｍ－６ａ）の化合物と反応させることで製造するができる。

酸捕捉剤の例としては、一般的な無機塩基および有機塩基が挙げられる。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0197] 式（ｉｍ－Ａ５）の化合物は、市販のものであってもよく、あるいは文献（例えば、特表２０２２－５０８２７７号公報、特表２０２２－５１４６５１号公報）に記載されている方法に従って製造してもよい。また、本明細書に記載されている方法の１つ以上により製造することができる（製造方法４、１１参照）。

式（ｉｍ－６ａ）の化合物は、市販のものであってもよい。また、本明細書に記載されている方法の１つ以上により製造することができる（製造方法５参照）。

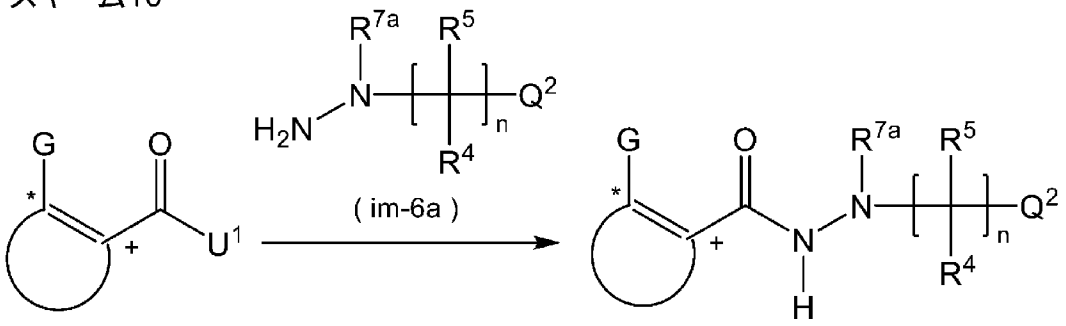
[0198] 製造方法１０

式（ｉｍ－Ａ１）の化合物を、スキーム１０に示されているように、式（ｉｍ－７）の化合物と式（ｉｍ－６ａ）の化合物との反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0199]

[化34]

スキーム10



[0200] 式（ｉｍ－７）の化合物は、Ｇはハロゲノ基であり、Ｕ[1]は水酸基またはハロゲノ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

製造方法１０で用いる試薬および反応条件は、製造方法９に記載のものを用いることができる。

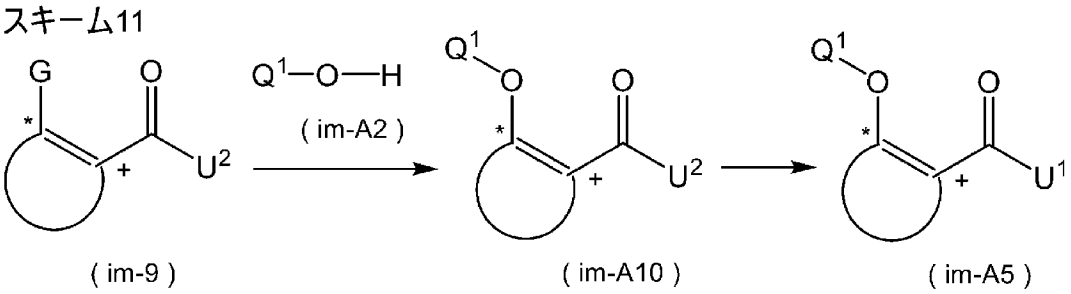
[0201] 式（ｉｍ－７）の化合物は、市販のものであってもよく、あるいは文献（例えば、特表２０２２－５０８２７７号公報、特表２０２２－５１４６５１号公報）に記載されている方法に従って製造してもよい。

[0202] 製造方法１１

式（ｉｍ－Ａ５）の化合物を、スキーム１１に示されているように、式（ｉｍ－９）の化合物と式（ｉｍ－Ａ２）の化合物との反応工程と、その反応によって得られた式（ｉｍ－Ａ１０）の化合物を式（ｉｍ－Ａ５）の化合物へ転換する反応工程を含む方法によって製造することができる。

[0203] [化35]

スキーム11



[0204] 式（ｉｍ－９）の化合物は、Ｕ[2]はＣ１～６アルコキシ基であり、Ｇはハロ

ゲノ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

式（ｉｍ－Ａ１０）の化合物は、U^2はＣ１～６アルコキシ基であり、その他の記号は式（Ｚ－Ｉ）の化合物において定義されたものと同じである化合物である。

[0205] 式（ｉｍ－Ａ１０）の化合物は、式（ｉｍ－９）の化合物を、周知の方法によって、式（ｉｍ－Ａ２）の化合物と反応させることで製造するができる。反応は酸捕捉剤の存在下で行ってもよい。

酸捕捉剤の例としては、一般的な無機塩基および有機塩基が挙げられる。炭酸アルカリ金属塩、酢酸アルカリ土類金属塩、第三級アミンまたは芳香族アミンが好ましい。

[0206] U^1が水酸基である式（ｉｍ－Ａ５）の化合物は、式（ｉｍ－Ａ１０）の化合物を酸性条件下または塩基性条件下、加水分解することで製造することができる。

例えば、トリフルオロ酢酸を用いることで酸性条件下とする方法、ＴＨＦと水と混合溶媒系で水酸化リチウムを用いることで塩基性条件下とする方法が挙げられる。

U^1がハロゲノ基である式（ｉｍ－Ａ５）の化合物は、U^1が水酸基である式（ｉｍ－Ａ５）の化合物をハロゲン化試薬と反応させることで製造することができる。

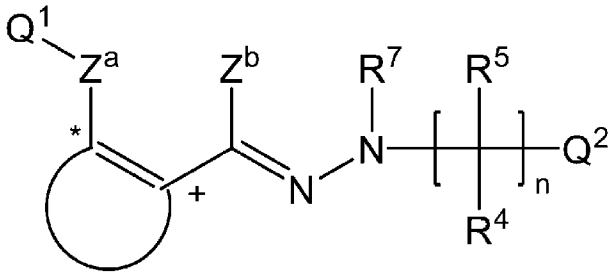
[0207] 式（ｉｍ－９）の化合物は、市販のものであってもよく、周知の方法で製造してもよい。

[0208] 化合物（Ｉ’）の製造方法

化合物（Ｚ－Ｉ）において、式（Ｚ－Ｉ）中のＴが、部分構造（Ｔ－２）である化合物は下記の式（Ｉ’）で表される化合物である。式（Ｉ’）中の各記号は式（Ｚ－Ｉ）中のそれらと同じ意味である。

[0209]

[化36]



（Ｉ’）

[0210] 式（Ｉ’）で表される化合物（以下、化合物（Ｉ’）と表記することがある。）は、Ｚ^{b}がＣ１～６アルキルチオ基である場合、化合物（Ｉ）から、ローソン試薬などのチオン酸化剤を用いてチオアミド化後に、対応するアルキルハライドを反応させることで製造することができる。

Ｚ^{b}がＣ１～６アルコキシ基である場合は、テトラフルオロほう酸トリメチルオキソニウム、テトラフルオロほう酸トリエチルオキソニウムなどのオキソニウム塩と反応させることで製造することができる。

[0211] 本発明の農園芸用殺菌剤は、化合物（Ｉ）および化合物（Ｉ）の塩からなる群から選ばれる少なくともひとつを有効成分（以下、有効成分（Ｉ）と表記することがある。）として含有するものである。本発明の農園芸用殺菌剤に含まれる有効成分（Ｉ）の量は殺菌効果を示す限りにおいて特に制限されない。

[0212] 本発明の農園芸用殺菌剤は、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）、接合菌類（Zygomycetes）に属する菌に由来する植物病害の防除に使用できる。

[0213] 防除の対象となる植物病害（病原菌）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 cucumeris）、さび病（Uromyces betae）、うどんこ病（Oidium sp.）、斑点病（Ramularia beticola）、苗立枯病（Aphanomyces cochlioides、Pythium ultimum）など

ラッカセイ：褐斑病（Mycosphaerella arachidis）、汚斑病（Ascochyta sp.）、さび病（Puccinia arachidis）、立枯病（Pythium debaryanum）、さび斑病（Alternaria alternata）、白絹病（Sclerotium rolfsｉｉ）黒渋病（Mycosphaerella berkeleyi）、黒根腐病（Calonectria ilicicola）など

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 cassｉｉcola）、苗立枯病（Pythium debaryanum、Rhizoctonia solani Kuhn）、ホモプシス根腐病（Phomopsis sp.）斑点細菌病（Pseudomonas syringae pv. Lachrymans）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、 Verticillium dahliae）、うどんこ病（Oidium neolycopersici）、輪紋病（Alternaria solani）、すすかび病（Pseudocercospora fuligena）、青枯病（Ralstonia solanacearum）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）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）、半身萎凋病（Verticillium dahliae）、褐紋病（Phomopsis vexans）など

トウガラシ：疫病（Phytophthora capsici）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、炭疽病（Colletotrichum aenigma、Colletotrichum capsici、Colletotrichum fructicola、Colletotrichum jiangxiense）、うどんこ病（Leveillula taurica）など

イチゴ：灰色かび病（Botrytis cinerea）、うどんこ病（Sphaerotheca humuli）、炭そ病（Colletotrichum acutatum、Colletotrichum fragariae）、疫病（Phytophthora cactorum）、軟腐病（Rhizopus stolonifer）、萎黄病

（Fusarium oxysporum）、萎凋病（Verticillium dahliae）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）など

タマネギ：灰色腐敗病（Botrytis allｌｌ）、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）、小菌核病（Ciborinia allｌｌ）、小菌核腐敗病（Botrytis squamosa）、乾腐病（Fusarium oxysporum）、紅色根腐病（Pyrenochaeta terrestris）、黒腐菌核病（Sclerotium cepivorum）、さび病（Puccinia allｌｌ）、白絹病（Sclerotium rolfsｌｌ）など

ネギ：軟腐病（Pectobacterium carotovorum）、べと病（Peronospora destructor）、葉枯病（Pleospora allｌｌ）、黒腐菌核病（Sclerotium cepivorum）、さび病（Puccinia allｌｌ）、白斑葉枯病（Botrytis squamosa）、白絹病（Sclerotium rolfsｌｌ）、紅色根腐病（Pyrenochaeta terrestris）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. maculicola、P. s. pv. alisalensis）、べと病（Peronospora parasitica）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、黒すす病（Alternaria brassicicola）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、根朽病（Phoma lingam）、ピシウム腐敗病（Pythium aphanidermatum, Pythium ultimum）、白さび病（Albugo macrospora）など

レタス：腐敗病（Pseudomonas cichorｌｌ, Pseudomonas marginalis）、軟腐病（Pectobacterium carotovorum）、べと病（Bremia lactucae）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、ビッグベイン病（Mirafiori lettuce big-vein ophiovirus）、根腐病（Fusarium oxysporum）、すそ枯病（Rhizoctonia solani）、うどんこ病（Golovinomyces orontｌｌ）など

インゲン：菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、炭疽病（Colletotrichum lindemuthianum）、角斑病（Phaeoisar

iopsis griseola）など

エンドウ：褐紋病（Mycosphaerella blight）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、うどんこ病（Erysiphe pisi）など

[0214] 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）、白紋羽病（Rosellinia necatrix）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、火傷病（Erwinia amylovora）、銀葉病（Chondrostereum purpureum）、根頭がんしゅ病（Rhizobium radiobacter 、 Rhizobium rhizogenes）など

ウメ：黒星病（Cladosporium carpophilum）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、灰星病（Monilinia mumecola）、すす斑病（Peltaster sp.）、ふくろ実病（Taphrina pruni）、褐色せん孔病（Phloeosporella padi）など

カキ：うどんこ病（Phyllactinia kakicola）、炭そ病（Gloeosporium kaki）、角斑落葉病（Cercospora kaki）、円星落葉病（Mycosphaerella nawae）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、すす点病（Zygophiala jamaicensis）など

モモ：灰星病（Monilinia fructicola、Monilia fructigena）、黒星病（Cladosporium carpophilum）、ホモプシス腐敗病（Phomopsis sp.）、穿孔細菌病（Xanthomonas campestris pv. pruni）、縮葉病（Taphrina deformans）、炭そ病（Colletotrichum gloeosporioides）、褐色せん孔病（Phloeosporella padi）、かわらたけ病（Coriolus versicolor）など

アーモンド：灰星病（Monilinia laxa）、斑点病（Stigmina carpophila）、黒星病（Cladosporium carpophilum）、葉ぶくれ病（Polystigma rubrum）

、斑点落葉病（Alternaria alternata）、炭疽病（Colletotrichum gloeosporides）など

オウトウ：灰星病（Monilinia fructicola）、炭そ病（Colletotrichum acutatum）、黒斑病（Alternaria sp.）、幼果菌核病（Monilinia kusanoi）、褐色せん孔病（Mycosphaerella cerasella）、うどんこ病（Podosphaera tridactyla）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）、白腐病（Coniella castaneicola）、さび病（Phakopsora ampelopsidis）、白色綿雪症（病原菌未同定）、根頭がんしゅ病（Rhizobium radiobacter、 Rhizobium vitis）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（Pestalotiopsis longiseta、 P. theae）、炭そ病（Colletotrichum theae-sinensis）、網もち病（Exobasidium reticulatum）、赤焼病（Pseudomonas syringae）、もち病（Exobasidium vexans）など

カンキツ：そうか病（Elsinoe fawcettＩＩ）、青かび病（Penicillium italicum）、緑かび病（Penicillium digitatum）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、黒点病（Diaporthe citri）、かいよう病（Xanthomonas campestris pv.Citri）、うどんこ病（Oidium sp.）、疫病（Phytophthora citrophthora）、炭そ病（Colletotrichum fioriniae）など

キウイフルーツ：花腐細菌病（Pseudomonas marginalis、Pseudomonas syringae、Pseudomonas viridiflava）、かいよう病（Pseudomonas syringae）

、灰色かび病（Botrytis cinerea）、果実軟腐病（Botryosphaeria dothidea、Diaporthe sp.、Lasiodiplodia theobromae）、すす斑病（Pseudocercospora actinidiae）など

オリーブ：炭疽病（Colletotrichum acutatum, Colletotrichum gloeosporioides）、Peacock spot（Spilocaea oleaginea）など

クリ：炭疽病（Colletotrichum gloeosporioides）など

[0215] コムギ：うどんこ病（Blumeria graminis f.sp. tritici）、赤かび病（Gibberella zeae、Fusarium avenaceum、Fusarium culmorum、Fusarium crookwellense、Microdochium nivale）、赤さび病（Puccinia recondita）、黄さび病（Puccinia strⅠⅠformis）、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（Gaeumannomyces graminis）、麦角病（Claviceps purpurea）、なまぐさ黒穂病（Tilletia caries）、裸黒穂病（Ustilago nuda）、いもち病（Pyricularia grisea）、Damping off（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）、Seedling blight（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）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）、Damping off（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）、Seedling blight（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）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 graminicola）、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 alternat

a、Curvularia intermedia）、腹黒米（Alternaria padwickｉｉ）、紅変米（Epicoccum purpurascens）など

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

チューリップ：灰色かび病（Botrytis cinerea）、褐色斑点病（Botrytis tulipae）、葉腐病（Rhizoctonia solani）、球根腐敗病（Fusarium oxysporum）、皮腐病（Rhizoctonia solani）など

バラ：黒星病（Diplocarpon rosae）、うどんこ病（Erysiphe simulans、Podosphaera pannosa）、灰色かび病（Botrytis cinerea）など

キク：灰色かび病（Botrytis cinerea）、白さび病（Puccinia horiana）、べと病（Paraperonospora minor, Peronospora danica）、ピシウム立枯病（Pythium aphanidermatum、Pythium dissotocum、Pythium helicoides、Pythium oedochilum、Pythium sylvaticum）、立枯病（Rhizoctonia solani）、フザリウム立枯病（Fusarium solani）など

ガーベラ：灰色かび病（Botrytis cinerea）、うどんこ病（Podosphaera xanthｉｉ）など

ユリ：葉枯病（Botrytis elliptica, Pestalotiopsis sp.）、灰色かび病（Botrytis cinerea）など

ヒマワリ：べと病（Plasmopara halstedｉｉ）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、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）、ブラウンパッチ（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 manshurica）、茎疫病（Phytophthora sojae）、さび病（Phakopsora pachyrhizi）

、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、炭そ病（Colletotrichum truncatum）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、黒とう病（Elsinoe glycines)、黒点病（Diaporthe phaseolorum var. sojae）、Damping off（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）、Seedling blight（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）など

ジャガイモ：疫病（Phytophthora infestans）、夏疫病（Alternaria solani）、黒あざ病（Thanatephorus cucumeris）、半身萎凋病（Verticillium albo－atrum、V. dahliae、V. nigrescens）、黒あし病（Pectobacterium atrosepticum）、軟腐病（Pectobacterium carotovorum）、灰色かび病（Botrytis cinerea）、そうか病（Streptomyces spp.）、菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）など

ヤマノイモ：葉渋病（Cylindrosporium dioscoreae）、炭疽病（Colletotrichum gloeosporioides）、青かび病（Penicillium sclerotigenum）など

サツマイモ：紫紋羽病（Helicobasidium mompa）、つる割病（Fusarium oxysporum）など

サトイモ：疫病（Phytophthora colocasiae）、茎腐病（Rhizoctonia solani）など

ショウガ：根茎腐敗病（Pythium ultimum、Pythium myriotylum）、白星病（Phyllosticta zingiberis）など

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

マンゴー：炭そ病（Colletotrichum aenigma）、かいよう病（Xanthomonas campestris）、軸腐病（Diaporthe pseudophoenicicola、Lasiodiplodia theobromae、Lasiodiplodia spp.、Neofusicoccum parvum、Neofusicoccum sp.）、灰色かび病（Botrytis cinerea）など

ナタネ：菌核病（Sclerotinia sclerotiorum）、根朽病（Phoma lingam）、黒斑病（Alternaria brassicae）、うどんこ病（Erysiphe cruciferarum、Erysiphe cichoracearum、Oidium matthiolae）、べと病（Peronospora para

sitica）など

コーヒー：さび病（Hemileia vastatrix）、炭疽病（Colletotrichum coffeanum）、褐眼病（Cercospora coffeicola）など

サトウキビ：褐さび病（Puccinia melanocephala）など

トウモロコシ：ひょう紋病（Gloeocercospora sorghi）、さび病（Puccinia sorghi）、南方さび病（Puccinia polysora）、黒穂病（Ustilago maydis）、ごま葉枯病（Cochliobolus heterostrophus）、すす紋病（Setosphaeria turcica）、Damping off（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）、Seedling blight（Pythium spp.、Fusarium spp.、Rhizoctonia spp.）など

ワタ：苗立枯病（Pythium sp.）、さび病（Phakopsora gossypｌｌ）、白かび病（Mycosphaerella areola）、炭疽病（Glomerella gossypｌｌ）など

ホップ：べと病（Pseudoperonospora humuli）、うどんこ病（Oidium sp.、Podosphaera macularis）、灰色かび病（Botrytis cinerea）など。

[0216] 本発明の農園芸用殺菌剤は、穀物類；野菜類；根菜類；イモ類；果樹類、茶、コーヒー、カカオなどの樹木類；牧草類；芝類；ワタなどの植物に対して用いることが好ましい。

[0217] 本発明の農園芸用殺菌剤は、植物類の各部位、たとえば、葉、茎、柄、花、蕾、果実、種子、スプラウト、根、塊茎、塊根、苗条、挿し木などに施用することができる。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）を対象とすることもできる。

[0218] 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。

[0219] 本発明の農園芸用殺菌剤は、有効成分（Ｉ）以外の他の成分を含有してもよい。他の成分としては、製剤化のために使用する公知の担体などを挙げることができる。また、他の成分として、従来公知の、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、動物用飼料など（以下、有効成分（ＩＩ）と表記することがある。）を挙げることができる。本発明の農園芸用殺菌剤は、有効成分（Ｉ）と有効成分（ＩＩ）とを含有することによって、相乗効果を奏することがある。

[0220] 本発明の農園芸用殺菌剤と混用または併用することができる、有効成分（ＩＩ）としての殺菌剤の具体例を以下に示す。

（１）核酸生合成阻害剤：

（ａ）ＲＮＡポリメラーゼI阻害剤：ベナラキシル、ベナラキシル－Ｍ、フララキシル、メタラキシル、メタラキシル－Ｍ、オキサジキシル、クロジラコン、オフレース；

（ｂ）アデノシンデアミナーゼ阻害剤：ブピリメート、ジメチリモール、エチリモール；

（ｃ）ＤＮＡ／ＲＮＡ合成阻害剤：ヒメキサゾール、オクチリノン；

（ｄ）ＤＮＡトポイソメラーゼＩＩ阻害剤：オキソリン酸；

[0221] （２）有糸核分裂阻害剤および細胞分裂阻害剤：

（ａ）β－チューブリン重合阻害剤：ベノミル、カルベンダジム、クロルフェナゾール、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファネート、チオファネートメチル、ジエトフェンカルブ、ゾキサミド、エタボキサム；

（ｂ）細胞分裂阻害剤：ペンシクロン；

（ｃ）スペクトリン様タンパク質の非局在化阻害剤：フルオピコリド、フルオピモミド；

[0222] （３）呼吸阻害剤：

（ａ）複合体Ｉ－ＮＡＤＨ酸化還元酵素阻害剤：ジフルメトリム、トルフェンピラド；

（ｂ）複合体ＩＩ－コハク酸脱水素酵素阻害剤：ベノダニル、フルトラニル、メプロニル、イソフェタミド、フルオピラム、フェンフラム、フルメシクロックス、カルボキシン、オキシカルボキシン、チフルザミド、ベンゾビンジフルピル、ビキサフェン、フルキサピロキサド、フラメトピル、イソピ

ラザム、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン、ボスカリド、ピジフルメトフェン、イソフルシプラム、ピラジフルミド、インピルフルキサム；

（ｃ）複合体ＩＩＩ－ユビキノールオキシダーゼＱｏ阻害剤：アゾキシストロビン、クモキシストロビン、クメトキシストロビン、エノキサストロビン、フルフェノキシストロビン、ピコキシストロビン、ピラオキシストロビン、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、トリクロピリカルブ、クレソキシム－メチル、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、フェナミンストロビン、メトミノストロビン、オリサストロビン、ファモキサドン、フルオキサストロビン、フェンアミドン、ピリベンカルブ、メチルテトラプロール、マンデストロビン；

（ｄ）複合体ＩＩＩ－ユビキノール還元酵素Ｑｉ阻害剤：シアゾファミド、アミスルブロム、フェンピコキサミド；

（ｅ）酸化的リン酸化の脱共役剤：ビナパクリル、メプチルジノカップ、ジノカップ、フルアジナム、フェリムゾン；

（ｆ）酸化的リン酸化阻害剤（ＡＴＰ合成酵素の阻害剤）：フェンチンアセテート、塩化フェンチン、水酸化フェンチン；

（ｇ）ＡＴＰ生産阻害剤：シルチオファム；

（ｈ）複合体ＩＩＩ：チトクロームｂｃ１（ユビキノン還元酵素）のＱｘ（未知）阻害剤：アメトクトラジン；

[0223]（４）アミノ酸およびタンパク質合成阻害剤：

（ａ）メチオニン生合成阻害剤：アンドプリム、シプロジニル、メパニピリム、ピリメタニル；

（ｂ）タンパク質合成阻害剤：ブラストサイジン－Ｓ、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩、ストレプトマイシン、オキシテトラサイクリン；

[0224]（５）シグナル伝達阻害剤：

（ａ）シグナル伝達阻害剤：キノキシフェン、プロキナジド；

（ｂ）浸透圧シグナル伝達におけるＭＡＰ・ヒスチジンキナーゼ阻害剤：

フェンピクロニル、フルジオキソニル、クロゾリネート、イプロジオン、プロシミドン、ビンクロゾリン；

[0225] （６）脂質および細胞膜合成阻害剤：

（ａ）リン脂質生合成、メチルトランスフェラーゼ阻害剤：エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン；

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

（ｃ）細胞膜に作用する剤：ヨードカルブ、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、プロパモカルブホセチレート、プロチオカルブ；

（ｄ）病原菌細胞膜を撹乱する微生物：バチルスズブチリス菌、バチルスズブチリスＱＳＴ７１３株、バチルスズブチリスＦＺＢ２４株、バチルスズブチリスＭＢＩ６００株、バチルスズブチリスＤ７４７株、バチルスアミロリクエファシエンス；

（ｅ）細胞膜を撹乱する剤：ゴセイカユプテ（ティーツリー）の抽出物；

[0226] （７）細胞膜のステロール生合成阻害剤：

（ａ）ステロール生合成におけるＣ１４位の脱メチル化阻害剤：トリホリン、ピリフェノックス、ピリソキサゾール、フェナリモル、フルルプリミドール、ヌアリモル、イマザリル、イマザリル硫酸塩、オキスポコナゾール、オキスポコナゾールフマル酸塩、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール、ビニコナゾール、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジクロブトラゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール－Ｍ、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、フルコナゾール、フルコナゾール－シス、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イプコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、フルキンコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、プロチオコナゾール、ボリコナゾール、メフェントリフル

コナゾール；

（ｂ）ステロール生合成におけるΔ１４還元酵素およびΔ８→Δ７－イソメラーゼの阻害剤：アルジモルフ、ドデモルフ、ドデモルフ酢酸塩、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミン；

（ｃ）ステロール生合成系のＣ４位脱メチル化における３－ケト還元酵素阻害剤：フェンヘキサミド、フェンピラザミン；

（ｄ）ステロール生合成系のスクワレンエポキシダーゼ阻害剤：ピリブチカルブ、ナフチフィン、テルビナフィン；

[0227]（８）細胞壁合成阻害剤：

（ａ）トレハラーゼ阻害剤：バリダマイシン；

（ｂ）キチン合成酵素阻害剤：ポリオキシン、ポリオクソリム；

（ｃ）セルロース合成酵素阻害剤：ジメトモルフ、フルモルフ、ピリモルフ、ベンチアバリカルブ、ベンチアバリカルブイソプロピル、イプロバリカルブ、バリフェナレート、マンジプロパミド；

[0228]（９）メラニン生合成阻害剤

（ａ）メラニン生合成の還元酵素阻害剤：フサライド、ピロキロン、トリシクラゾール；

（ｂ）メラニン生合成の脱水酵素阻害剤：カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル；

（ｃ）メラニン生合成のポリケタイド合成阻害剤：トルプロカルブ；

[0229]（１０）宿主植物の抵抗性誘導剤：

（ａ）サリチル酸合成経路に作用する剤：アシベンゾラル－Ｓ－メチル；

（ｂ）その他：プロベナゾール、チアジニル、イソチアニル、ジクロベンチアゾクス、イプフェントリフルコナゾール、ラミナリン、オオイタドリ抽出液、亜リン酸、亜リン酸塩；

[0230]（１１）作用性が不明な剤：シモキサニル、ホセチルアルミニウム、リン酸、リン酸塩、テクロフタラム、トリアゾキシド、フルスルファミド、ジクロ

メジン、メタスルホカルブ、シフルフェナミド、メトラフェノン、ピリオフェノン、ドジン、ドジン遊離塩基、フルチアニル；

[0231] （１２）多作用点を有する剤：銅（銅塩）、ボルドー液、水酸化銅、銅ナフタレート、酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、硫黄、硫黄製品、多硫化カルシウム、ファーバム、マンコゼブ、マネブ、マンカッパー、メチラム、ポリカーバメート、プロピネブ、チラム、ジネブ、ジラム、キャプタン、カプタホール、フォルペット、クロロタロニル、ジクロフルアニド、トリルフルアニド、グアザチン、グアザチントリアセテート（別名：イミノクタジントリアセテート）、イミノクタジントリアルベシレート、アニラジン、ジチアノン、キノメチオネート、フルオルイミド；

[0232] （１３）その他の剤：ＤＢＥＤＣ、フルオロフォルペット、グアザチンアセテート、ビス（８－キノリノラト）銅（ＩＩ）、プロパミジン、クロロピクリン、シプロフラム、アグロバクテリウム、ベトキサジン、ジフェニルアミン、メチルイソチオシアネート（ＭＩＴＣ）、ミルデオマイシン、カプサイシン、クフラネブ、シプロスルファミド、ダゾメット、デバカルブ、ジクロロフェン、ジフェンゾクワット、ジフェンゾクワットメチルスルホネート、フルメトベル、ホセチルカルシウム、ホセチルナトリウム、イルママイシン、ナタマイシン、ニトロタールイソプロピル、オキサモカルブ、ピロールニトリン、テブフロキン、トルニファニド、ザリラミド、アルゴフェーズ、アミカルチアゾール、オキサチアピプロリン、フルオキサピプロリン、メチラム亜鉛、ベンチアゾール、トリクラミド、ユニコナゾール、オキシフェンチイン、ピカルブトラゾクス、ジクロベンチアゾクス、キノフメリン、チウラム、アンバム、アグロバクテリウムラジオバクター、コニオチリウムミニタンス、シュードモナスフルオレッセンス、シュードモナスロデシア、タラロマイセスフラバス、トリコデルマアトロビリデ、非病原性エルビニアカロトボーラ、バチルスシンプレクス、バリオボラックスパラドクス、ラクトバチルスプランタラム、フロリルピコキサミド、ピラプロポイン、フルインダピル、アミノピリフェン、ピリダクロメチル、イプフルフェノキン、ジピメチ

トロン；

[0233] 本発明の農園芸用殺菌剤と混用または併用することができる、有効成分（ＩＩ）としての殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、駆虫剤などの具体例を以下に示す。

[0234] （１）アセチルコリンエステラーゼ（ＡＣｈＥ）阻害剤

（ａ）カーバメート系アセチルコリンエステラーゼ（ＡＣｈＥ）阻害剤：

アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロポキスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、ＸＭＣ、キシリルカルブ、フェノチオカルブ、ＭＩＰＣ、ＭＰＭＣ、ＭＴＭＣ、アルドキシカルブ、アリキシカルブ、アミノカルブ、ブフェンカルブ、クロエトカルブ、メタム・ナトリウム、プロメカルブ；

（ｂ）有機リン系アセチルコリンエステラーゼ（ＡＣｈＥ）阻害剤：

アセフェート、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、デメトン－Ｓ－メチル、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、ＥＰＮ、エチオン、エトプロホス、ファンフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソカルボホス、イソプロピル＝Ｏ－(メトキシアミノチオホスホリル)サリチラート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレッド、オメトエート、オキシジメトンメチル、パラチオン、パラチオンメチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホスメチル、プロフェノホス、プロ

ペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン、ブロモホス・エチル、ＢＲＰ、カルボフェノチオン、シアノフェンホス、ＣＹＡＰ、デメトン－Ｓ－メチルスルホン、ジアリホス、ジクロフェンチオン、ジオキサベンゾホス、エトリムホス、フェンスルホチオン、フルピラゾホス、ホノホス、ホルモチオン、ホスメチラン、イサゾホス、ヨードフェンホス、メタクリホス、ピリミホス－エチル、ホスホカルブ、プロパホス、プロトエート、スルプロホス；

[0235] （２）ＧＡＢＡ作動性塩化物イオン（塩素イオン）チャネルブロッカー：

アセトプロール、クロルデン、エンドスルファン、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロール、カンフェクロル、ヘプタクロル、ジエノクロル、フルフィプロル；

[0236] （３）ナトリウムチャネルモジュレーター

（ａ）ピレスロイド系ナトリウムチャネルモジュレーター：

アクリナトリン、アレスリン、ｄ－シストランス-アレスリン、ｄ－トランス－アレスリン、ビフェントリン、ビオアレスリン、ビオアレスリン－Ｓ－シクロペンテニル-異性体、ビオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、β－シフルトリン、シハロトリン、λ－シハロトリン、γ－シハロトリン、シペルメトリン、α－シペルメトリン、β－シペルメトリン、θ－シペルメトリン、ζ－シペルメトリン、シフェノトリン［（１Ｒ）－トランス異性体］、デルタメトリン、エンペントリン［（ＥＺ）－（１Ｒ）－異性体］、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、τ-フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデスリン、ペルメトリン、フェノトリン［（１Ｒ）－トランス異性体］、プラレトリン、ピレスラム、ピレトリン、レスメトリン、シラフルオフェン、テフルトリン、テトラメスリン、テトラメスリン［（１Ｒ）－異性体］、トラロメトリン、トランスフルト

リン、アレスリン、ピレトリンＩ、ピレトリンＩＩ、プロフルトリン、ジメフルトリン、ビオエタノメトリン、ビオペルメトリン、トランスペルメトリン、フェンフルトリン、フェンピリトリン、フルブロシトリネート、フルフェンプロックス、メトフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、テラレトリン、κ-ビフェントリン、クロロプラレスリン、ヘプタフルスリン、メペルフルスリン、ε-メトフルトリン、モンフルオロトリン、ε-モンフルオロトリン、κ-テフルトリン、テトラメチルフルスリン、ビオエタノメトリン；

（ｂ）ナトリウムチャネルモジュレーター（ＤＤＴ類）：

ＤＤＴ、メトキシクロル；

[0237] （４）ニコチン性アセチルコリン受容体（ｎＡＣｈＲ）競合的モジュレーター：

アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ニチアジン、チアクロプリド、チアメトキサム、ニコチン、スルホキサフロル、フルピラジフロン、トリフルメゾピリム、ジクロロメゾチアズ、フルピリミン；

（５）ニコチン性アセチルコリン受容体（ｎＡＣｈＲ）アロステリックモジュレーター：

スピネトラム、スピノサド；

（６）グルタミン酸作動性塩化物イオン（塩素イオン）チャネル（ＧｌｕＣｌ） アロステリックモジュレーター：

アバメクチン、エマメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、ミルベメクチン、イベルメクチン、セラメクチン、ドラメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、モキシデクチン、セラメクチン、ミルベマイシン、ミルベマイシンオキシム、ネマデクチン；

[0238] （７）幼若ホルモン類似剤：

ヒドロプレン、キノプレン、メトプレン、フェノキシカルブ、ピリプロキシフェン、ジオフェノラン、エポフェノナン、トリプレン；

（８）その他の非特異的（マルチサイト）阻害剤：

臭化メチル、ハロゲン化アルキル類、クロルピクリン、弗化アルミニウムナトリウム、フッ化スルフリル、ホウ砂、ホウ酸、オクタホウ酸ニナトリウム塩、ホウ酸ナトリウム塩、メタホウ酸ナトリウム塩、吐酒石、ダゾメット、メタム、メタムカリウム塩、メタムナトリウム塩；

（９）弦音器官ＴＲＰＶチャネルモジュレーター：

フロニカミド、ピメトロジン、ピリフルキナゾン、アフィドピロペン；

（１０）ダニ類成長阻害剤：

クロフェンテジン、ジフロビダジン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール；

（１１）微生物由来昆虫中腸内膜破壊剤：

バチルス・チューリンゲンシス亜種イスラエレンシ、バチルス・スファエリクス、バチルス・チューリンゲンシス亜種アイザワイ、バチルス・チューリンゲンシス亜種クルスタキ、バチルス・チューリンゲンシス亜種テネブリオニス、B.t.作物に含まれるタンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1；Bacillus sphaericus；

[0239] （１２）ミトコンドリアＡＴＰ合成酵素阻害剤：

ジアフェンチウロン、アゾシクロチン、シヘキサチン、酸化フェンブタズ、プロパルギット、テトラジホン；

（１３）プロトン勾配を撹乱する酸化的リン酸化脱共役剤：

クロルフェナピル、ＤＮＯＣ、スルフルラミド、ビナパクリル、ジノブトン、ジノカップ；

（１４）ニコチン性アセチルコリン受容体（ｎＡＣｈＲ）チャネルブロッカー：

ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、ネライストキシン、チオシクラム、チオスルタップ－ナトリウム塩；

（１５）キチン生合成阻害剤、タイプ０：

ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ブプロフェジン、フルアズロン；

（１６）キチン生合成阻害剤、タイプ１：

ブプロフェジン；

（１７）脱皮阻害剤：

シロマジン；

（１８）脱皮ホルモン（エクダイソン）受容体アゴニスト：

クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；

[0240]（１９）オクトパミン受容体アゴニスト：

アミトラズ、デミジトラズ、クロルジメホルム；

（２０）ミトコンドリア電子伝達系複合体ＩＩＩ阻害剤：

ヒドラメチルノン、アセキノシル、フルアクリピリム、ビフェナゼート；

（２１）ミトコンドリア電子伝達系複合体Ｉ阻害剤（ＭＥＴＩ）：

フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリダベン、ピリミジフェン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、ロテノン；

（２２）電位依存性ナトリウムチャネルブロッカー：

インドキサカルブ、メタフルミゾン；

（２３）アセチルＣｏＡカルボキシラーゼ阻害剤：

スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スピロピジオン；

（２４）ミトコンドリア電子伝達系複合体ＩＶ阻害剤：

リン化アルミニウム、リン化カルシウム、リン化亜鉛、ホスフィン、シアニド、シアン化カルシウム、シアン化ナトリウム、シアン化カリウム；

（２５）ミトコンドリア電子伝達系複合体ＩＩ阻害剤：

シエノピラフェン、シフルメトフェン、ピフルブミド；

[0241]（２８）リアノジン受容体モジュレーター：

クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、フルベンジアミド、シハロジアミド、テトラクロラントラニリプロール、テトラニリプロール；

（２９）弦音器官モジュレーター標的部位未特定：

フロニカミド；

（３０）ＧＡＢＡ作動性塩化物イオン（塩素イオン）チャネルアロステリックモジュレーター：

ブロフラニリド、フルキサメタミド、イソシクロセラム、アフォキソラネル、フルララネル、ロチネラル、サロラネル；

（３１）その他の殺虫剤、殺ダニ剤：

アザジラクチン、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、ブロモプロピレート、キノメチオナート、クリオライト、ジコホル、石灰硫黄合剤、マンコゼブ、ピリダリル、ベンクロチアズ、硫黄、アミドフルメット、１，３－ジクロロプロペン、ＤＣＩＰ、フェニソブロモレート、ベンゾメート、メタアルデヒド、クロルベンジレート、クロチアゾベン、ジシクラニル、フェノキサクリム、フェントリファニル、フルベンジミン、フルフェナジン、ゴシップルア、ジャポニルア、メトキサジアゾン、石油（ｏｉｌ）、オレイン酸カリウム、テトラスル、トリアラセン、アフィドピロペン、フルフィプロル、フルエンスルホン、メペルフルスリン、テトラメチルフルスリン、トラロピリル、ジメフルスリン、メチルネオデカンアミド、フルララネル、アフォキソラネル、フルキサメタミド、５－［５－（３，５－ジクロロフェニル）－５－トリフルオロメチル－４，５－ジヒドロイソオキサゾール－３－イル］－２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ベンゾニトリル（ＣＡＳ：９４３１３７－４９－３）、ブロフラニリド、その他のメタジアミド類、スタイナーネマカーポカプサエ、スタイナーネマグラセライ、パスツーリアペネトランス、ペキロマイセステヌイペス、ペキロマイセスフモソロセウス、ボーベリアバシアーナ、ボーベリアブロンニアティ、メタリジウムアニ

ソプリエ、バーティシリウムレカニ、アシノナピル、ベンズピリモキサン、フロメトキン、フルヘキサホン、オキサゾスルフィル、チクロピラゾフロル。

[0242] （３２）駆虫剤：

（ａ）ベンズイミダゾール系 ： フェンベンダゾール、アルベンダゾール、トリクラベンダゾール、オキシベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、パーベンダゾール、フルベンダゾール、フェバンテル、ネトビミン、チオファネート、チアベンダゾール、カンベンダゾール；

（ｂ）サリチルアニリド系 ： クロサンテル、オキシクロザニド、ラフォキサニド、ニクロサミド；

（ｃ）置換フェノール系 ： ニトロキシニル、ニトロスカネート；

（ｄ）ピリミジン系 ： ピランテル、モランテル；

（ｅ）イミダゾチアゾール系 ： レバミソール、テトラミソール；

（ｆ）テトラヒドロピリミジン系 ： プラジカンテル、エプシプランテル；

（ｇ）その他の駆虫薬 ： シクロジエン、リアニア、クロルスロン、メトロニダゾール、デミジトラズ、ピペラジン、ジエチルカルバマジン、ジクロロフェン、モネパンテル、トリベンジミジン、アミダンテル、チアセタルサミド、メラルソミン、アルセナマイド。

[0243] 本発明の農園芸用殺菌剤と混用または併用することができる、有効成分（ＩＩ）としての植物調節剤の具体例を以下に示す。

アブシジン酸、カイネチン、ベンジルアミノプリン、１，３－ジフェニルウレア、ホルクロルフェヌロン、チジアズロン、クロルフェヌロン、ジヒドロゼアチン、ジベレリンＡ、ジベレリンＡ４、ジベレリンＡ７、ジベレリンＡ３、１－メチルシクロプロパン、Ｎ－アセチルアミノエトキシビニルグリシン（別名：アビグリシン）、アミノオキシ酢酸、硝酸銀、塩化コバルト、ＩＡＡ、４－ＣＰＡ、クロプロップ、２，４－Ｄ、ＭＣＰＢ、インドール－３－酪酸、ジクロルプロップ、フェノチオール、１－ナフチルアセトアミド

、エチクロゼート、クロキシホナック、マレイン酸ヒドラジド、２，３，５－トリヨード安息香酸、サリチル酸、サリチル酸メチル、(-)－ジャスモン酸、ジャスモン酸メチル、（＋）－ストリゴール、（＋）－デオキシストリゴール、（＋）－オロバンコール、（＋）－ソルゴラクトン、４－オキソ－４－(２－フェニルエチル)アミノ酪酸、エテホン、クロルメコート、メピコートクロリド、ベンジルアデニン、５－アミノレブリン酸、ダミノジッド。

[0244] {製剤処方}

本発明の農園芸用殺菌剤は、剤型によって特に限定されない。たとえば、水和剤、乳剤、粉剤、粒剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、錠剤などの剤型を挙げることができる。製剤への調製方法は、特に制限されず、剤形に応じて公知の調製方法を採用することができる。

[0245] 以下に、製剤実施例を若干示す。なお、以下に示す製剤処方は単なる例示であり、本発明の主旨に反しない範囲で修正することができ、本発明は以下の製剤例によって何ら制限されるものではない。「部」は特段の断りが無い限り「質量部」を意味する。

[0246] （製剤例１：水和剤）

本発明のヒドラジド化合物４０部、珪藻土５３部、高級アルコール硫酸エステル４部、およびアルキルナフタレンスルホン酸塩３部を均一に混合し、次いで微細に粉砕して、有効成分４０質量％の水和剤を得る。

[0247] （製剤例２：乳剤）

本発明のヒドラジド化合物３０部、キシレン３３部、ジメチルホルムアミド３０部、およびポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル７部を混合し、溶解させて、有効成分３０質量％の乳剤を得る。

[0248] （製剤例３：粒剤）

本発明のヒドラジド化合物５部、タルク４０部、クレー３８部、ベントナイト１０部、およびアルキル硫酸ソーダ７部を均一に混合し、次いで微細に粉砕し、その後、粒子直径０．５～１．０ｍｍに造粒して、有効成分５質量％の粒剤を得る。

[0249] （製剤例４：粒剤）

本発明のヒドラジド化合物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、およびリン酸カリウム１部を均一に混合し、粉砕し、次いでこれに水を加え、混練する。その後、造粒し、乾燥させて、有効成分５質量％の粒剤を得る。

[0250] （製剤例５：懸濁剤）

本発明のヒドラジド化合物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、および水７３．８部を混合し、粒度が３ミクロン以下になるまで湿式粉砕し、有効成分１０質量％の懸濁剤を得る。

[0251] （製剤例６：顆粒水和剤）

本発明のヒドラジド化合物４０部、クレー３６部、塩化カリウム１０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、および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部を均一に混合し、微細に粉砕する。次いでこれに適量の水を加えて、混練し粘土状にする。粘土状物を造粒し、その後、乾燥させて、有効成分４０質量％の顆粒水和剤を得る。

[0252] 次に、化合物製造例を示し、本発明をより具体的に説明する。ただし、本発明は以下の実施例によって何ら制限されるものではない。

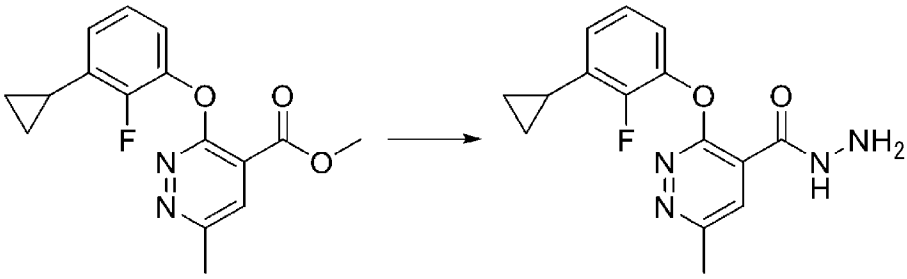
[0253] 〔製造例１〕

以下の工程にて、N'-アセチル-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジル)-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：N'-acetyl-3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide（化合物b-5））を製造した。

[0254] 工程１　：　3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide）への転化

[0255]

[化37]

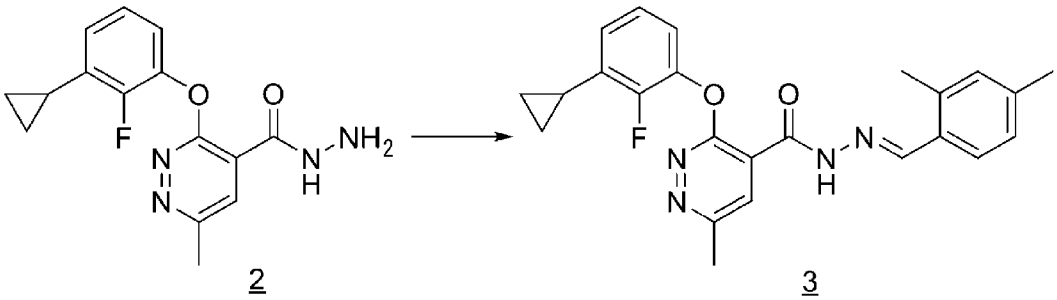


1 2

[0256] 化合物1（1.1ｇ）をテトラヒドロフラン（12mL）に溶解させた。これに、室温下、ヒドラジン一水和物（0.6ｇ）およびジアザビシクロウンデセン（0.3mL）を加え、室温下5時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物2（1.2ｇ、収率92%）を得た。

[0257] 工程２ ： (E)-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジリデン)-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：(E)-3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzylidene)-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide）への転化

[0258] [化38]



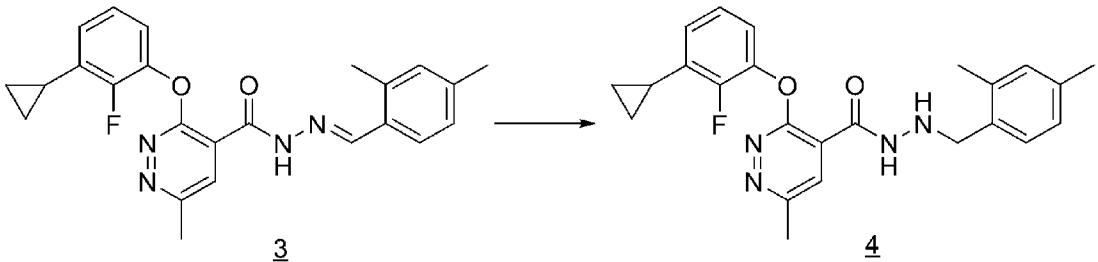
2 3

[0259] 化合物2（1.2ｇ）をエタノール（12mL）に溶解させた。これに、室温下で2,4-ジメチルベンズアルデヒド（0.78ｇ）を加え、加熱還流下で2時間撹拌した。次いで、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合

物3（1.2ｇ、収率72%）を得た。

[0260] 工程３　：　3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジル)-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide）への転化

[0261] [化39]

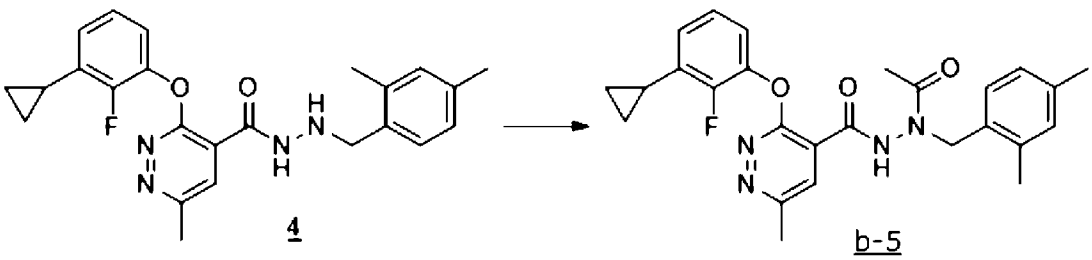


3　　4

[0262]　化合物3（0.36ｇ）をテトラヒドロフラン（4mL）と酢酸（1.1mL）に溶解させた。これに、０℃でシアノ水素化ホウ素ナトリウム（1.1ｇ）を加え、室温下で2時間撹拌した。得られた液を炭酸ナトリウム水溶液に注加した。次いで、これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物4（0.24ｇ、収率67%）を得た。

[0263] 工程４　：　N'-アセチル-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジル)-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：N'-acetyl-3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide）への転化

[0264] [化40]



4　　b-5

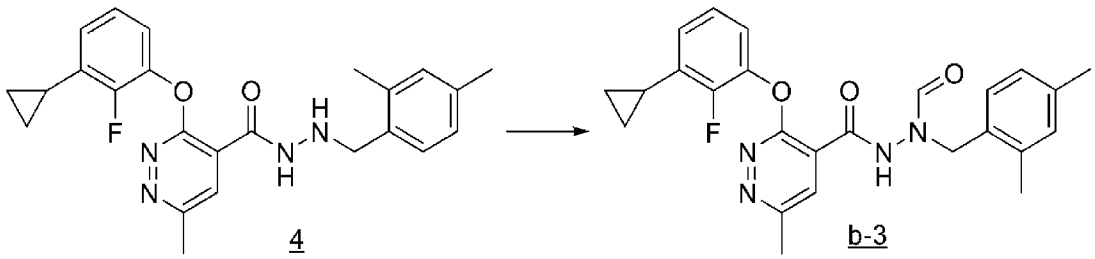
[0265] 化合物4（0.05ｇ）をクロロホルム（1mL）に溶解させた。これに、0℃で酢酸（0.008mL）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.05g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.04mL）を加え室温下18時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-5（0.027ｇ、収率49%）を得た。

[0266] 〔製造例２〕

以下の工程にて、3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジル)- N'-ホルミル-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-N'-formyl-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide（化合物b-3））を製造した。

[0267] 工程１ ： 3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジル)- N'-ホルミル-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-N'-formyl-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide）への転化

[0268] [化41]



[0269] 化合物4（0.07ｇ）をクロロホルム（1mL）に溶解させた。これに、0℃でギ酸（0.01mL）、およびカルボニルジイミダゾール（0.042g）を加え室温下で2時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）

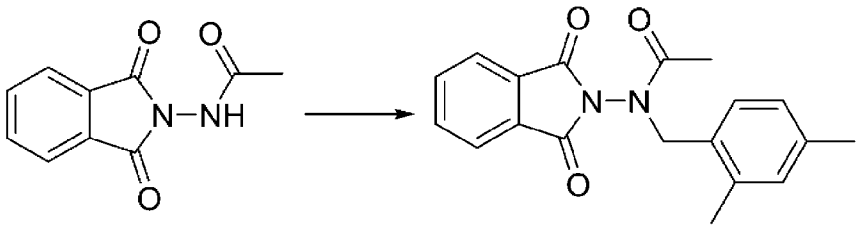
で精製し、化合物b-3（0.045ｇ、収率60％）を得た。

[0270] 〔製造例３〕

以下の工程にて、N'-アセチル-5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジル)-2-メチルイソニコチノヒドラジド（英名：N'-acetyl-5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-2-methylisonicotinohydrazide（化合物b-9））を製造した。

[0271] 工程１　：　N-(2,4-ジメチルベンジル)-N-(1,3-ジオキソイソインドリン-2-イル)アセタミド（英名：N-(2,4-dimethylbenzyl)-N-(1,3-dioxoisoindolin-2-yl)acetamide）への転化

[0272] [化42]



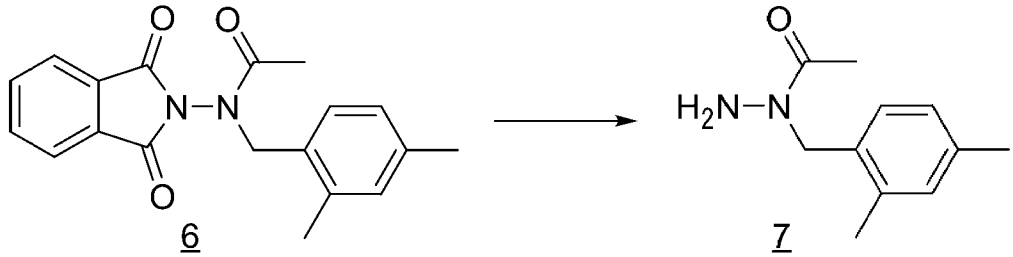
5　　6

[0273] 化合物5（0.6ｇ）をアセトニトリル（3mL）に溶解させた。これに、室温下、炭酸カリウム（0.3ｇ）およびベンジルトリエチルアンモニウムクロリド（0.07ｇ）を加え８０℃で2時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物6（0.36ｇ、収率38％）を得た。

[0274] 工程２　：　N-(2,4-ジメチルベンジル)アセトヒドラジド（英名：N-(2,4-dimethylbenzyl)acetohydrazide）への転化

[0275]

[化43]

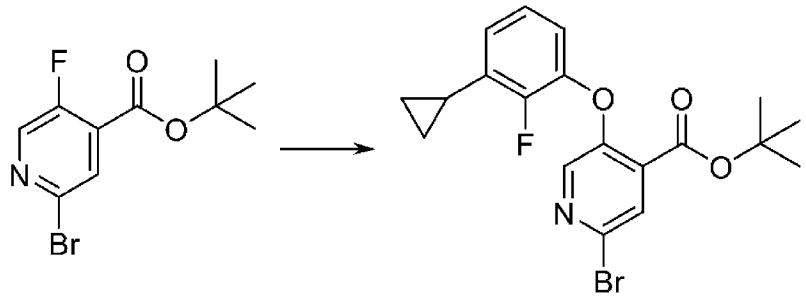


6 7

[0276] 化合物6（0.3ｇ）をエタノール（3mL）に溶解させた。これに、室温下、ヒドラジン一水和物（0.22mL）を加え５０℃で１時間撹拌した。得られた液をろ過し、ろ液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去して、化合物7（0.17ｇ、収率99%）を得た。

[0277] 工程３ ： tert-ブチル 2-ブロモ-5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)イソニコチネート（英名：tert-butyl 2-bromo-5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)isonicotinate）への転化

[0278] [化44]

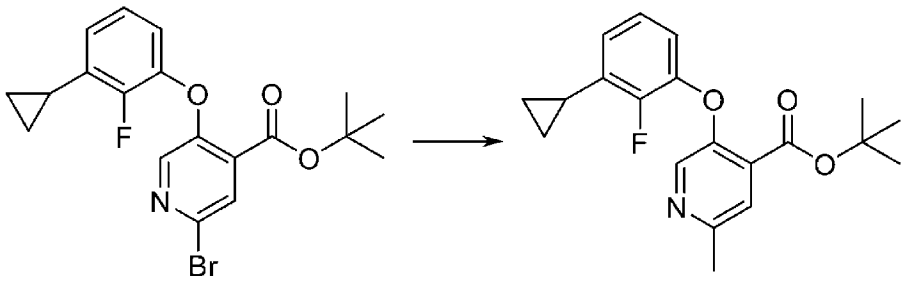


8 9

[0279] 化合物8（5.7ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（120mL）に溶解させた。これに、室温下、3-シクロプロピル-2-フルオロフェノール（5.5ｇ）および炭酸カリウム（6.1ｇ）を加え５０℃で３時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物9（7.1ｇ、収率84%）を得た。

[0280] 工程４　：　tert-ブチル 5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-2-メチルイソニコチネート（英名：tert-butyl 5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-2-methylisonicotinate）への転化

[0281] [化45]

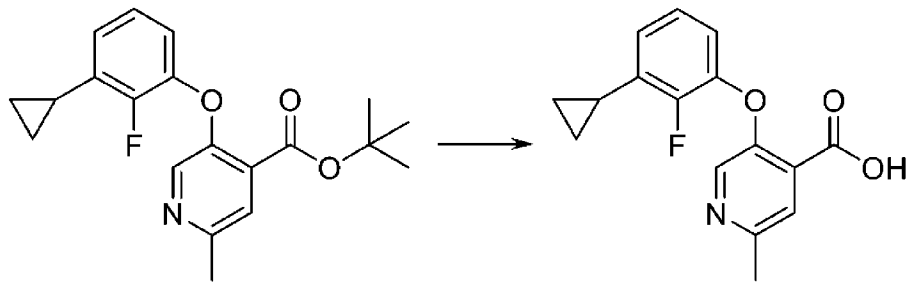


9　　10

[0282]　化合物9（7.1ｇ）を1,4-ジオキサン（100mL）に溶解させた。これに、室温下、トリメチルボロキシン（3.5ｇ）、1,1'-ビス[(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム（ＩＩ）　(0.75ｇ）および炭酸カリウム（5.6ｇ）を加え、加熱還流下で１８時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物10（4.1ｇ、収率69%）を得た。

[0283] 工程５　：　5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-2-メチルイソニコチン酸（英名：5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-2-methylisonicotinic acid）への転化

[0284] [化46]

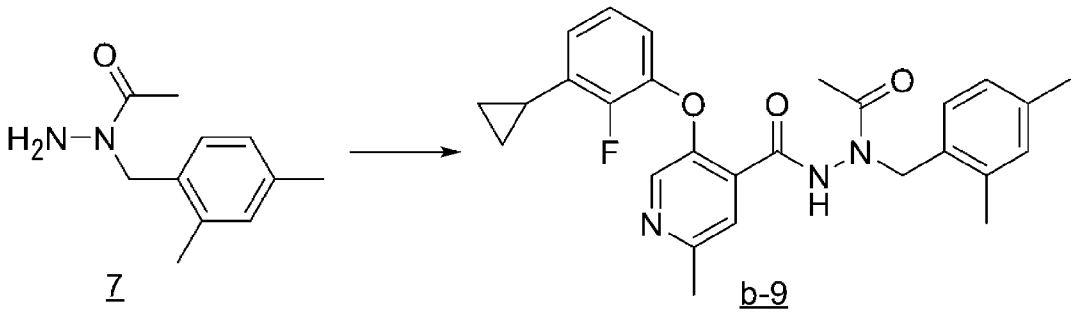


10　　11

[0285] 化合物10（4.1ｇ）をジクロロメタン（20mL）に溶解させた。これに、室温下、トリフルオロ酢酸（20mL）を加え室温下で１８時間撹拌した。溶媒を減圧下で留去し化合物11（3.0ｇ、収率89%）を得た。

[0286] 工程６ ： N'-アセチル-5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N'-(2,4-ジメチルベンジル)-2-メチルイソニコチノヒドラジド（英名：N'-acetyl-5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-2-methylisonicotinohydrazide）への転化

[0287] [化47]



7 b-9

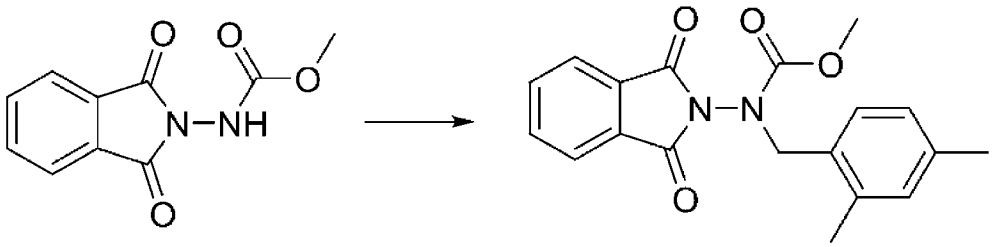
[0288] 化合物7（0.03ｇ）をジクロロメタン（1mL）に溶解させた。これに、化合物11（0.065ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.05g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.04mL）を加え、室温下で18時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-9（0.015ｇ、収率14%）を得た。

[0289] 〔製造例４〕

以下の工程にて、メチル 2-(3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-6））を製造した。

[0290] 工程１　：　methyl (2,4-ジメチルベンジル)(1,3-ジオキソイソインドリン-2-イル)カーバメート（英名：methyl (2,4-dimethylbenzyl)(1,3-dioxoisoindolin-2-yl)carbamate）への転化

[0291] [化48]

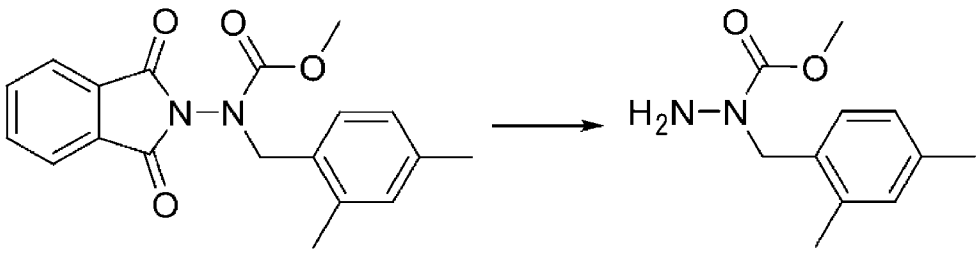


12　　13

[0292]　化合物12（0.5ｇ）をアセトニトリル（3mL）に溶解させた。これに、室温下、炭酸カリウム（0.3ｇ）およびベンジルトリエチルアンモニウムクロリド（0.07ｇ）を加え８０℃で2時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物13（0.4ｇ、収率51%）を得た。

[0293] 工程２　：　メチル 1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0294] [化49]



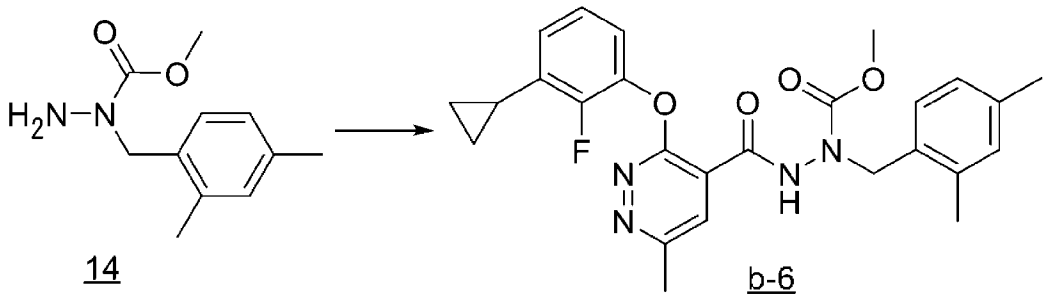
13　　14

[0295]　化合物13（0.3ｇ）をエタノール（3mL）に溶解させた。これに、室温下、ヒドラジン一水和物（0.22mL）を加え５０℃で１時間撹拌した。固体をろ過

した溶液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去して化合物14（0.17ｇ、収率98%）を得た。

[0296] 工程３　：　メチル 2-(3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0297] [化50]



14　　b-6

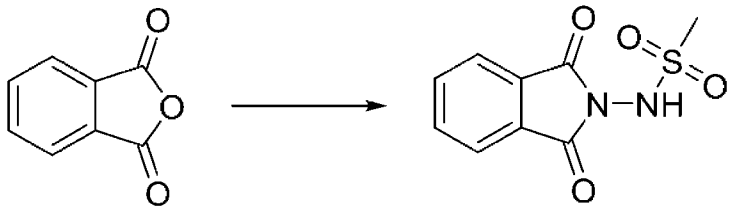
[0298]　化合物14（0.035ｇ）をジクロロメタン（1mL）に溶解させた。これに、０℃で3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボン酸（0.04ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.04g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.04mL）を加え、室温下で18時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-6（0.05ｇ、収率75%）を得た。

[0299] 〔製造例５〕

以下の工程にて、N'-(3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-N-(2,4-ジメチルベンジル)メタンスルホノヒドラジド（化合物b-26）を製造した。

[0300] 工程１　：　N-(1,3-ジオキソイソインドリン-2-イル）メタンスルホンアミド（英名：N-(1,3-dioxoisoindolin-2-yl)methanesulfonamide）への転化

[0301] [化51]

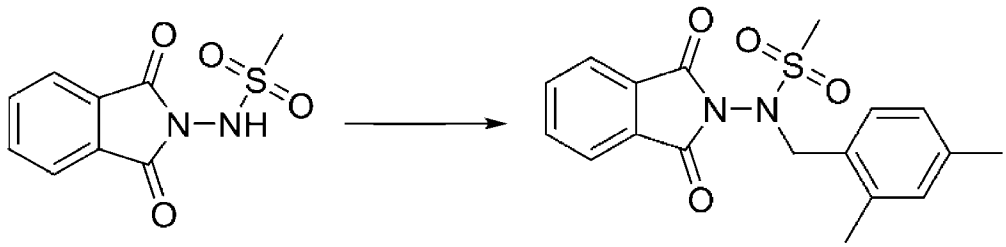


15 16

[0302] 化合物15（0.53ｇ）をテトラヒドロフラン（18mL）に溶解させた。これに、室温下、メタンスルホニルヒドラジン（0.4ｇ）を加え室温下で１時間撹拌した。その後、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド（0.9ｇ）を加え室温下で2時間撹拌した。これに酢酸（0.4mL）およびトリエチルアミン（1mL）を加え加熱還流下で2時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、化合物16（0.5ｇ、収率39%）を得た。

[0303] 工程２ ： N-（2, 4-ジメチルベンジル）-N-（1, 3-ジオキソインドリン-2-イル）メタンスルホンアミド（英名：N-(2,4-dimethylbenzyl)-N-(1,3-dioxoisoindolin-2-yl)methanesulfonamide）への転化

[0304] [化52]

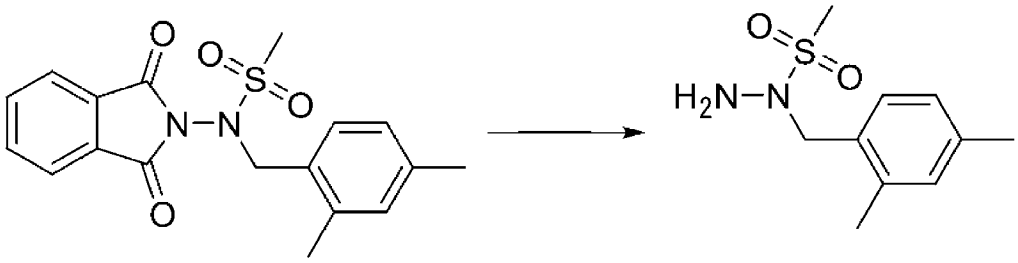


16 17

[0305] 化合物16（0.45ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（3mL）に溶解させた。これに、室温下、炭酸カリウム（1.1ｇ）および2, 4-ジメチルベンジルブロミド（0.6ｇ）を加え50℃で5時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物17（0.22ｇ、収率33%）を得た。

[0306] 工程３　：　N-（2, 4-ジメチルベンジル）メタンスルホノヒドラジド（英名：N-(2,4-dimethylbenzyl)methanesulfonohydrazide）への転化

[0307] [化53]

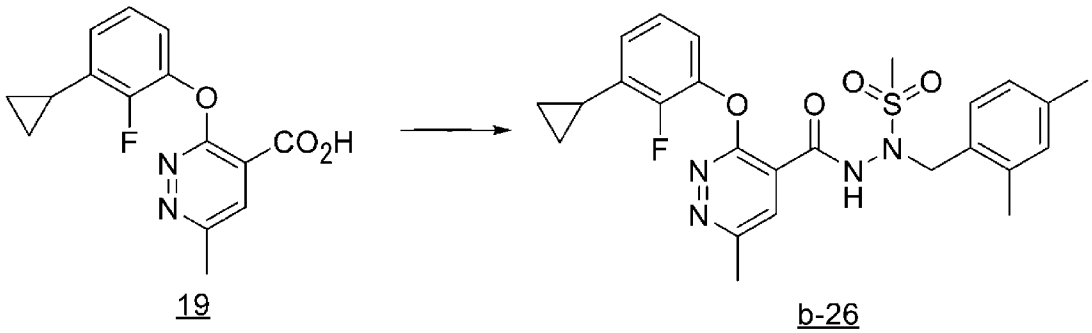


17　　18

[0308]　化合物17（0.22ｇ）をエタノール（6mL）に溶解させた。これに、室温下、ヒドラジン一水和物（0.2mL）を加え50℃で1時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し化合物18（0.15ｇ、収率94%）を得た。

[0309] 工程４　：　N'-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボニル）-N-（2, 4-ジメチルベンジル）メタンスルホノヒドラジド（英名：N'-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-N-(2,4-dimethylbenzyl)methanesulfonohydrazide）への転化

[0310] [化54]



19　　b-26

[0311]　化合物19（0.38ｇ）をジクロロメタン（1mL）に溶解させた。これに、オキサリルクロリド（0.36 mL）およびN,N-ジメチルホルムアミド（0.1 mL）を加え室温下で2時間撹拌した。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をジクロロメタン（1mL）に溶解させた。これに、室温下、化合物18（0.15ｇ）および炭

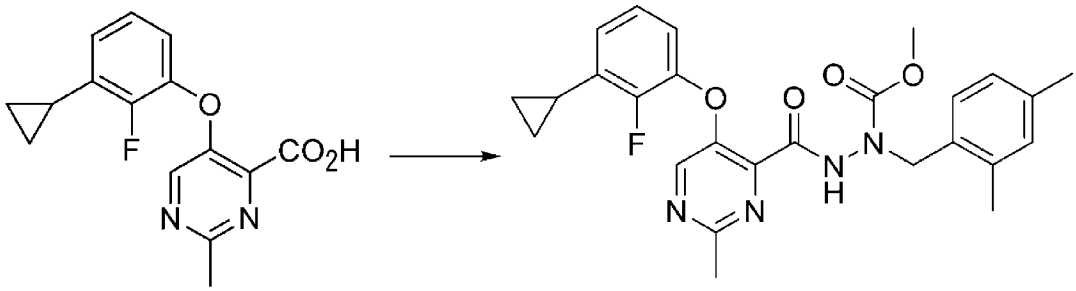
酸セシウム（0.5ｇ）を加え室温下で2時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-26（0.03ｇ、収率9%）を得た。

[0312] 〔製造例６〕

以下の工程にて、メチル 2-（5-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-2-メチルピリミジン-4-カルボニル）-1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシラート（英名：methyl 2-(5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-2-methylpyrimidine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate

（化合物b-42））を製造した。

[0313] [化55]



20 b-42

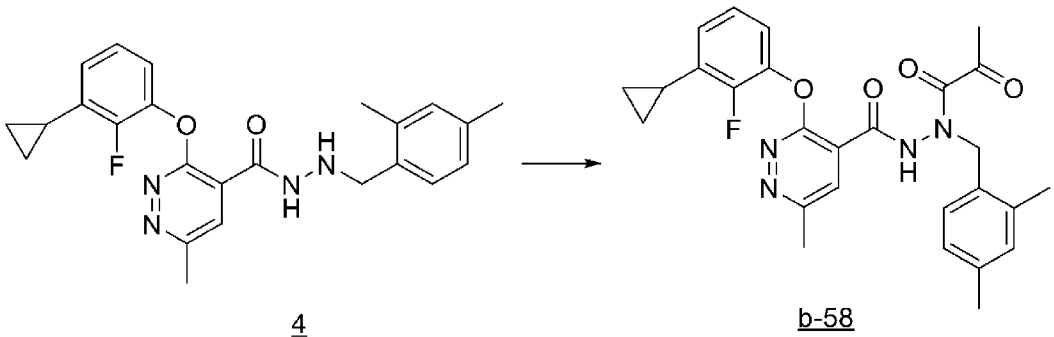
[0314] 化合物20（0.08ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、化合物14（0.092ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.09g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.1mL）を加え室温下で18時間撹拌した。得られた液にメタノールを加え、分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-42（0.061ｇ、収率43%）を得た。

[0315] 〔製造例７〕

以下の工程にて、3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-N'-（2, 4-ジメチルベンジル）-6-メチル-N'-（2-オキソプロパノイル）ピリダジン

-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-6-methyl-N'-(2-oxopropanoyl)pyridazine-4-carbohydrazide（化合物b-58））を製造した。

[0316] [化56]



4 b-58

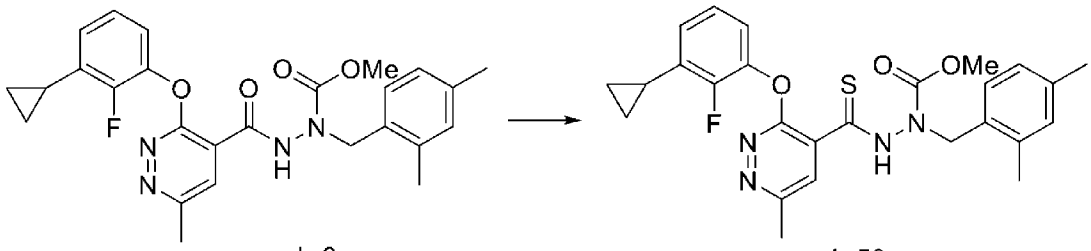
[0317] 化合物4（0.08ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、ピルビン酸（0.04ｇ）、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスファート（0.17g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.1mL）を加え室温下で18時間撹拌した。得られた液にメタノールを加え、分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-58（0.014ｇ、収率10%）を得た。

[0318] 〔製造例８〕

以下の工程にて、メチル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボノチオイル）-1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonothioyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-59））を製造した。

[0319]

[化57]



b-6 b-59

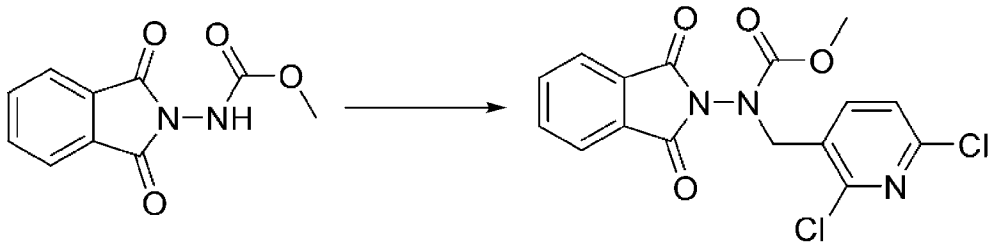
[0320] 化合物b-6（0.02ｇ）を1,4－ジオキサン（1mL）に溶解させた。これに、ローソン試薬（0.02ｇ）を加え80℃で18時間撹拌した。溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-59（0.005ｇ、収率23%）を得た。

[0321] 〔製造例９〕

以下の工程にて、メチル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボニル）-1-（（2, 6-ジクロロピリジン-3-イル）メチル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（化合物b-93）を製造した。

[0322] 工程1 ： メチル（（2, 6-ジクロロピリジン-3-イル）メチル）（1, 3-ジオキソインドリン-2-イル）カ-バメート（英名：methyl ((2,6-dichloropyridin-3-yl)methyl)(1,3-dioxoisoindolin-2-yl)carbamate）への転化

[0323] [化58]



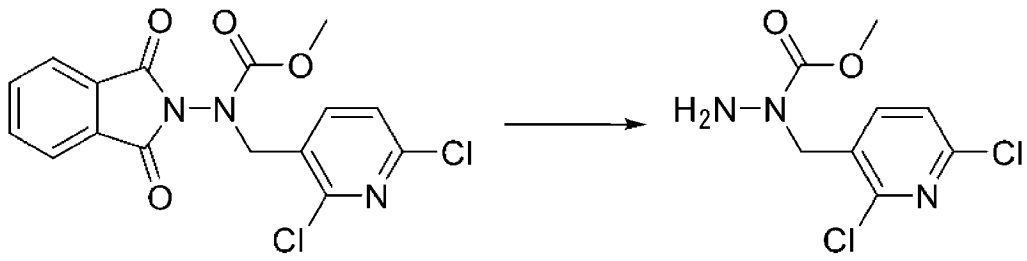
22 23

[0324] 化合物22（0.55ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（7mL）に溶解させた。これに、室温下、炭酸セシウム（1.6ｇ）および2,6-ジクロロ-3-(クロロメチル)ピリジン（0.5ｇ）を加え室温下で5時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。

溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物23（0.4ｇ、収率43%）を得た。

[0325] 工程２　：　メチル 1-（（2, 6-ジクロロピリジン-3-イル）メチル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 1-((2,6-dichloropyridin-3-yl)methyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0326] [化59]

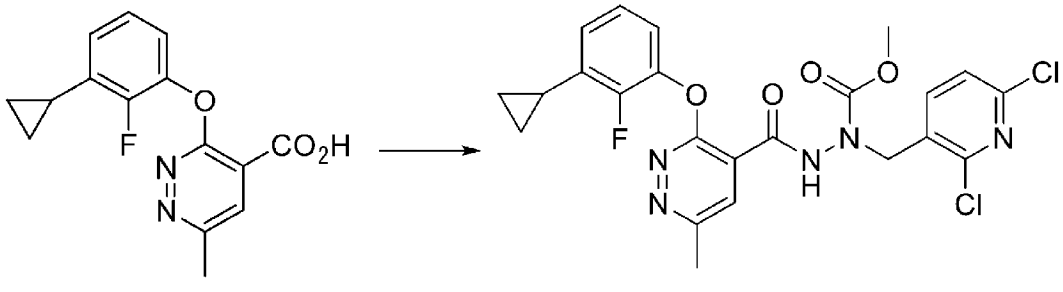


23　　24

[0327]　化合物23（0.4ｇ）をエタノール（3mL）に溶解させた。これに、室温下、ヒドラジン一水和物（0.25mL）を加え室温下で１8時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し化合物24（0.19ｇ、収率72%）を得た。

[0328] 工程３　：　メチル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボニル）-1-（（2, 6-ジクロロピリジン-3-イル）メチル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-((2,6-dichloropyridin-3-yl)methyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0329] [化60]



19　　b-93

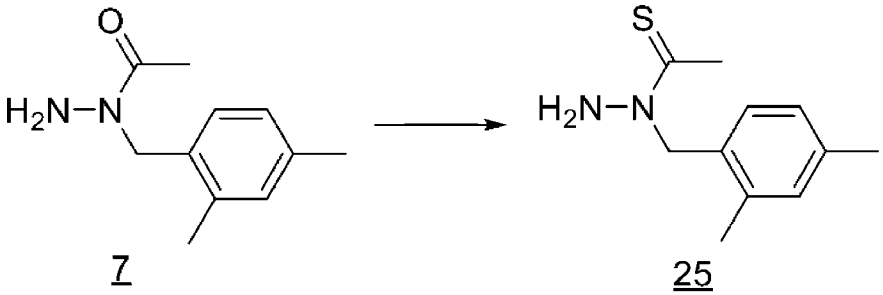
[0330] 化合物19（0.05ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、化合物24（0.092ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.09g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.1mL）を加え室温下で18時間撹拌した。得られた液にメタノールを加え、分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-93（0.043ｇ、収率48%）を得た。

[0331] 〔製造例１０〕

以下の工程にて、3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-N'-（2, 4-ジメチルベンジル）-N'-エタンチオイル-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-N'-ethanethioyl-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide（化合物b-66））を製造した。

[0332] 工程１ ： N-（2, 4-ジメチルベンジル）エタンチオヒドラジド（英名：N-(2,4-dimethylbenzyl)ethanethiohydrazide）への転化

[0333] [化61]



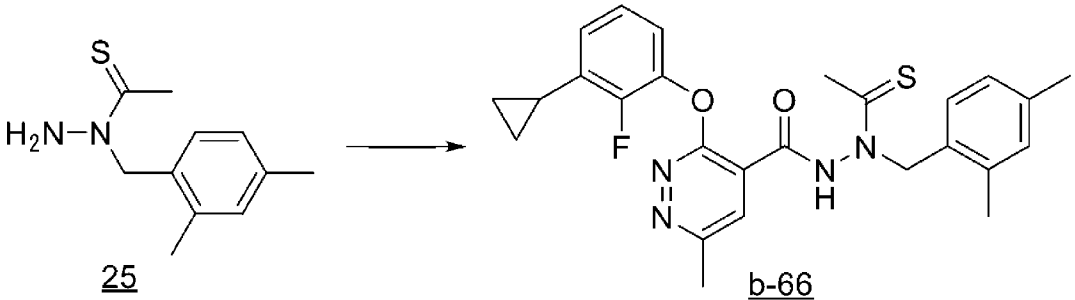
7 25

[0334] 化合物7（0.14ｇ）をジオキサン（5mL）に溶解させた。これに、室温下、ローソン試薬（0.15ｇ）を加え50℃で1時間撹拌した。その後、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物25（0.04ｇ、収率59%）を得た。

[0335] 工程２ ： 3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-N'-（2, 4-ジメチルベンジル）-N'-エタンチオイル-6-メチルピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)

-N'-ethanethioyl-6-methylpyridazine-4-carbohydrazide）への転化

[0336] [化62]



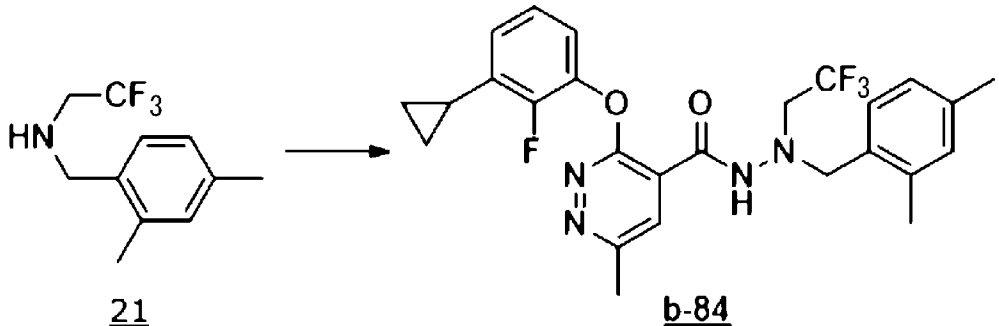
25 b-66

[0337] 化合物25（0.035ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、０℃で化合物19（0.08ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.08g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.09mL）を加え室温下で18時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-66（0.026ｇ、収率20%）を得た。

[0338] 〔製造例１１〕

以下の工程にて、3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-N'-（2, 4-ジメチルベンジル）-6-メチル-N'-（2, 2, 2-トリフルオロエチル）ピリダジン-4-カルボヒドラジド（英名：3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-N'-(2,4-dimethylbenzyl)-6-methyl-N'-(2,2,2-trifluoroethyl)pyridazine-4-carbohydrazide（化合物b-84））を製造した。

[0339] [化63]



21 b-84

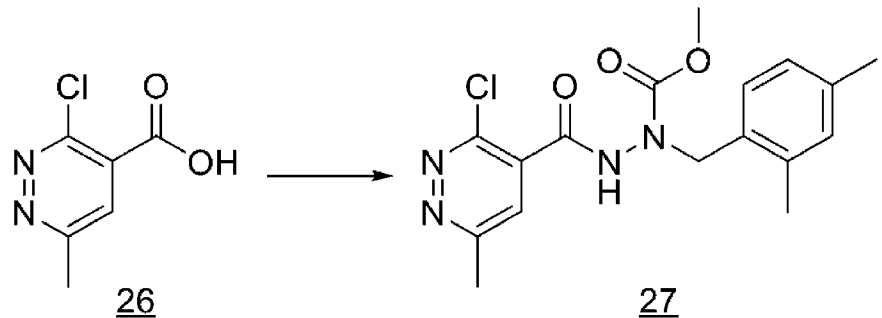
[0340] 化合物21（0.05ｇ）をジクロロメタン（1mL）に溶解させた。これに、室温下、O-メシチレンスルホニルヒドロキシルアミン-ジクロロメタン溶液（0.23mL）を加え室温下で18時間撹拌した。溶媒を減圧下で留去し、残渣をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、化合物19（0.05ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.05g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.06mL）を０℃で加え室温下で18時間撹拌した。得られた液にメタノールを加え、分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-84（0.01ｇ、収率9%）を得た。

[0341] 〔製造例１２〕

以下の工程にて、メチル2-(3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl2-(3-(3-chloro-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-23））を製造した。

[0342] 工程１：メチル2-(3-クロロ-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl2-(3-chloro-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0343] [化64]

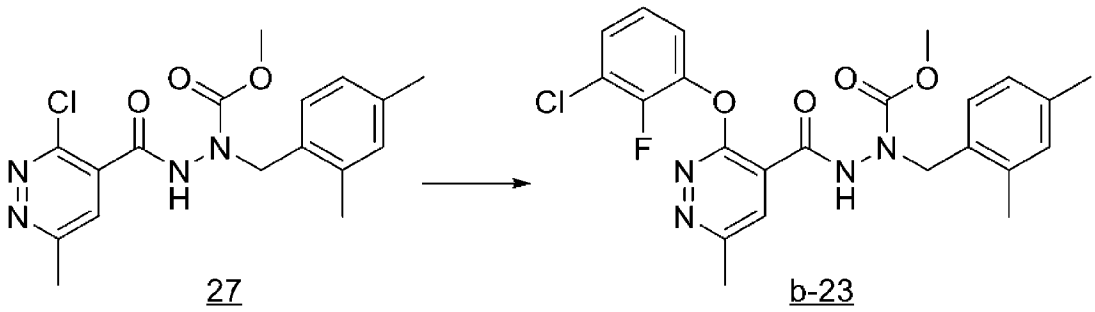


[0344] 化合物26（0.13ｇ）と化合物14（0.17ｇ）をテトラヒドロフラン（2.2ml）に溶解させ、プロピルホスホン酸無水物（50%酢酸エチル溶液）（0.62ml）お

よびN,N-ジイソプロピルエチルアミン（0.62ml）を加え、室温にて3時間撹拌した。得られた液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。その後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物27（0.18g、収率63%）を得た。

[0345] 工程２：メチル2-(3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl2-(3-(3-chloro-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0346] [化65]



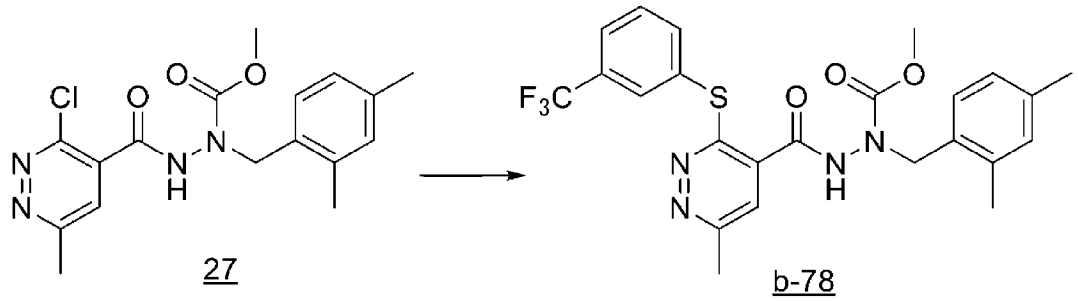
[0347] 化合物27（0.120ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1.10ml）に溶解させ、3-クロロ-2-フルオロフェノール （0.13ml）を加え100℃で22時間撹拌した。得られた液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-23（0.060ｇ、収率38%）を得た。

[0348] 〔製造例１３〕

以下の工程にて、メチル 1-(2,4-ジメチルベンジル)-2-(6-メチル-3-((3-(トリフルオロメチル)フェニル)チオ)ピリダジン-4-カルボニル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl1-(2,4-dimethylbenzyl)-2-(6-methyl-3-((3-(trifluoromethyl)phenyl)thio)pyridazine-4-carbonyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-78））を製造した。

[0349]

[化66]



27 b-78

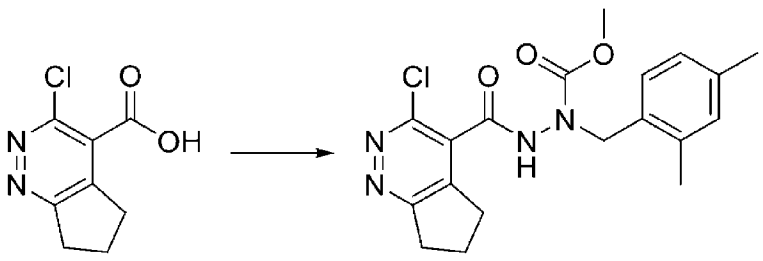
[0350] 化合物27（0.150ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1.40ml）に溶解させ、これに3-(トリフルオロメチル)チオフェノール（0.147g）を加え120℃で17時間撹拌した。得られた液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-78（0.167ｇ、収率80%）を得た。

[0351] 〔製造例１４〕

以下の工程にて、メチル2-(3-(3-ブロモ-2-フルオロフェノキシ)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl 2-(3-(3-bromo-2-fluorophenoxy)-6,7-dihydro-5H-cyclopenta[c]pyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-92））を製造した。

[0352] 工程１：メチル2-(3-クロロ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl2-(3-chloro-6,7-dihydro-5H-cyclopenta[c]pyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0353] [化67]

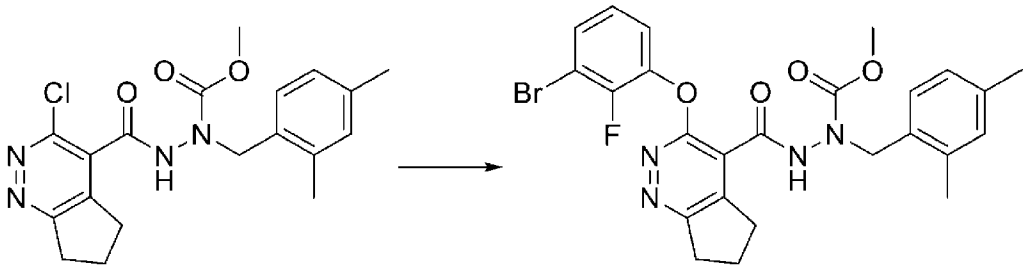


28 29

[0354] 化合物28（0.100ｇ）と化合物14（0.110ｇ）をテトラヒドロフラン（1.70ml）に溶解させ、これにプロピルホスホン酸無水物（50%酢酸エチル溶液）（0.416ml）とN,N-ジイソプロピルエチルアミン（0.897ml）を加え、室温にて16時間撹拌した。得られた液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。その後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物29（0.085g、収率43%）を得た。

[0355] 工程２：メチル2-(3-(3-ブロモ-2-フルオロフェノキシ)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl2-(3-(3-bromo-2-fluorophenoxy)-6,7-dihydro-5H-cyclopenta[c]pyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0356] [化68]



29 b-92

[0357] 化合物29（0.085ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（0.730ml）に溶解させ、これに3-ブロモ-2-フルオロフェノール（0.084g）を加え、120℃で21時間撹拌した。得られた液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-92（0.031ｇ、収率26%）を得た。

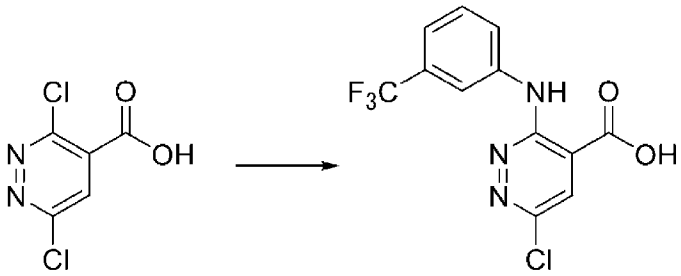
[0358] 〔製造例１５〕

以下の工程にて、メチル2-(6-クロロ-3-((3-(トリフルオロメチル)フェニル)アミノ)ピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン

-1-カルボキシレート（英名：Methyl2-(6-chloro-3-((3-(trifluoromethyl)phenyl)amino)pyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-91））を製造した。

[0359] 工程１：6-クロロ-3-((3-(トリフルオロメチル)フェニル)アミノ)ピリダジン-4-カルボン酸（英名：6-chloro-3-((3-(trifluoromethyl)phenyl)amino)pyridazine-4-carboxylic acid）への転化

[0360] [化69]



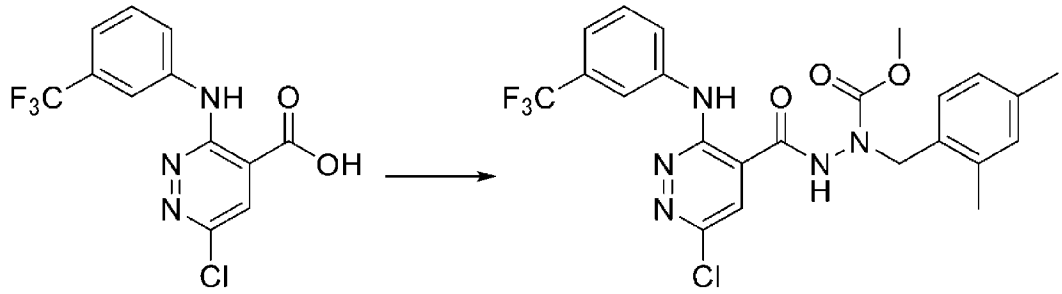
30 31

[0361] 化合物30（1.00ｇ）をエタノール（17.0ml）に溶解させ、これに3-(トリフルオロメチル)アニリン（0.645ml）を加え、室温にて21時間撹拌した。得られた液に希塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。その後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をクロロホルムで洗浄することで化合物31（1.08g、収率65%）を得た。

[0362] 工程２：メチル2-(6-クロロ-3-((3-(トリフルオロメチル)フェニル)アミノ)ピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl2-(6-chloro-3-((3-(trifluoromethyl)phenyl)amino)pyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0363]

[化70]



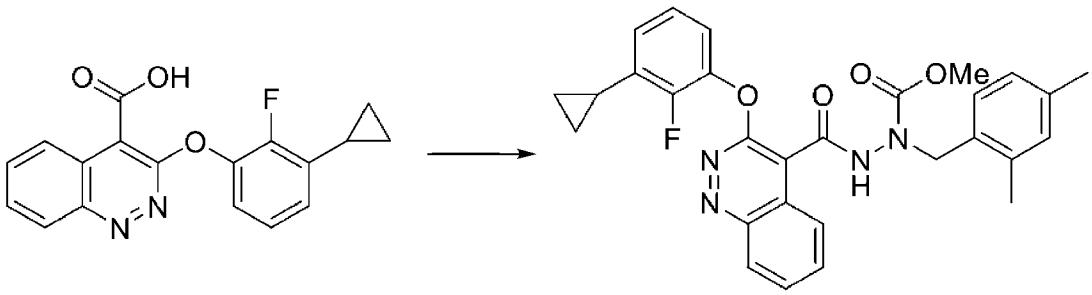
31 b-91

[0364] 化合物31（0.041ｇ）と化合物14（0.06g）をテトラヒドロフラン（0.630ml）に溶解させ、これにプロピルホスホン酸無水物（50%酢酸エチル溶液）（0.156ml）とN,N-ジイソプロピルエチルアミン（0.336ml）を加え、室温にて24時間撹拌した。得られた液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。その後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-91（0.060g、収率61％）を得た。

[0365] 〔製造例１６〕

以下の工程にて、メチル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）シノリン-4-カルボニル）-1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名:methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)cinnoline-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate））（化合物b-90）を製造した。

[0366] [化71]



32 b-90

[0367] 化合物32（0.08ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。こ

れに、化合物14（0.08ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.07g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.004g）およびトリエチルアミン（0.07mL）を室温で加え室温下で18時間撹拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-90（0.05ｇ、収率62％）を得た。

[0368] 上記の製造例と同様の工程を経て、表１に示す化合物を製造した。特性欄に融点を記した。外観がAMORPHOUSまたはVISCOUS OILであるものについてはLCMS保持時間を記した。

[0369] LCMS(SQD2)保持時間は、以下の方法で決定した。

超高速高分離液体クロマトグラフ（ACQUITY UPLC H-Class：ウォーターズ社製）、HPLC/UHPLC検出器〔ACQUITY UPLCフォトダイオードアレイ（ＰＤＡ）eλ検出器（ウォーターズ社製）〕及びシングル四重極MS検出器（LC/MS）〔SQ Detector 2 検出器(正及び負イオンエレクトロスプレーモードおよび大気圧化学イオン化モード)〕を用いてなるシステムに、CORTECS UPLC C18カラム（ウォーターズ社製、２．１×５０ｍｍ、１．６μｍ）を取り付け、温度４０℃、流量０．６ｍＬ／分、２μＬ注入で測定した。移動相（Ａ）に０．１％ギ酸を含む水を使用し、移動相（Ｂ）にアセトニトリルを使用した。移動相（Ｂ）の濃度を３０質量％で０．１５分間維持し、その後１．３５分間を掛けて移動相（Ｂ）の濃度を３０質量％から９５質量％に等速で上げ、０．５分間９５質量％で維持し、次いで移動相（Ｂ）の濃度を３０質量％にすぐ下げ、最後に移動相（Ｂ）の濃度を３０質量％で０．５０分間維持した。

[0370] LCMS(QDa)保持時間は、以下の方法で決定した。

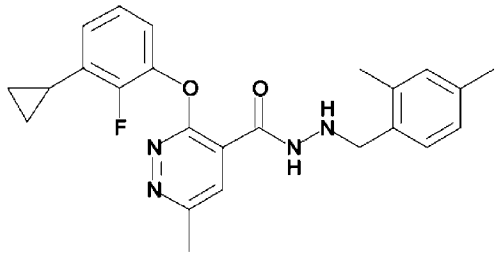
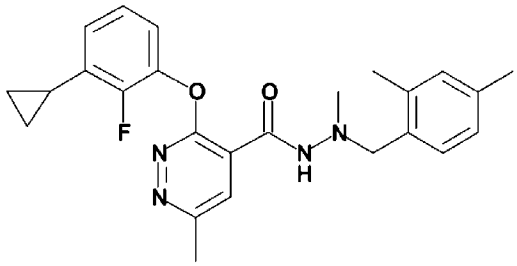
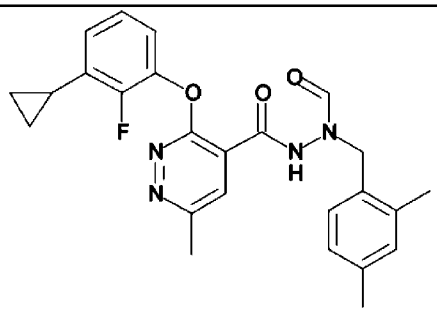
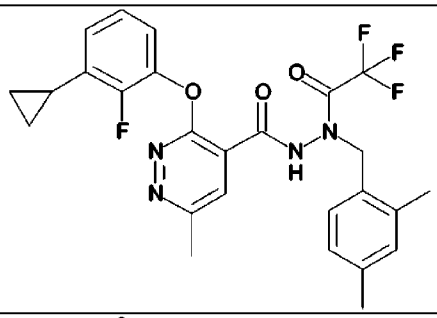
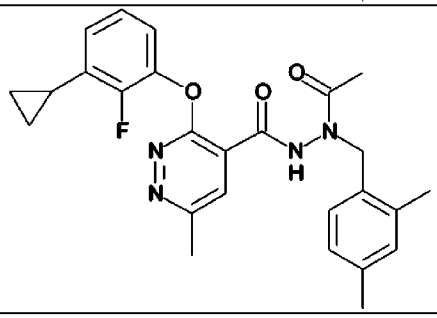
超高速高分離液体クロマトグラフ（ACQUITY UPLC H-Class：ウォーターズ社製）、HPLC/UHPLC検出器〔ACQUITY UPLCフォトダイオードアレイ（ＰＤＡ）eλ検出器（ウォーターズ社製）〕及びシングル四重極ＭＳ検出器（LC/MS）〔ACQUITY QDa検出器(正及び負イオンエレクトロスプレーモード)〕を用いてなるシステムに、CORTECS UPLC C18カラム（ウォーターズ社製、２．１×５

０ｍｍ、１．６μｍ）を取り付け、温度４０℃、流量０．６ｍＬ／分、２μＬ注入で測定した。移動相（Ａ）に０．１％ギ酸を含む水を使用し、移動相（Ｂ）にアセトニトリルを使用した。移動相（Ｂ）の濃度を３０質量％で０．１５分維持し、その後１．３５分間を掛けて３０質量％から９５質量％に等速で上げ、０．５分間９５質量％で維持し、次いで移動相（Ｂ）の濃度を３０質量%にすぐ下げ、最後に移動相（Ｂ）の濃度を３０質量％で０．５０分間維持した。

[0371]

[表1]

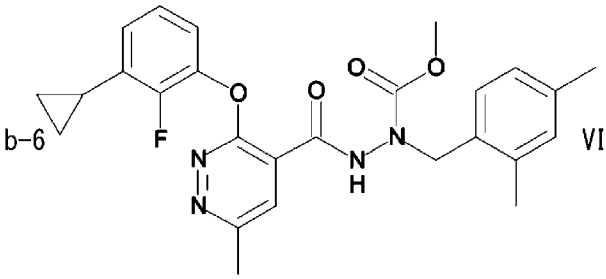
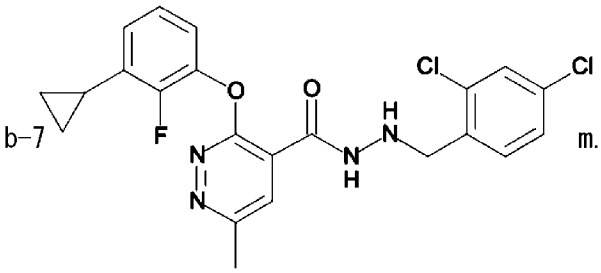
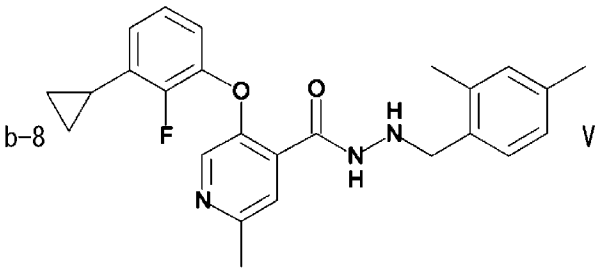
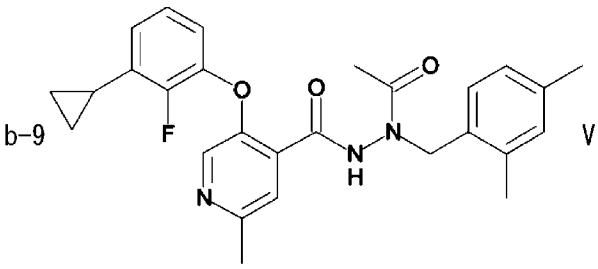
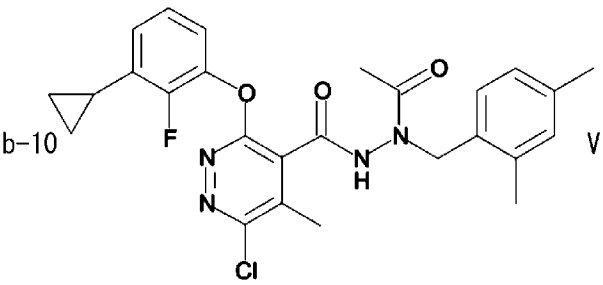
表1

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-1		m.p.:60-62℃		
b-2		AMORPHOUS	1.66min	
b-3		m.p.:71-73℃		
b-4		m.p.:62-64℃		
b-5		AMORPHOUS	1.61min	

[0372]

[表2]

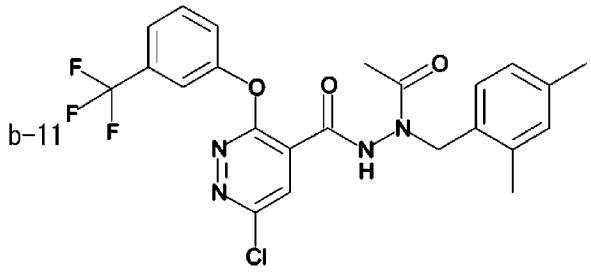
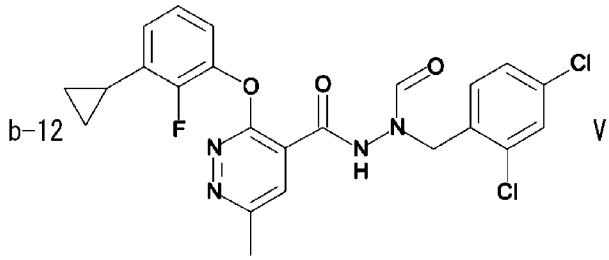
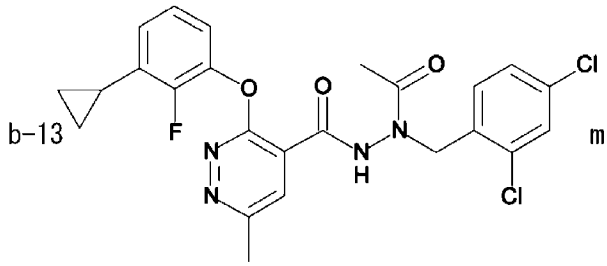
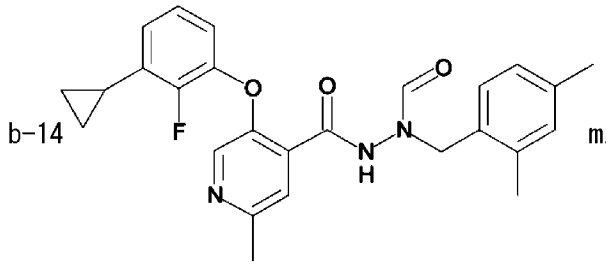
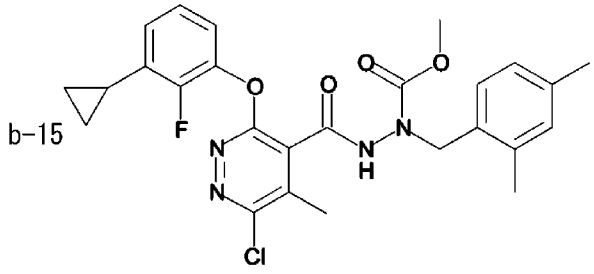
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-6		VISCOUS OIL	1.67min	
b-7		m.p.:65-67℃		
b-8		VISCOUS OIL	1.78min	
b-9		VISCOUS OIL	1.69min	
b-10		VISCOUS OIL	1.73min	

[0373]

[表3]

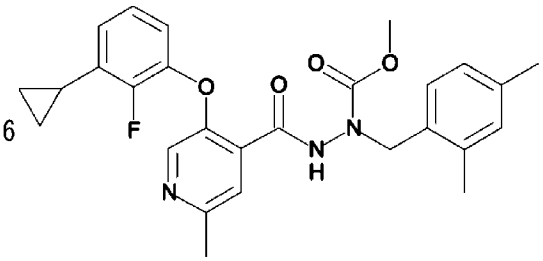
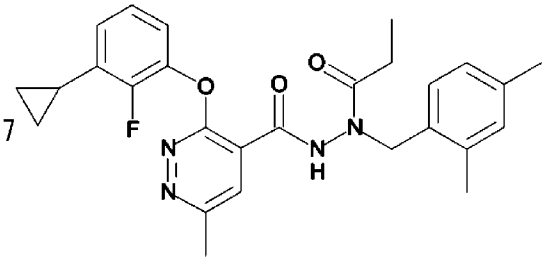
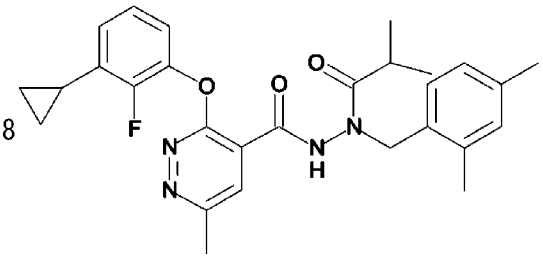
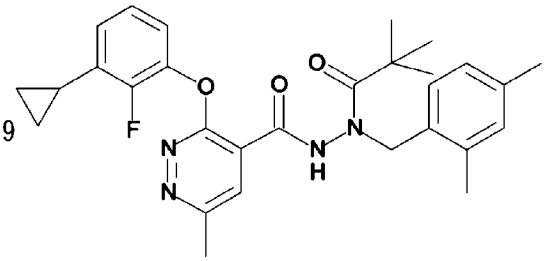
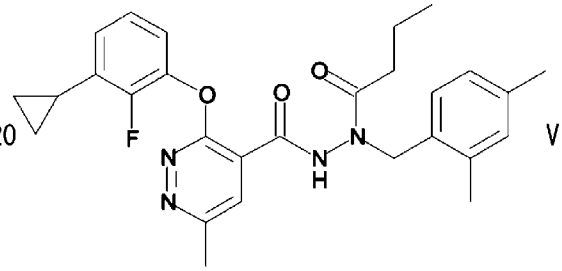
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-11		VISCOUS OIL	1.71min	
b-12		VISCOUS OIL	1.88min	
b-13		m.p.:81-83℃		
b-14		m.p.:54-56℃		
b-15		AMORPHOUS	1.81min	

[0374]

[表4]

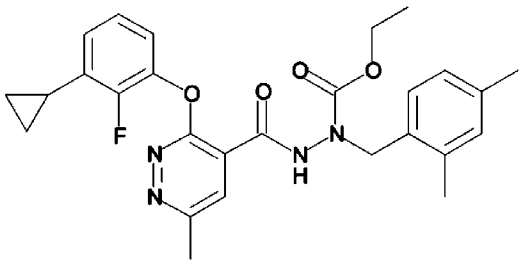
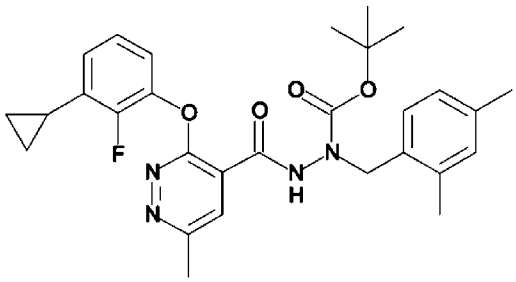
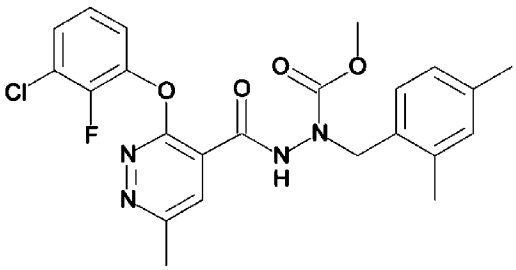
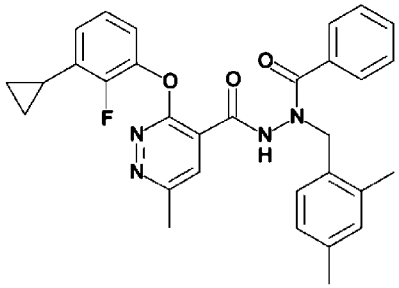
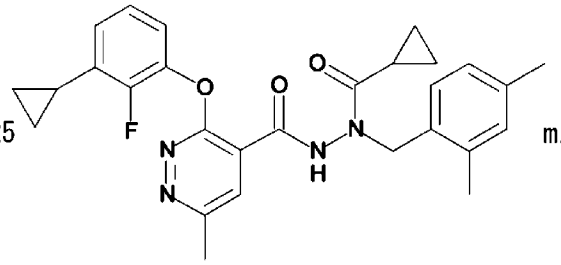
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-16		VISCOUS OIL	1.78min	
b-17		VISCOUS OIL	1.74min	
b-18		VISCOUS OIL	1.80min	
b-19		VISCOUS OIL	1.89min	
b-20		VISCOUS OIL	1.80min	

[0375]

[表5]

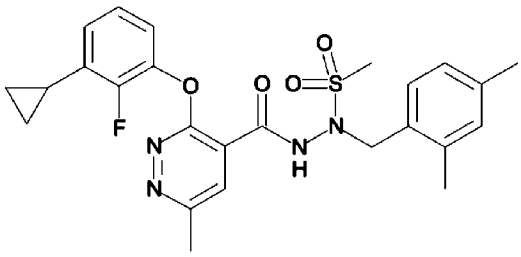
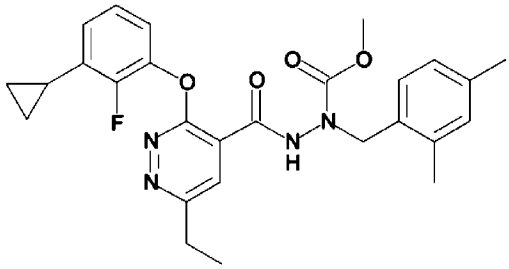
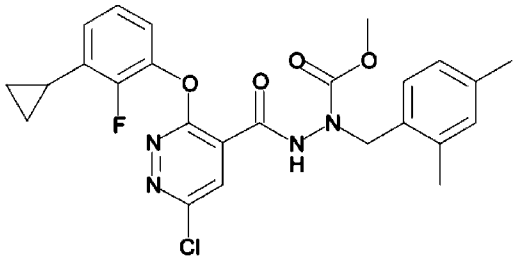
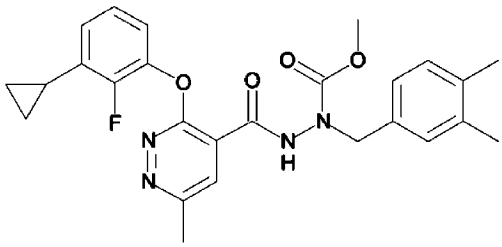
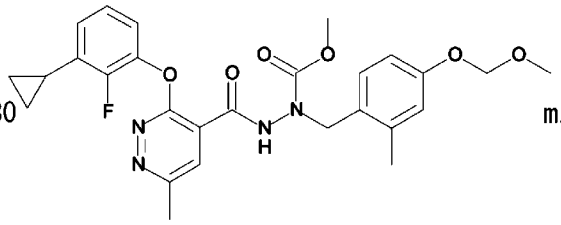
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-21		m.p.:70-72℃		
b-22		m.p.:65-67℃		
b-23		AMORPHOUS		1.67min
b-24		m.p.:85-87℃		
b-25		m.p.:75-77℃		

[0376]

[表6]

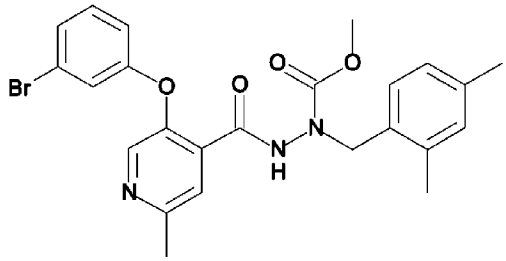
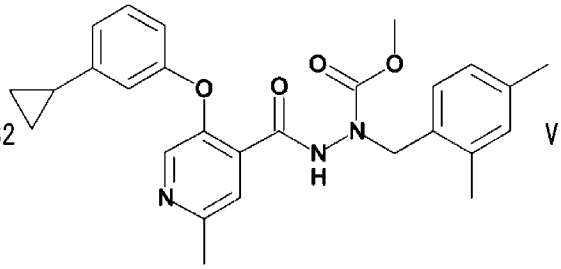
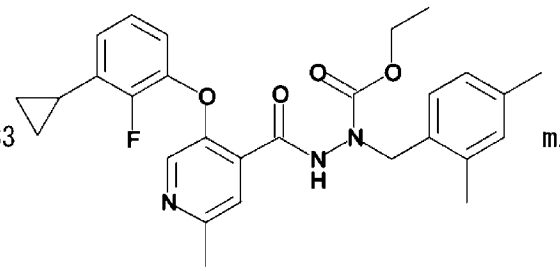
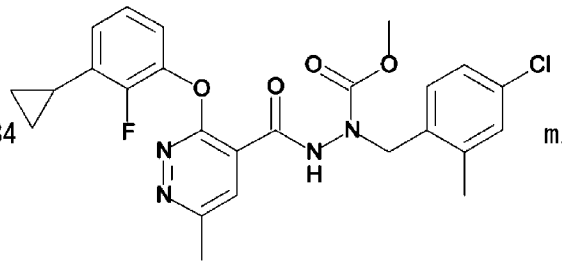
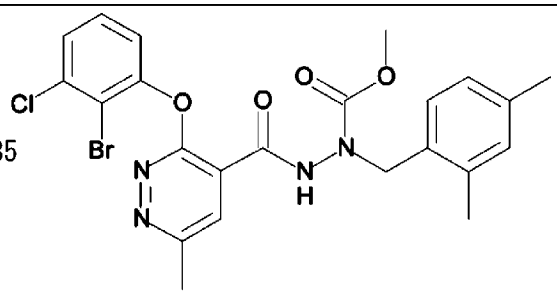
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-26		m.p.:82-84℃		
b-27		VISCOUS OIL	1.85min	
b-28		m.p.:72-74℃		
b-29		m.p.:65-67℃		
b-30		m.p.:68-70℃		

[0377]

[表7]

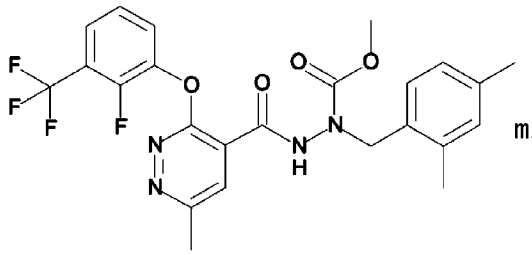
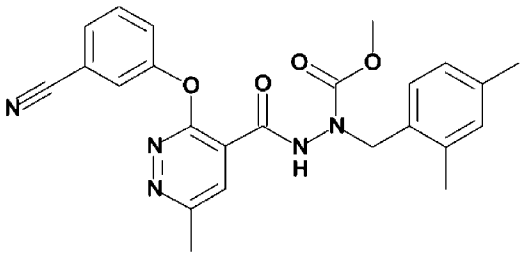
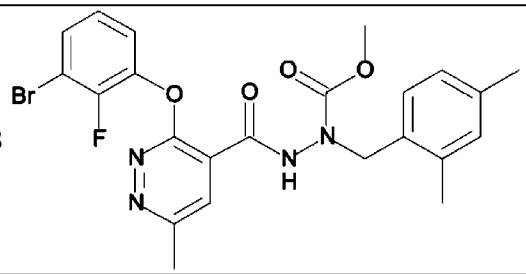
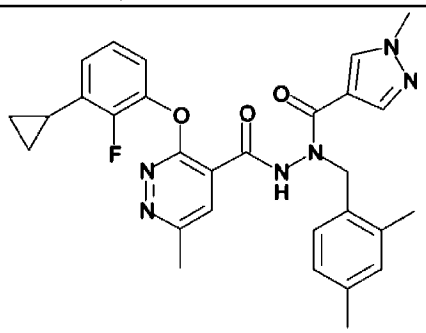
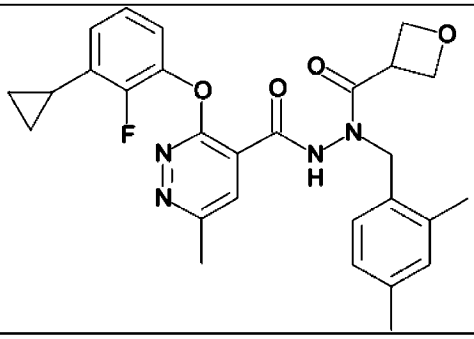
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-31		m.p.:150-152℃		
b-32		VISCOUS OIL	1.83min	
b-33		m.p.:51-53℃		
b-34		m.p.:70-72℃		
b-35		AMORPHOUS		1.71min

[0378]

[表8]

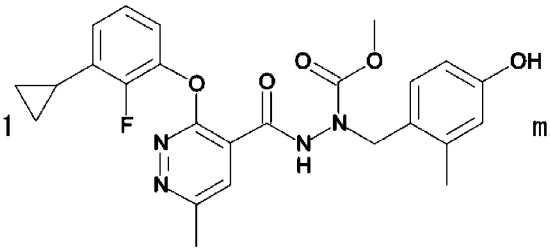
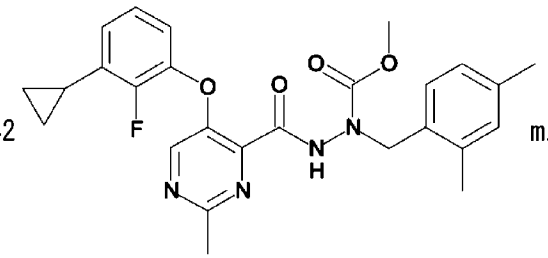
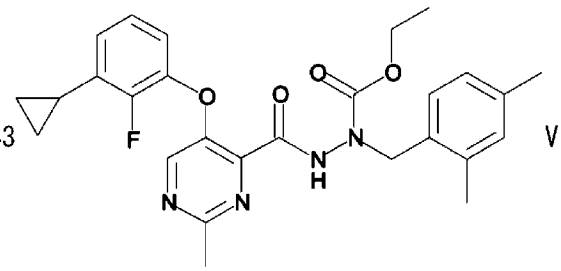
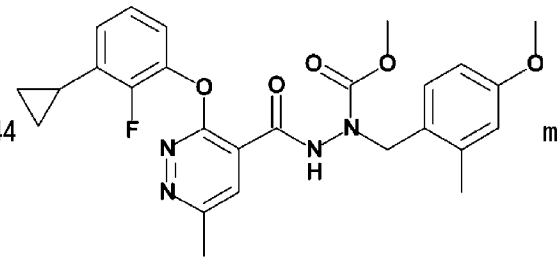
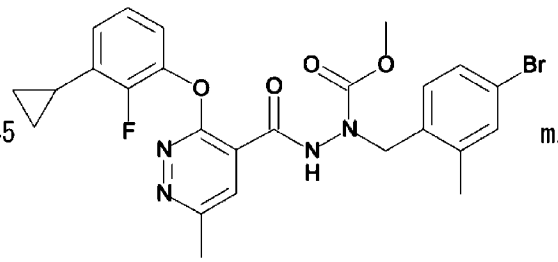
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-36		m.p.:125-126℃		
b-37		AMORPHOUS		1.44min
b-38		AMORPHOUS		1.67min
b-39		m.p.:70-72℃		
b-40		m.p.:93-95℃		

[0379]

[表9]

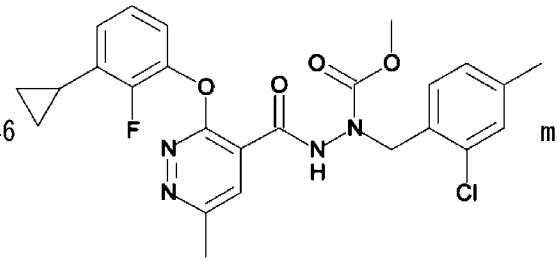
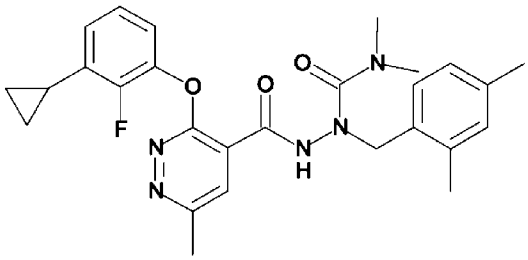
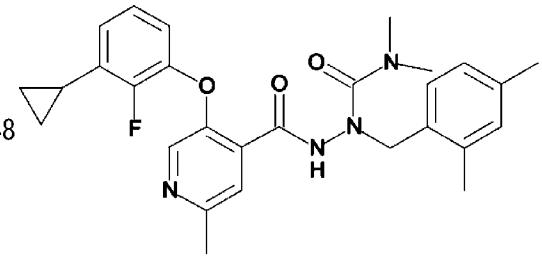
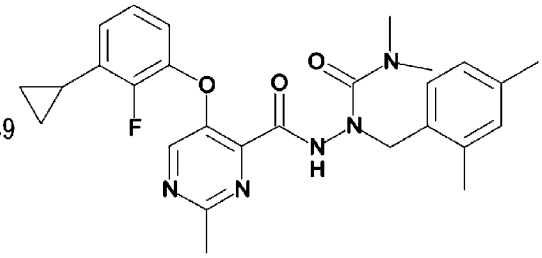
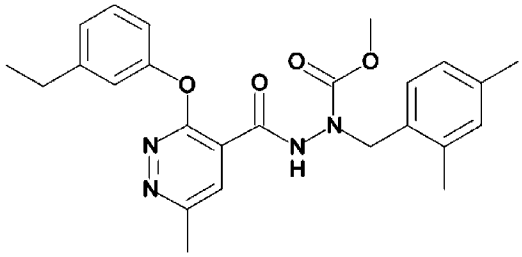
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-41		m.p.:112-114℃		
b-42		m.p.:120-122℃		
b-43		VISCOUS OIL	1.85min	
b-44		m.p.:81-83℃		
b-45		m.p.:80-82℃		

[0380]

[表10]

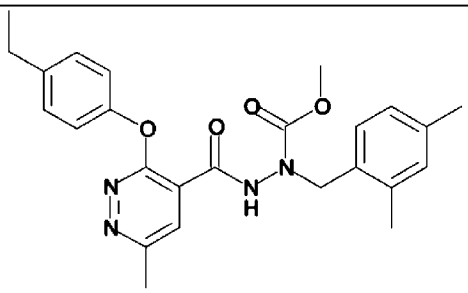
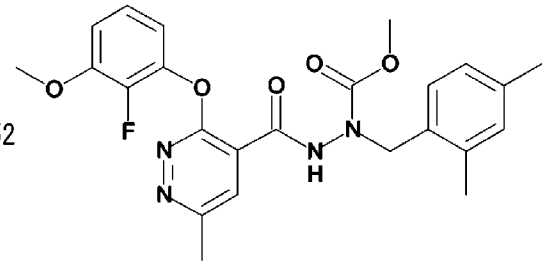
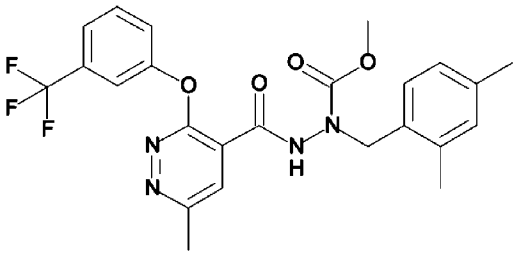
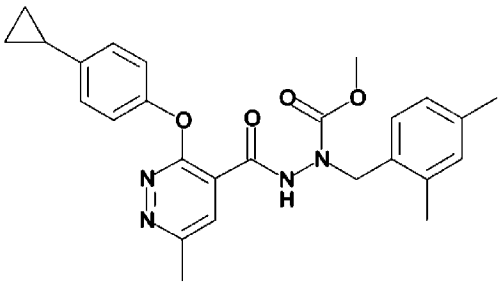
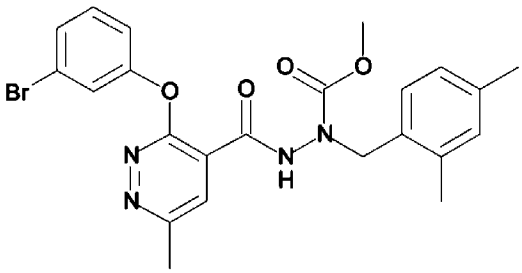
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-46		m.p.:66-68℃		
b-47		m.p.:68-70℃		
b-48		VISCOUS OIL		1.72min
b-49		m.p.:70-72℃		
b-50		AMORPHOUS		1.70min

[0381]

[表11]

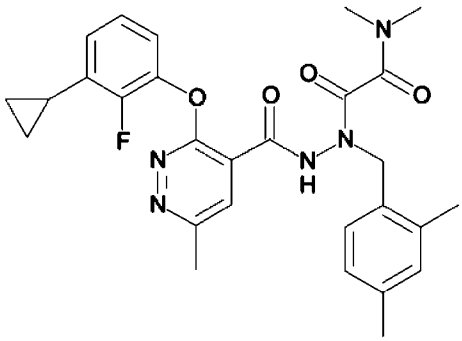
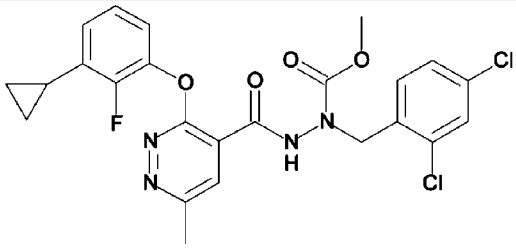
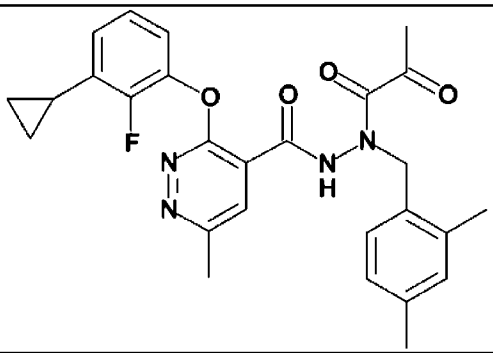
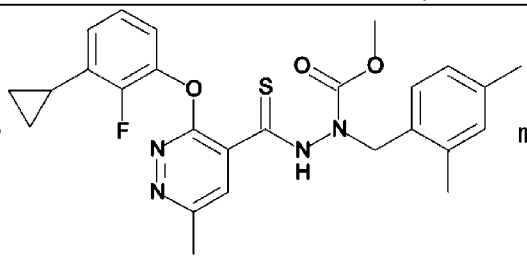
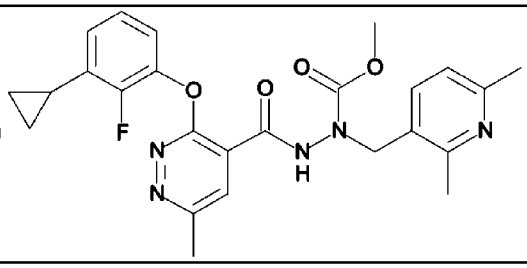
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-51		AMORPHOUS	1.70min	
b-52		AMORPHOUS		1.58min
b-53		AMORPHOUS		1.76min
b-54		m.p.:60-62℃		
b-55		AMORPHOUS		1.71min

[0382]

[表12]

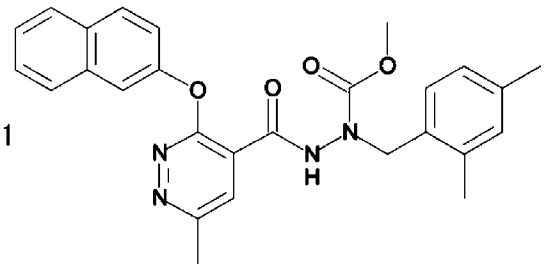
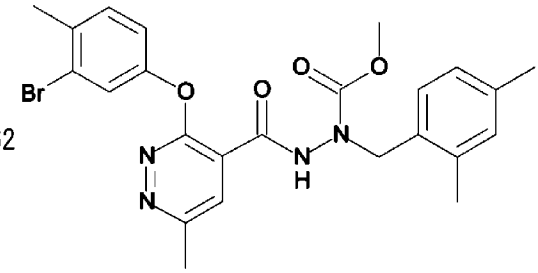
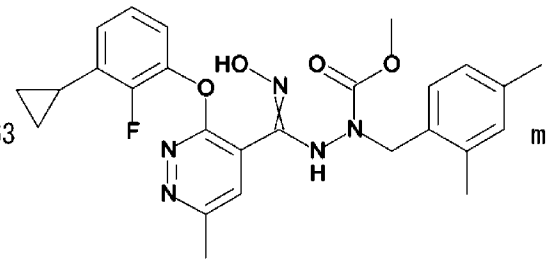
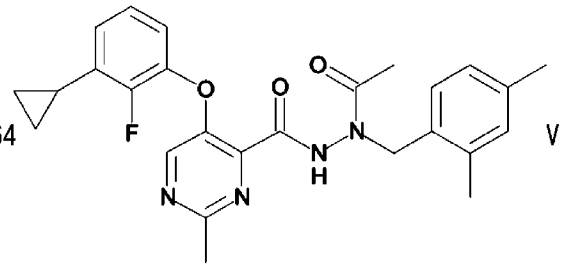
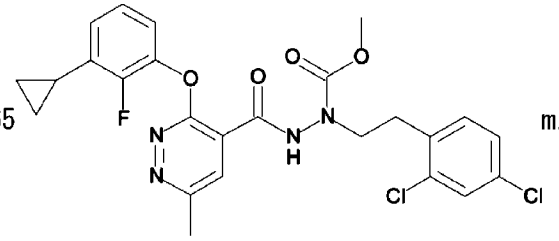
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-56		VISCOUS OIL		1.61min
b-57		m.p.:78-80℃		
b-58		VISCOUS OIL	1.72min	
b-59		m.p.:171-173℃		
b-60		VISCOUS OIL	0.35min	

[0383]

[表13]

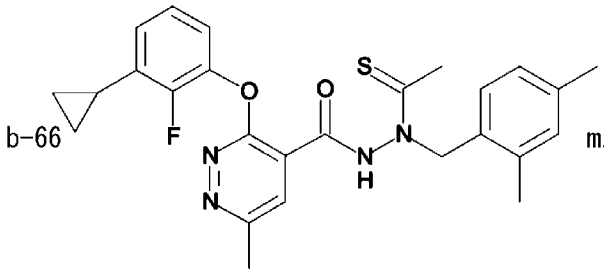
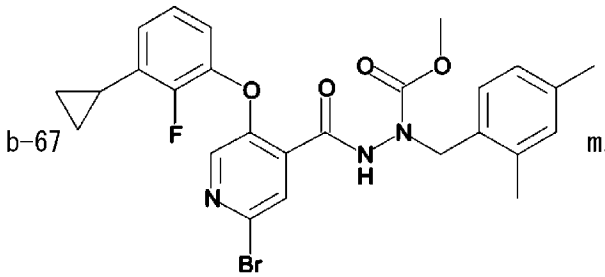
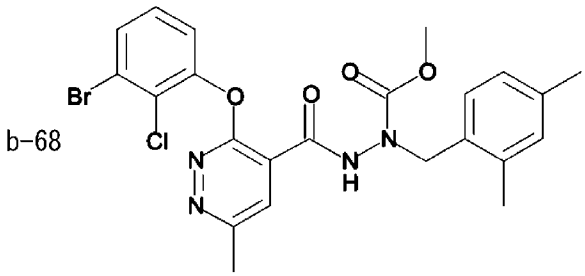
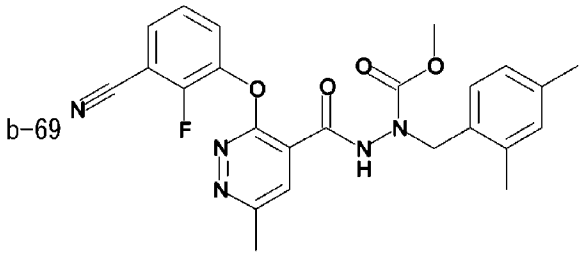
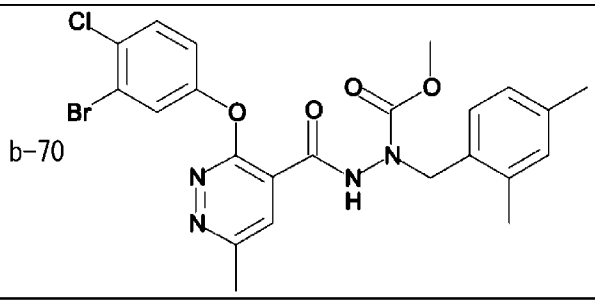
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-61		AMORPHOUS		1.67min
b-62		AMORPHOUS		1.75min
b-63		m.p.:107-109℃		
b-64		VISCOUS OIL	1.64min	
b-65		m.p.:62-64℃		

[0384]

[表14]

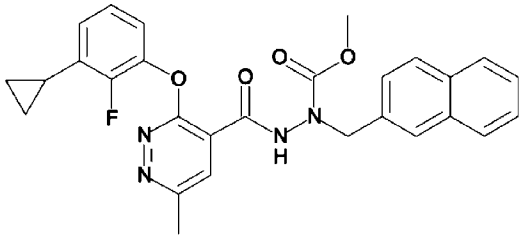
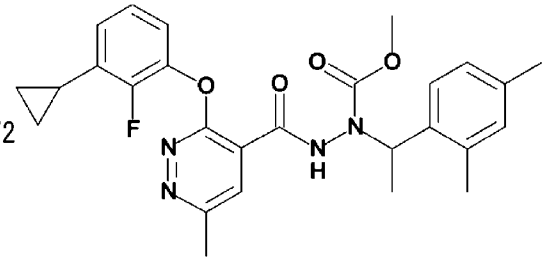
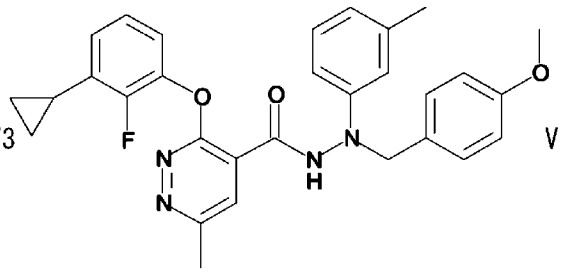
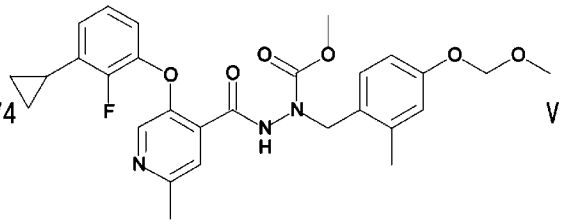
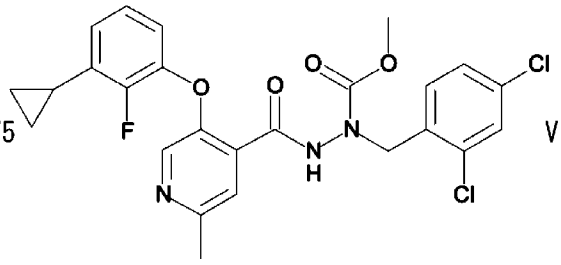
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-66		m.p.:80-82℃		
b-67		m.p.:52-54℃		
b-68		AMORPHOUS		1.70min
b-69		AMORPHOUS		1.45min
b-70		AMORPHOUS		1.74min

[0385]

[表15]

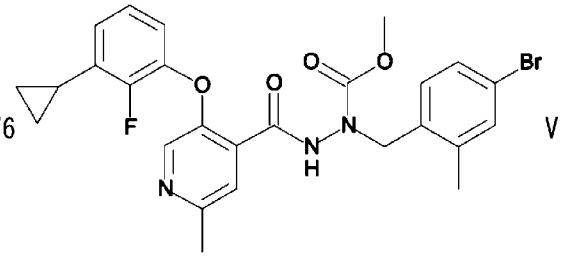
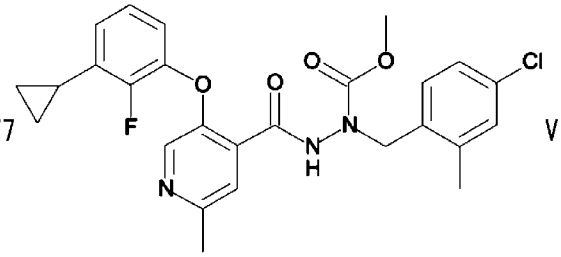
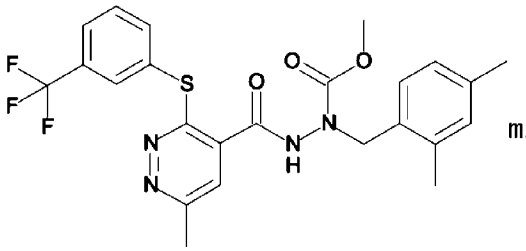
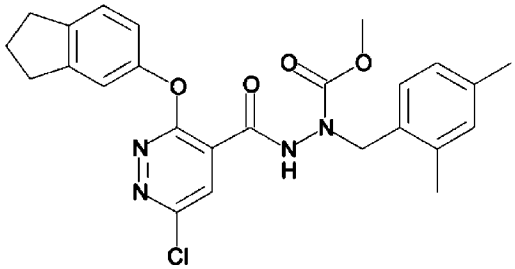
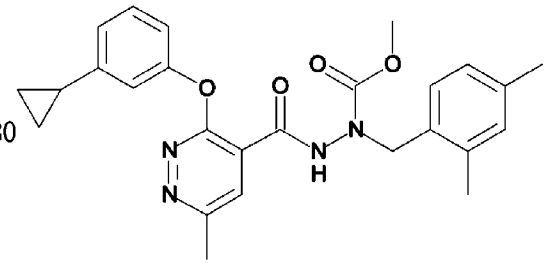
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-71		VISCOUS OIL	1.69min	
b-72		VISCOUS OIL	1.75min	
b-73		VISCOUS OIL	1.82min	
b-74		VISCOUS OIL	1.63min	
b-75		VISCOUS OIL	1.83min	

[0386]

[表16]

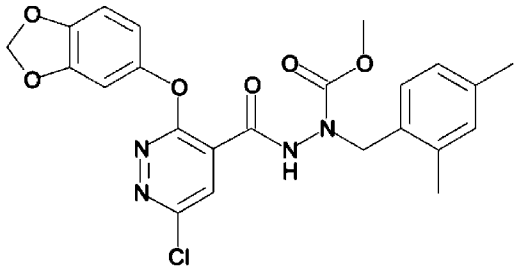
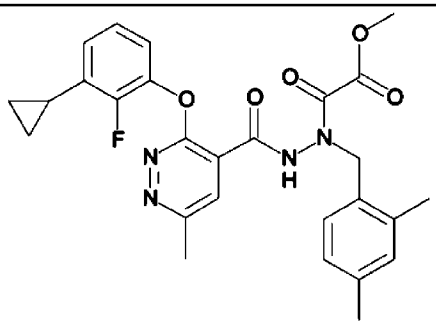
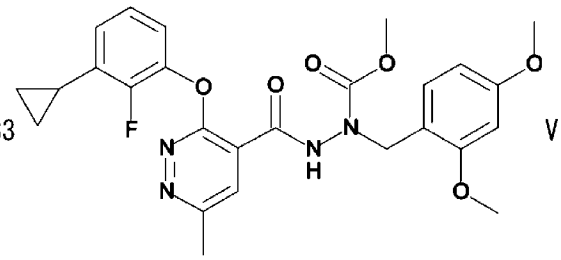
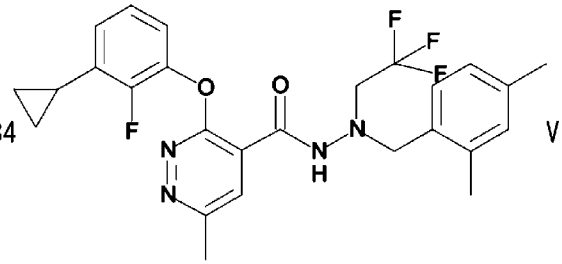
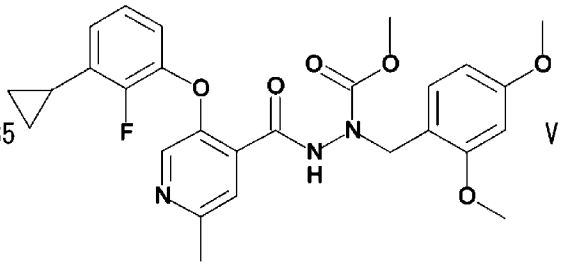
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-76		VISCOUS OIL	1.82min	
b-77		VISCOUS OIL	1.79min	
b-78		m.p.:156-157℃		
b-79		AMORPHOUS		1.85min
b-80		AMORPHOUS	1.70min	

[0387]

[表17]

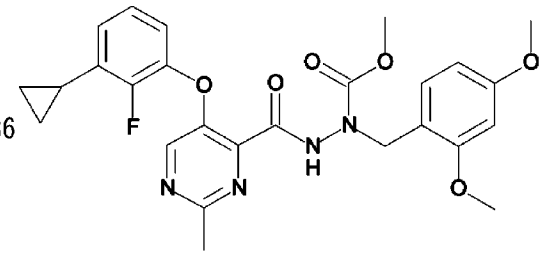
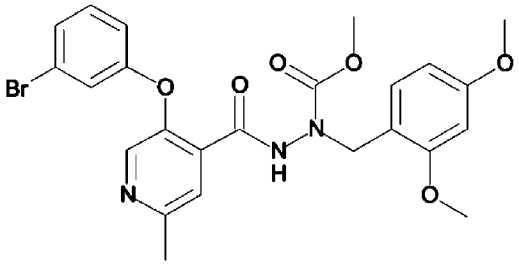
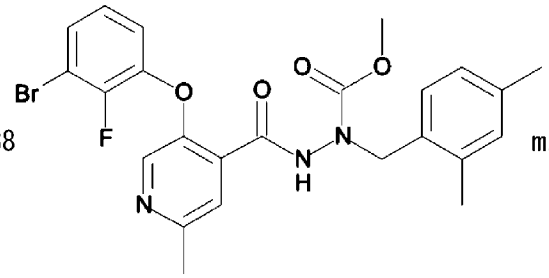
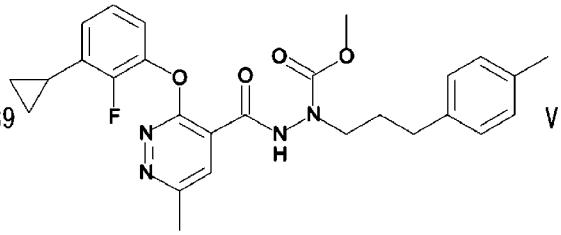
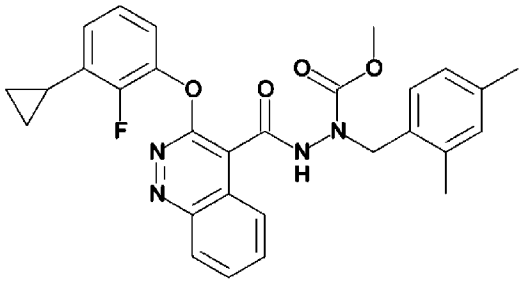
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-81		AMORPHOUS	1.61min	
b-82		VISCOUS OIL	1.71min	
b-83		VISCOUS OIL	1.55min	
b-84		VISCOUS OIL	1.91min	
b-85		VISCOUS OIL	1.61min	

[0388]

[表18]

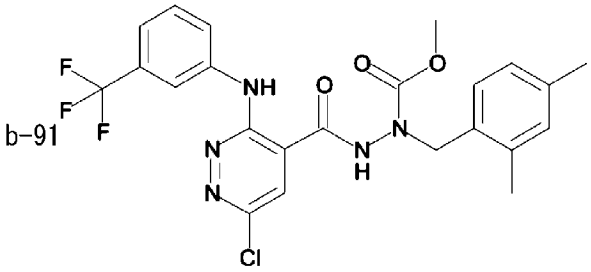
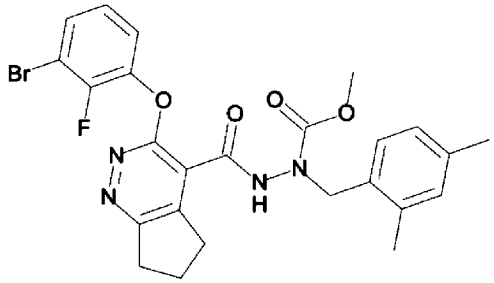
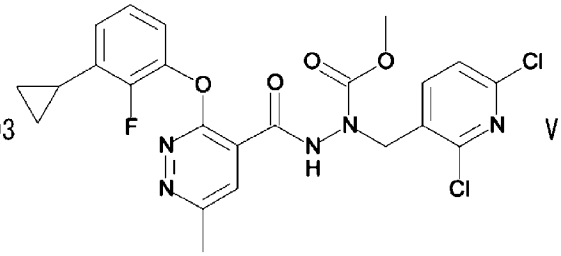
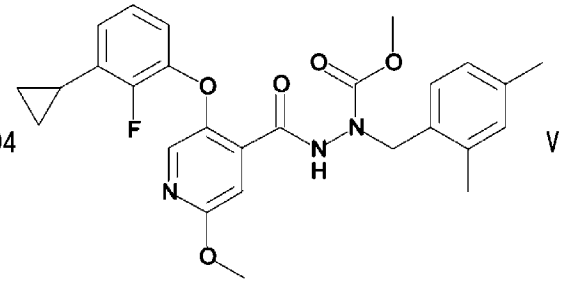
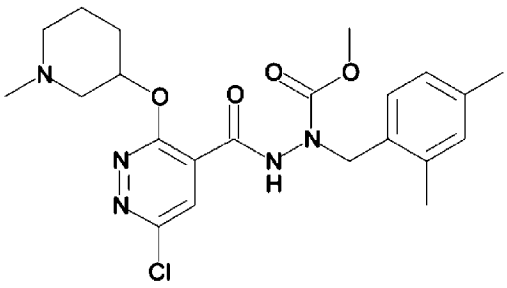
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-86		VISCOUS OIL	1.60min	
b-87		VISCOUS OIL	1.54min	
b-88		m.p.:169-171℃		
b-89		VISCOUS OIL	1.76min	
b-90		AMORPHOUS	1.93min	

[0389]

[表19]

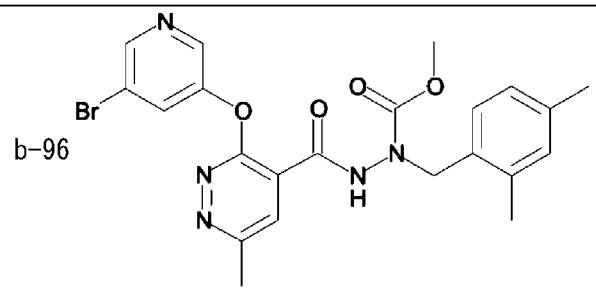
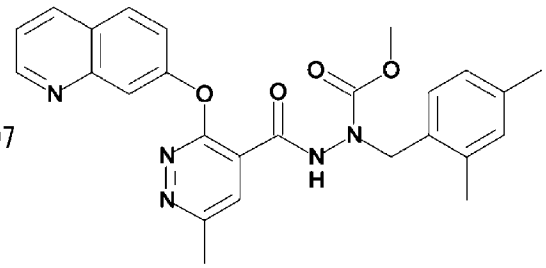
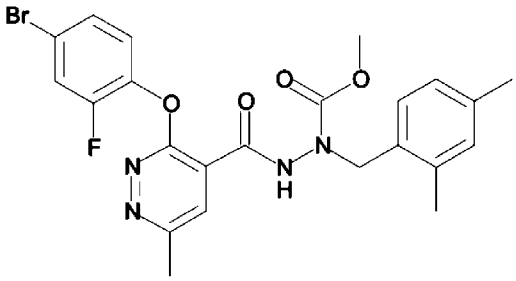
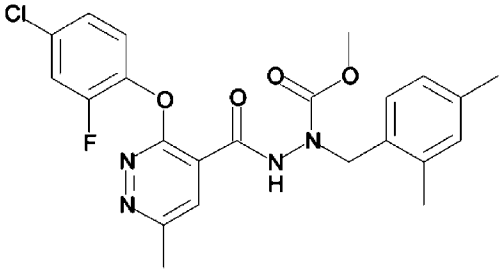
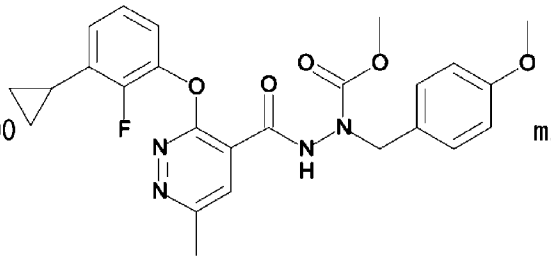
表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-91		AMORPHOUS	1.90min	
b-92		AMORPHOUS	1.64min	
b-93		VISCOUS OIL	1.59min	
b-94		VISCOUS OIL	1.91min	
b-95		AMORPHOUS	0.67min	

[0390]

[表20]

表１（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間	LCMS(QDa)保持時間
b-96		AMORPHOUS	1.46min	
b-97		AMORPHOUS	1.12min	
b-98		m.p.:80-81℃		
b-99		m.p.:75-76℃		
b-100		m.p.:60-62℃		

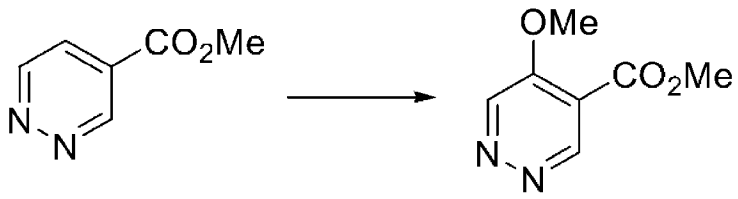
[0391] 〔製造例１７〕

以下の工程にて、メチル 2-(5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)

ピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)pyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-142））を製造した。

[0392] 工程１　：メチル　5-メトキシピリダジン-4-カルボキシレート（英名：methyl 5-methoxypyridazine-4-carboxylate）への転化

[0393] [化72]

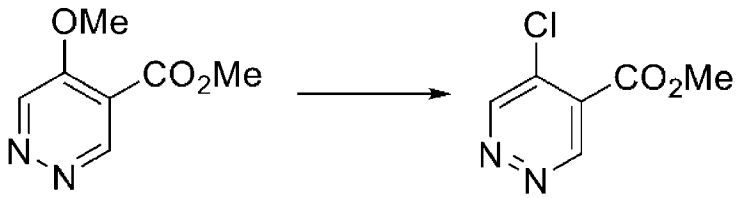


33　34

[0394]　化合物33（0.5ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、室温下、２－ヨードチオフェン（1.2ｇ）、ターシャリーブタノール（0.5mL）およびメタノール（0.2mL）を加え18時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物34（0.2ｇ、収率38%）を得た。

[0395] 工程２　：メチル 5-クロロピリダジン-4-カルボキシレート（英名：methyl 5-chloropyridazine-4-carboxylate）への転化

[0396] [化73]



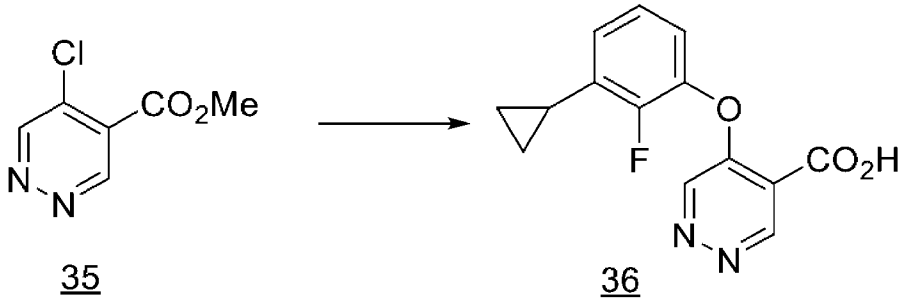
34　35

[0397]　化合物34（0.1ｇ）を濃塩酸（1mL）に溶解させ、加熱還流下で1時間撹拌した。次いで、溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をメタノール（1mL）

に溶解させた。これに、室温下塩化チオニル（0.05mL）を加え、室温下2時間撹拌した。溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をアセトニトリルに溶解させた。これにオキシ塩化リン（0.05mL）およびN,N-ジメチルホルムアミド（0.01mL）を加え、５０℃で1時間撹拌した。得られた液を炭酸ナトリウム水溶液に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物35（0.04ｇ、収率49%）を得た。

[0398] 工程３　：5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)ピリダジン-4-カルボン酸（英名：5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)pyridazine-4-carboxylic acid）への転化

[0399] [化74]

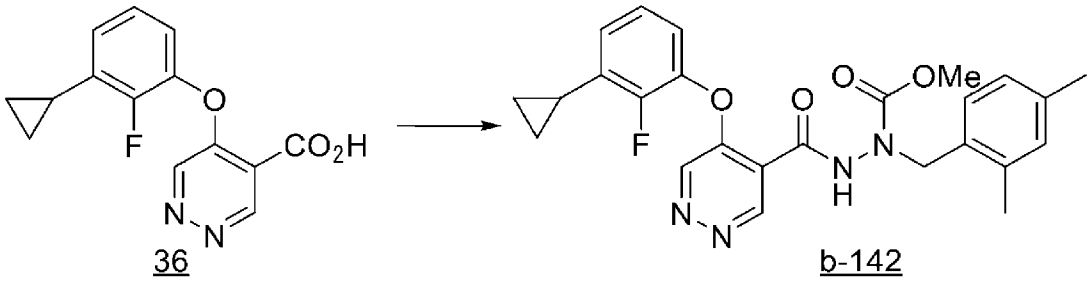


[0400]　化合物35（0.04ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、室温下3-シクロプロピル-2-フルオロフェノール（0.05ｇ）および炭酸セシウム（0.1ｇ）を加え、室温下3時間撹拌した。得られた液を希塩酸溶液に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、化合物36（0.02ｇ、収率26%）を得た。

[0401] 工程４　：メチル 2-(5-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)ピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(5-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)pyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0402]

[化75]



[0403] 化合物36（0.02ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、化合物14（0.032ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.04g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.04mL）を加え、室温下18時間撹拌した。得られた液にメタノールを加え、分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-142（0.002ｇ、収率4%）を得た。

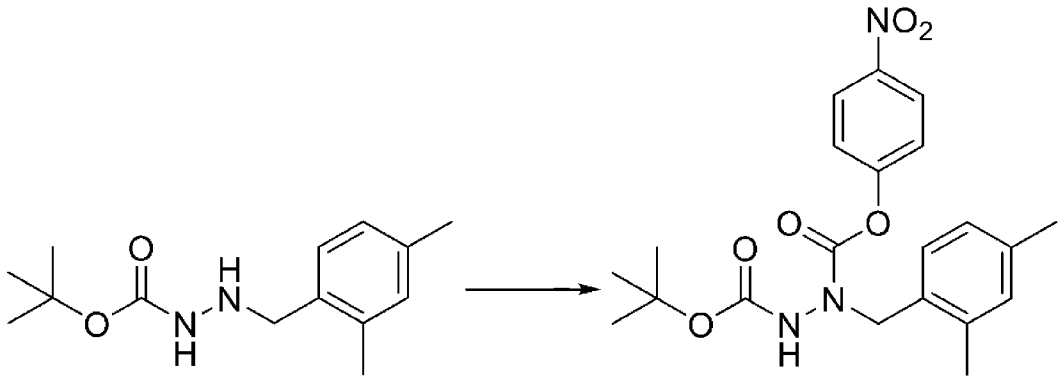
[0404] 〔製造例１８〕

以下の工程にて、S-メチル 2-(3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボチオエート（英名：S-methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carbothioate（化合物b-166））を製造した。

[0405] 工程１ ：2-（ターシャリ-ブチル）1-（4-ニトロフェニル）1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1, 2-ジカルボキシレート（英名：2-(tert-butyl) 1-(4-nitrophenyl) 1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1,2-dicarboxylate）への転化

[0406]

[化76]

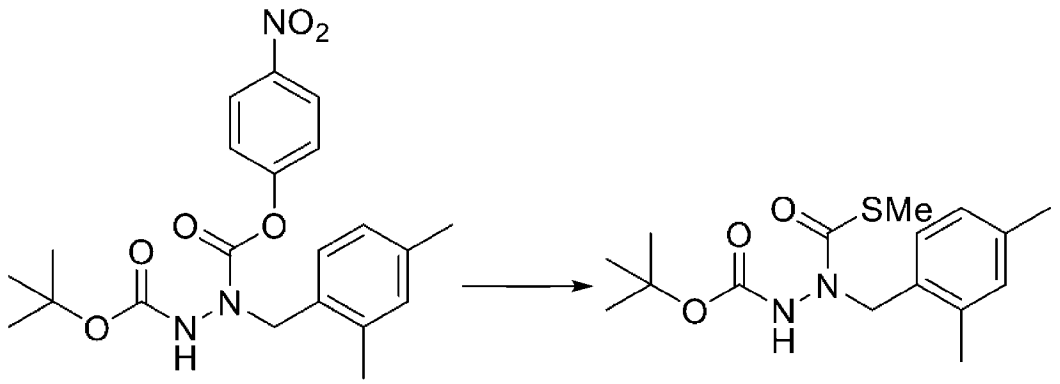


37 38

[0407] 化合物37（0.1ｇ）をテトラヒドロフラン（3mL）に溶解させた。これに、０℃でクロロギ酸4-ニトロフェニル（0.2ｇ）、炭酸セシウム（0.5g）を加え3時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物38（0.11ｇ、収率66%）を得た。

[0408] 工程２ ：ターシャリ-ブチル 2-（2, 4-ジメチルベンジル）-2-（（メチルチオ）カルボニル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：tert-butyl 2-(2,4-dimethylbenzyl)-2-((methylthio)carbonyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0409] [化77]



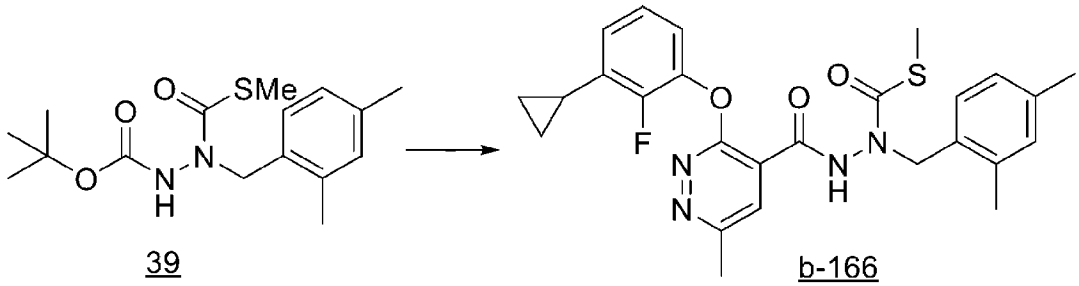
38 39

[0410] 化合物38（0.03ｇ）をテトラヒドロフラン（1mL）に溶解させた。これに

、-78℃でメチルメルカプタンナトリウム（0.02ｇ）を加え-10℃で1時間撹拌した。得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物39（0.01ｇ、収率41％）を得た。

[0411] 工程３　：S-メチル 2-(3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボチオエート（英名：S-methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carbothioate）への転化

[0412] [化78]



39　　b-166

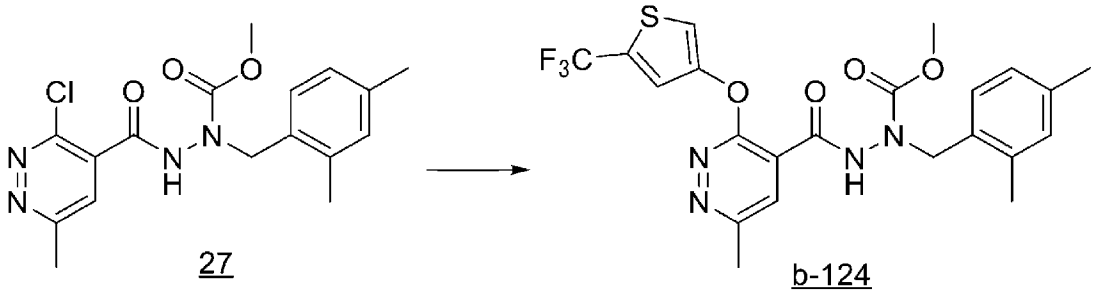
[0413]　化合物39（0.01ｇ）をジクロロメタン（0.5mL）に溶解させた。これに、室温下トリフルオロ酢酸（0.1mL）を加え、室温下2時間撹拌した。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をジクロロメタン（1mL）に溶解させた。これに、化合物24（0.015ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.02ｇ）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.02mL）を加え室温下18時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-166（0.002ｇ、収率8％）を得た。

[0414] 〔製造例１９〕

以下の工程にて、メチル 1-(2,4-ジメチルベンジル)-2-(6-メチル-3-((5-(

トリフルオロメチル)チオフェン-3-イル)オキシ)ピリダジン-4-カルボニル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 1-(2,4-dimethylbenzyl)-2-(6-methyl-3-((5-(trifluoromethyl)thiophen-3-yl)oxy)pyridazine-4-carbonyl)hydrazine-1-carboxylate）（化合物b-124）を製造した。

[0415] [化79]



[0416] 化合物27（0.150ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1.40ml）に溶解させた。これに、4-ヒドロキシ-2-(トリフルオロメチル)チオフェン（0.1g）を加え120℃で17時間撹拌した。得られた液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物b-124（0.12ｇ、収率59%）を得た。

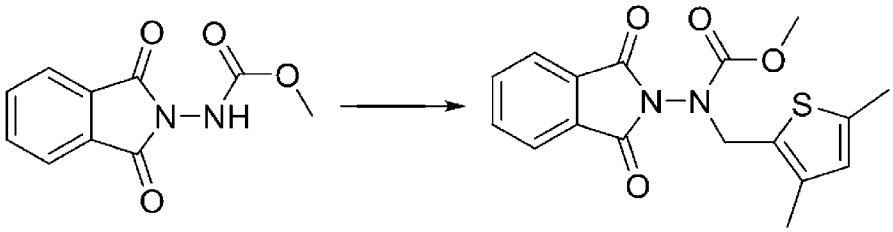
[0417] 〔製造例２０〕

以下の工程にて、メチル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボニル）-1-（（3, 5-ジメチルチオフェン-2-イル）メチル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-((3,5-dimethylthiophen-2-yl)methyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物番号b-122））を製造した。

[0418] 工程１ ：メチル（（3, 5-ジメチルチオフェン-2-イル）メチル）（1, 3-ジオキソイソインドリン-2-イル）カルバメート（英名：methyl ((3,5-dimethylthiophen-2-yl)methyl)(1,3-dioxoisoindolin-2-yl)carbamate）への転化

[0419]

[化80]

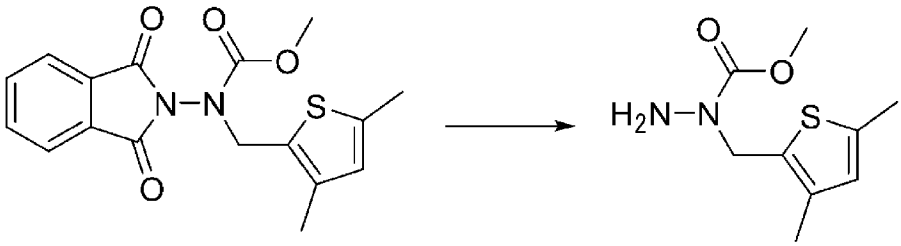


22 40

[0420] 化合物22（0.25ｇ）をテトラヒドロフラン（7mL）に溶解させた。これに、室温下、アゾジカルボン酸ビス(2-メトキシエチル)（0.84ｇ）およびトリフェニルホスフィン（1.0ｇ）を加え室温下で18時間撹拌した。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物40（0.3ｇ、収率63%）を得た。

[0421] 工程２ ：メチル 1-((3,5-ジメチルチオフェン-2-イル)メチル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 1-((3,5-dimethylthiophen-2-yl)methyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0422] [化81]



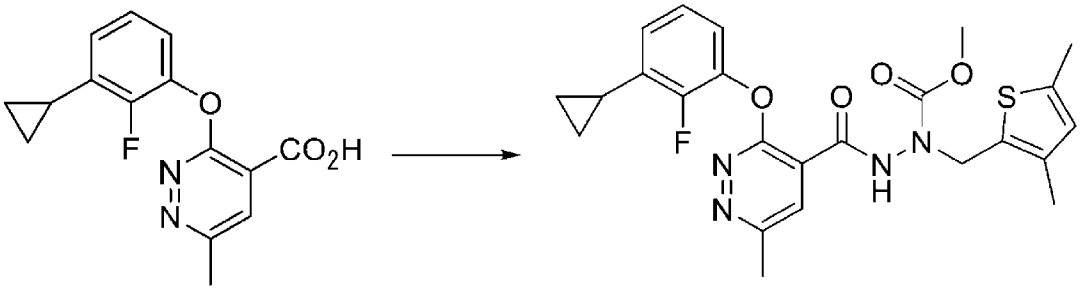
40 41

[0423] 化合物40（0.3ｇ）をエタノール（7mL）に溶解させた。これに、室温下、ヒドラジン一水和物（0.5mL）を加え室温下で18時間撹拌した。得られた液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し化合物41（0.19ｇ、収率72%）を得た。

[0424] 工程３ ：メチル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボニル）-1-（（3, 5-ジメチルチオフェン-2-イル）メチル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-((3,5-dimethylth

iophen-2-yl)methyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0425] [化82]



19 b-122

[0426] 化合物19（0.042ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、化合物41（0.04ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.04ｇ）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.002ｇ）およびトリエチルアミン（0.04mL）を加え室温下18時間撹拌した。得られた液にメタノールを加え、分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-122（0.01ｇ、収率18%）を得た。

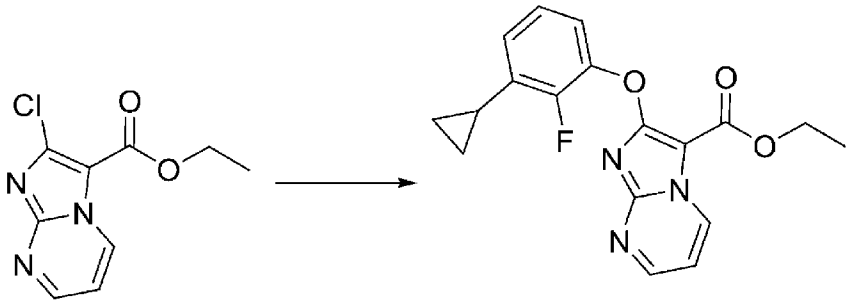
[0427] 〔製造例２１〕

以下の工程にて、メチル 2-(2-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン-3-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl 2-(2-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)imidazo[1,2-a]pyrimidine-3-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-226））を製造した。

[0428] 工程１ ：エチル 2-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)イミダゾ［1, 2-a］ピリミジン-3-カルボキシレート（英名: Ethyl 2-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)imidazo[1,2-a]pyrimidine-3-carboxylateへの転化

[0429]

[化83]

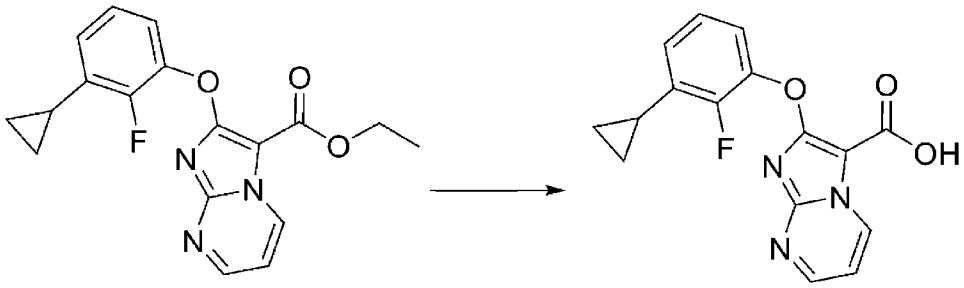


62 63

[0430] 化合物62（0.135ｇ）をN,N－ジメチルアセトアミド（3mL）に溶解させた。これに、3-シクロプロピル-2-フルオロフェノール（0.46g）を加え、140℃にて7時間撹拌した。得られた液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出相を食塩水で洗浄した。その後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製して、化合物63（0.135ｇ,収率20％）を得た。

[0431] 工程２ ：2-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン-3-カルボン酸（英名：2-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)imidazo[1,2-a]pyrimidine-3-carboxylic acid）への転化

[0432] [化84]

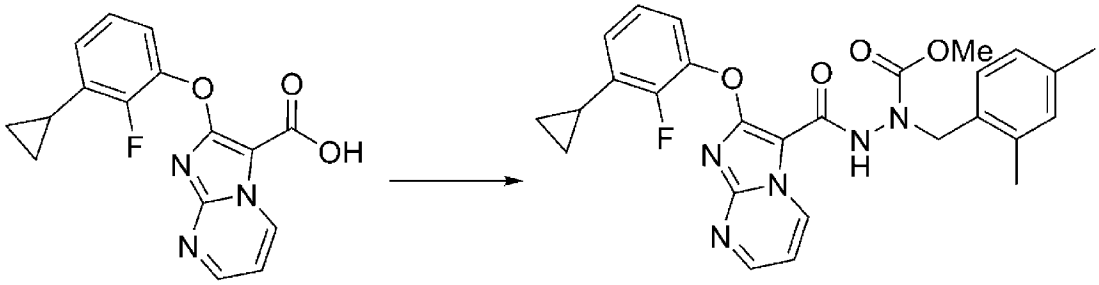


63 64

[0433] 化合物63（0.135g）をテトラヒドロフラン（3mL）、メタノール（1mL）および水（1ml）の混合溶媒に溶解させた。これに水酸化リチウム一水和物（0.08g）を加え、室温下で終夜攪拌した。得られた液に希塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出相を飽和食塩水で洗浄した。その後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、溶媒を減圧留去し、化合物64（0.101ｇ,収率80％）を得た。

[0434] 工程３　：メチル 2-(2-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン-3-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：Methyl 2-(2-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)imidazo[1,2-a]pyrimidine-3-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylateへの転化

[0435] [化85]



64　　b-226

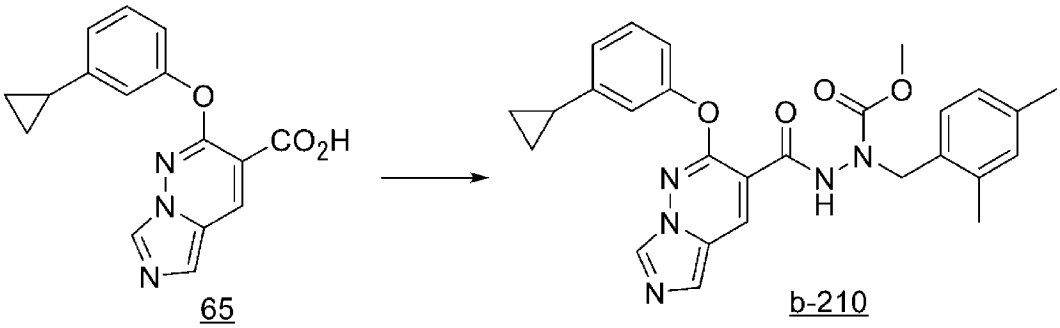
[0436]　化合物64（0.03ｇ）をN,N－ジメチルホルムアミド（0.5mL)に溶解させた。これに化合物14（0.03g)、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスファート（0.07g)およびN,N-ジイソプロピルエチルアミン（0.05g)を加え、室温下2時間撹拌した。得られた液を分取HPLC（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製して、化合物b-226（0.012g,収率25％）を得た。

[0437] 〔製造例２２〕

以下の工程にて、メチル 2-（2-（3-シクロプロピルフェノキシ）イミダゾ［1，5-b］ピリダジン-3-カルボニル）-1-（2，4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(2-(3-cyclopropylphenoxy)imidazo[1,5-b]pyridazine-3-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-210））を製造した。

[0438]

[化86]



65 b-210

[0439] 化合物65（0.003ｇ）をテトラヒドロフラン（0.5mL）に溶解させた。これに、室温下、化合物14（0.002ｇ）、プロピルホスホン酸無水物（50%酢酸エチル溶液、0.01ml）およびN,N-ジイソプロピルエチルアミン（0.009mL）を加え18時間撹拌した。

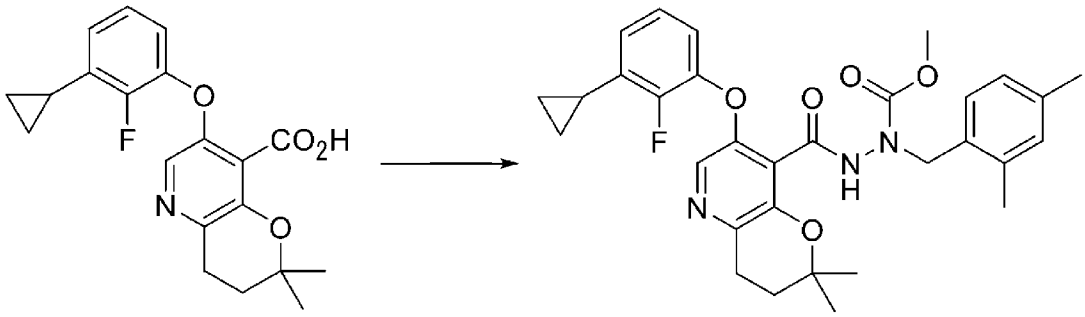
得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-210（0.002ｇ、収率40%）を得た。

[0440] 〔製造例２３〕

以下の工程にて、メチル 2-（7-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ［3, 2-b］ピリジン-8-カルボニル）-1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(7-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-2,2-dimethyl-3,4-dihydro-2H-pyrano[3,2-b]pyridine-8-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-209））を製造した。

[0441]

[化87]



66 b-209

[0442] 化合物66（0.025ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（0.5mL）に溶解させた。これに、室温下、化合物14（0.022ｇ）、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスファート（0.04g）およびトリエチルアミン（0.029mL）を加え18時間撹拌した。

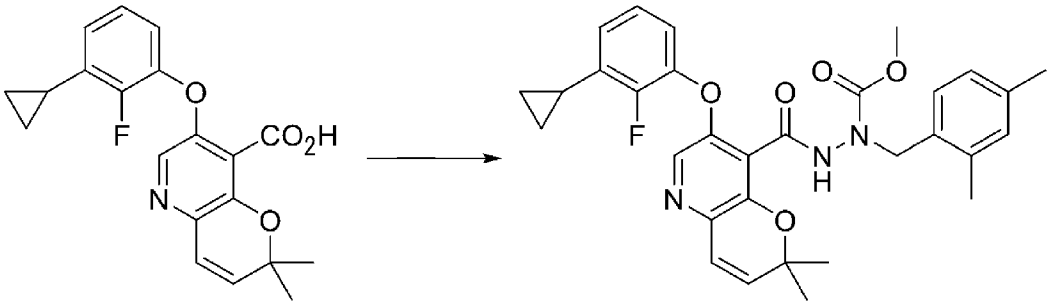
得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-209（0.012ｇ、収率31％）を得た。

[0443] 〔製造例２４〕

以下の工程にて、メチル 2-（7-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-2, 2-ジメチル-2H-ピラノ［3, 2-b］ピリジン-8-カルボニル）-1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl 2-(7-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-2,2-dimethyl-2H-pyrano[3,2-b]pyridine-8-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-213））を製造した。

[0444]

[化88]



67 b-213

[0445] 化合物67（0.025ｇ）をテトラヒドロフラン（0.5mL）に溶解させた。これに、室温下、化合物14（0.022ｇ）、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスファート（0.04g）およびトリエチルアミン（0.029mL）を加え18時間撹拌した。

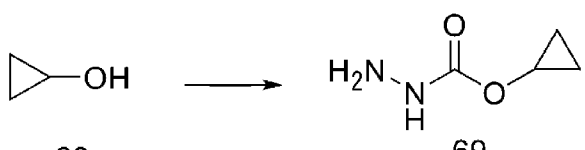
得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-213（0.025ｇ、収率65%）を得た。

[0446] 〔製造例２５〕

以下の工程にて、シクロプロピル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボニル）-1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：cyclopropyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物b-184））を製造した。

工程１　：　シクロプロピルヒドラジンカルボキシレート（英名：cyclopropyl hydrazinecarboxylate）への転化

[0447] [化89]



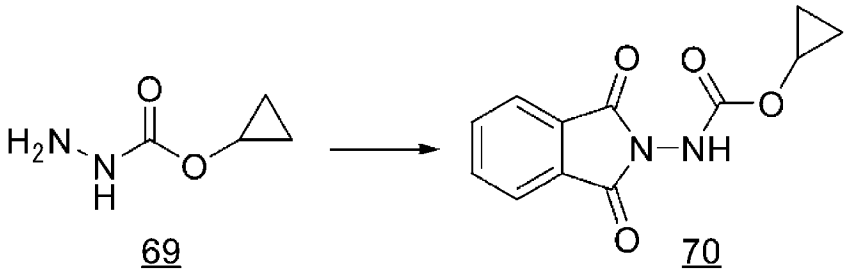
68 69

[0448] 化合物68（1.0ｇ）をジクロロメタン（34mL）に溶解させた。これに、０℃でピリジン（2.1mL）、クロロギ酸フェニル（2.1mL）を加え室温下18時間撹拌した。得られた液を０℃で１規定塩酸水溶液に注加した。

これをジクロロメタンで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をエタノール（34mL）に溶解させた。これに、室温下でヒドラジン一水和物を加え80℃で1時間撹拌した。得られた液を０℃で１規定水酸化ナトリウム水溶液に注加した。これをジクロロメタンで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物69（0.85ｇ、収率43%）を得た。

[0449] 工程２　：　シクロプロピル（1,3-ジオキソインドリン-2-イル）カーバメート（英名：cyclopropyl (1,3-dioxoisoindolin-2-yl)carbamate）への転化

[0450] [化90]



69　　70

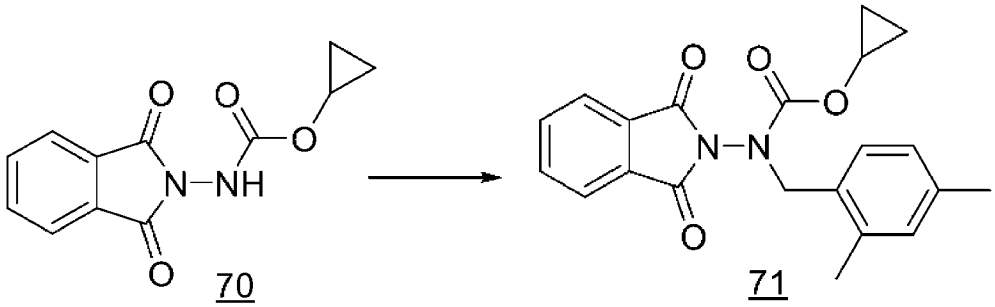
[0451] フタル酸無水物（1.1ｇ）をテトラヒドロフラン（24mL）に溶解させた。これに、室温で化合物69（0.85ｇ）を加え室温下1時間撹拌した。続いて室温でN,N′-ジシクロヘキシルカルボジイミド（1.8ｇ）を加え室温下18時間撹拌した。生じた固体を濾過し、得られた液に酢酸（0.84mL）およびトリエチルアミン（2.0mL）を加え、加熱還流下1時間撹拌した。

得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、化合物70（1.0ｇ、収率60%）を得た。

[0452] 工程３　：　シクロプロピル（2, 4-ジメチルベンジル）（1, 3-ジオキソインドリン-2-イル）カ-バメート（英名：cyclopropyl (2,4-dimethylbenzyl)(

1,3-dioxoisoindolin-2-yl)carbamate）への転化

[0453] [化91]



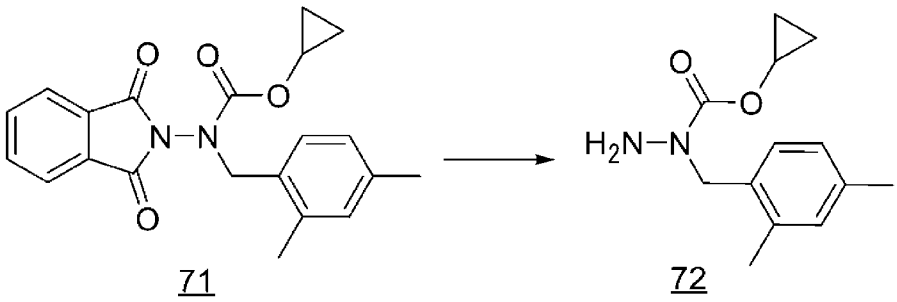
70 71

[0454] 化合物70（1.0ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（3mL）に溶解させた。これに、室温で1-(ブロモメチル)-2,4-ジメチルベンゼン（1.0ｇ）、炭酸セシウム（2.0ｇ）を加え室温で18時間撹拌した。

得られた液を氷水に注加した。これを酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、化合物71（1.3ｇ、収率86%）を得た。

[0455] 工程４ ： シクロプロピル 1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：cyclopropyl 1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0456] [化92]

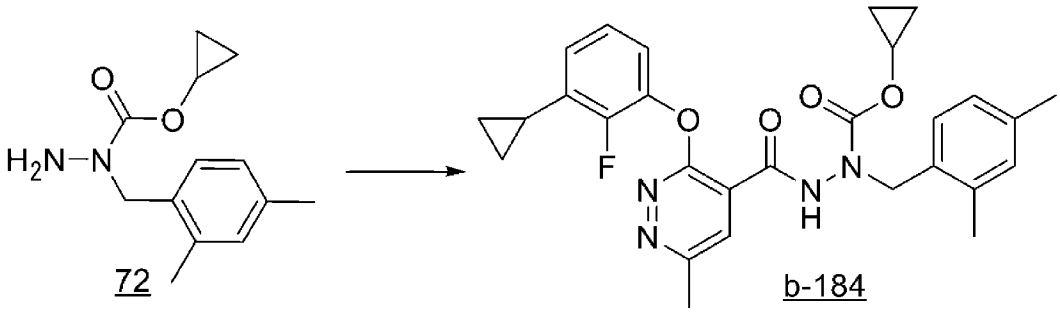


71 72

[0457] 化合物71（1.3ｇ）をエタノール（5mL）に溶解させた。これに、室温下、ヒドラジン一水和物（1.3mL）を加え５０℃で１時間撹拌した。固体をろ過した溶液を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧下で留去して化合物72（0.9ｇ、収率98%）を得た。

[0458] 工程５　：　シクロプロピル 2-（3-（3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ）-6-メチルピリダジン-4-カルボニル）-1-（2, 4-ジメチルベンジル）ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：cyclopropyl 2-(3-(3-cyclopropyl-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）（化合物b-184）への転化

[0459] [化93]



[0460]　化合物72（0.18ｇ）をN,N-ジメチルホルムアミド（1mL）に溶解させた。これに、０℃で3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボン酸（0.15ｇ）、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.2g）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.01g）およびトリエチルアミン（0.29mL）を加え、室温下で18時間撹拌した。

得られた液にメタノールを加え、分取高速液体クロマトグラフィー（展開溶媒：水／アセトニトリル）で精製し、化合物b-184（0.1ｇ、収率40%）を得た。

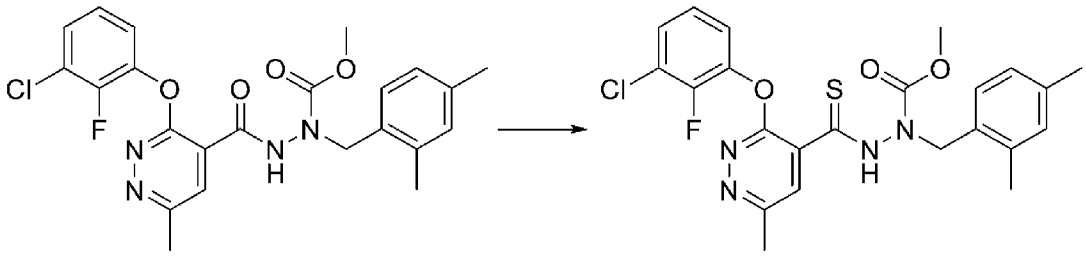
[0461] 〔製造例２６〕

以下の工程にて、メチル（Z)-2-((3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-イル)(メチルチオ)メチレン-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl (Z)-2-((3-(3-chloro-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazin-4-yl)(methylthio)methylene)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物番号b-219））を製造した。

[0462] 工程１　：　メチル2-(3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボノチオイル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボ

キシレート（英名：methyl 2-(3-(3-chloro-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazine-4-carbonothioyl)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate）への転化

[0463] [化94]



b-23 73

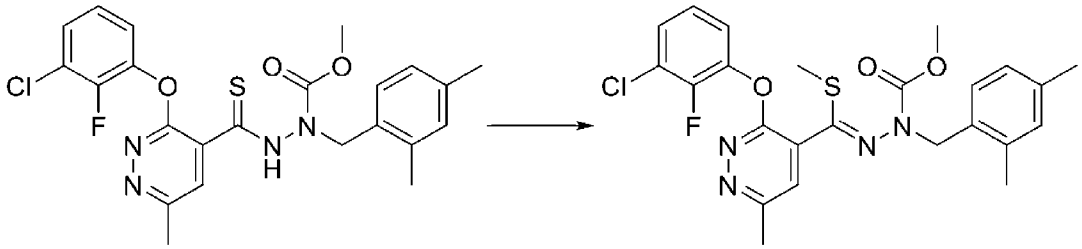
[0464] メチル2-(3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（0.50g）を1.4-ジオキサン（3.5mL）に溶解させた。これに、ローソン試薬（0.43g）を加え、80℃で2時間攪拌させた。

溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ｎ－ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、メチル2-(3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボノチオイル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート0.045g（収率9%）を得た。

[0465] 工程２ ： メチル（Z)-2-((3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-イル)(メチルチオ)メチレン-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl (Z)-2-((3-(3-chloro-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazin-4-yl)(methylthio)methylene)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物番号b-219））への転化

[0466]

[化95]



73 b-219

[0467] メチル2-(3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボノチオイル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（0.05g）をアセトニトリル（0.34mL）に溶解させた。これにヨードメタン（0.044g）と炭酸カリウム（0.028g）を加え、室温で2時間攪拌させた。

反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、メチル（Z)-2-((3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-イル)(メチルチオ)メチレン-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（化合物番号b-219）0.054g（収率99%）を得た。

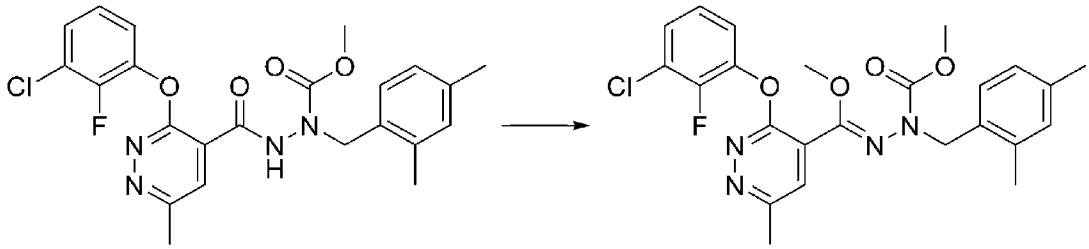
[0468] 〔製造例２７〕

以下の工程にて、メチル（Z)-2-((3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-イル)(メトキシ)メチレン-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl (Z)-2-((3-(3-chloro-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazin-4-yl)(methoxy)methylene)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物番号b-220）を製造した。

[0469] 工程１ ： メチル（Z)-2-((3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-イル)(メトキシ)メチレン-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（英名：methyl (Z)-2-((3-(3-chloro-2-fluorophenoxy)-6-methylpyridazin-4-yl)(methoxy)methylene)-1-(2,4-dimethylbenzyl)hydrazine-1-carboxylate（化合物番号b-220））への転化

[0470]

[化96]



b-23 b-220

[0471] メチル2-(3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-カルボニル)-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（0.10g）をジクロロメタン（0.70mL）に溶解させた。これに、0℃でトリメチルオキソニウムテトラフルオロボラート（0.063g）を加え、室温で3時間攪拌させた。

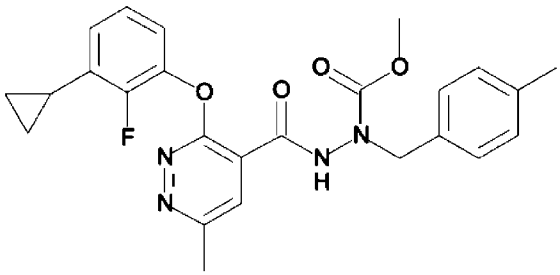
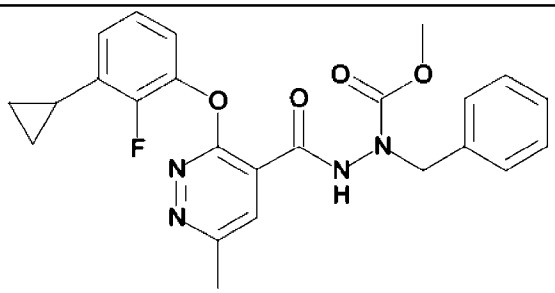
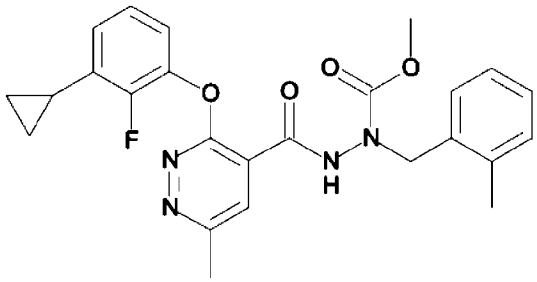
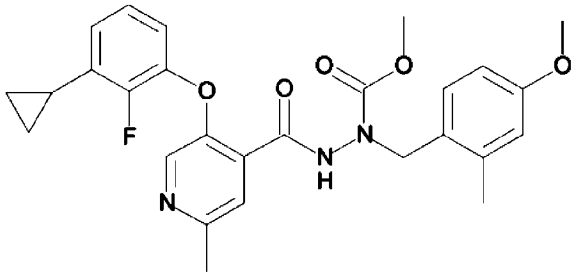
反応溶液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、メチル（Z)-2-((3-(3-クロロ-2-フルオロフェノキシ)-6-メチルピリダジン-4-イル)(メトキシ)メチレン-1-(2,4-ジメチルベンジル)ヒドラジン-1-カルボキシレート（化合物番号b-220）0.1g（収率100%）を得た。

[0472] 上記の製造例と同様の工程を経て、表２に示す化合物を製造した。特性欄に融点または外観（AMORPHOUSまたはVISCOUS OIL）を記した。外観がAMORPHOUSまたはVISCOUS OILであるものについてはLCMS保持時間を記した。

[0473]

[表21]

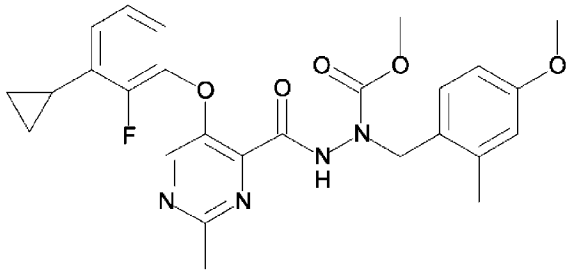
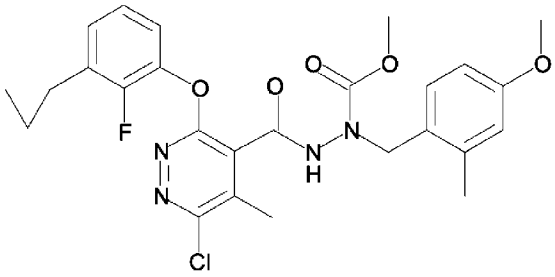
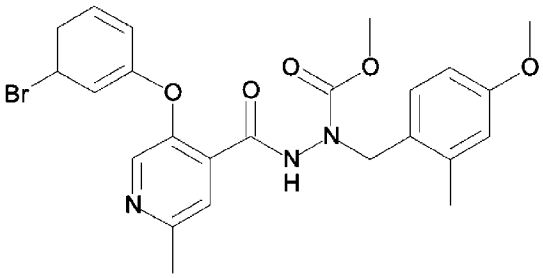
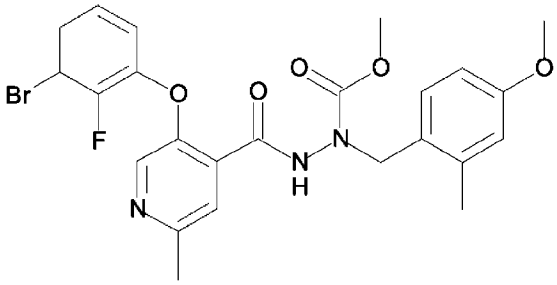
表 2

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-101		m.p.:54-56℃	
b-102		m.p.:55-57℃	
b-103		m.p.:54-56℃	
b-104		VISCOUS OIL	1.65min

[0474]

[表22]

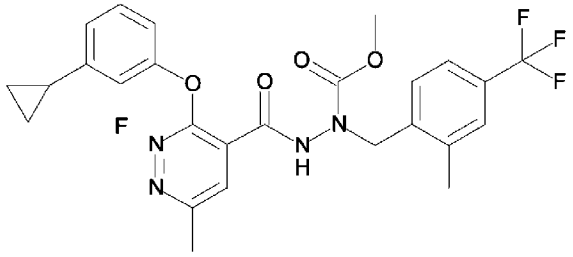
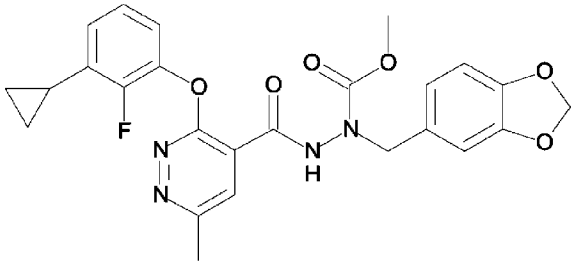
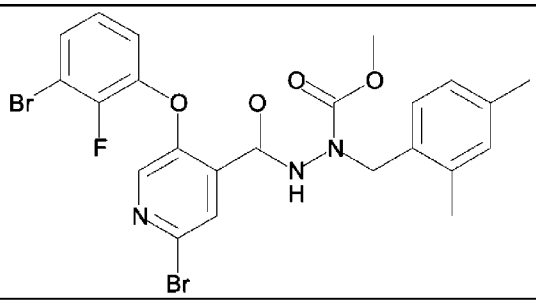
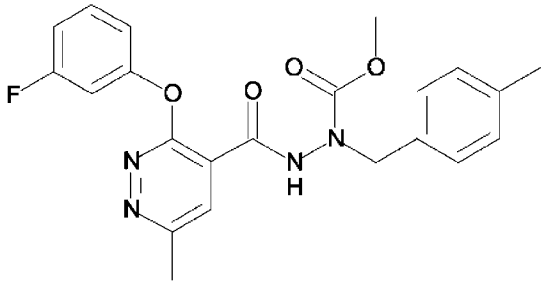
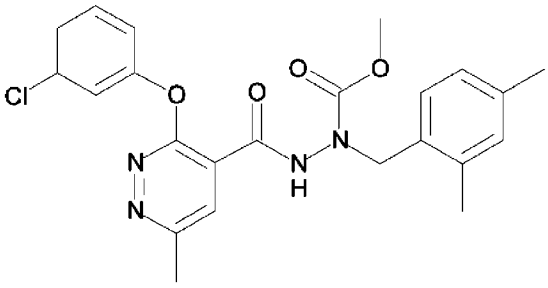
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-105		VISCOUS OIL	1.63min
b-106		VISCOUS OIL	1.70min
b-107		VISCOUS OIL	1.60min
b-108		VISCOUS OIL	1.59min

[0475]

[表23]

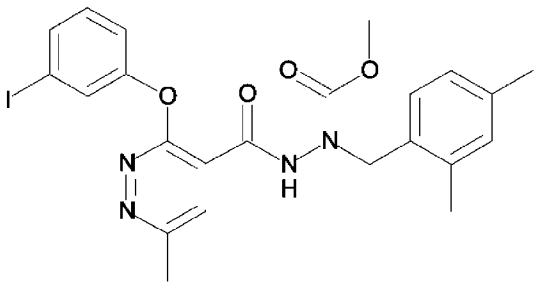
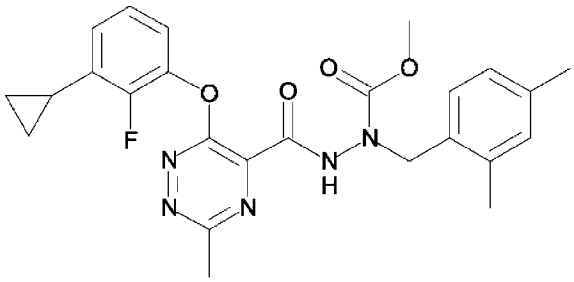
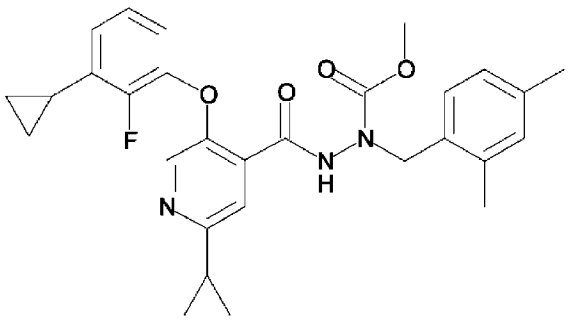
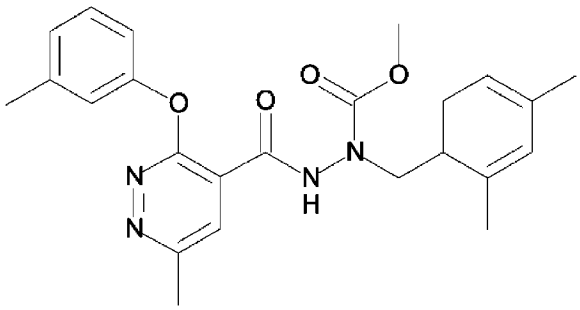
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-109		VISCOUS OIL	1.75min
b-110		VISCOUS OIL	1.49min
b-111		AMORPHOUS	1.87min
b-112		m.p.:117-119℃	
b-113		VISCOUS OIL	1.63min

[0476]

[表24]

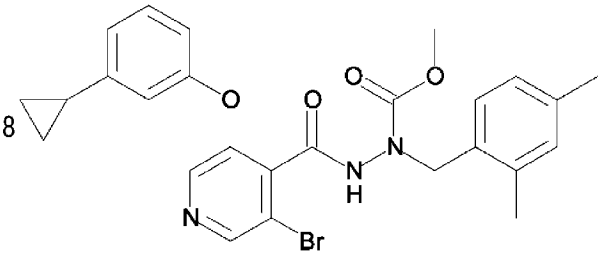
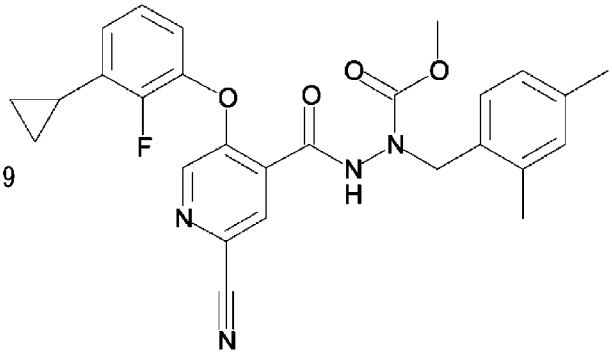
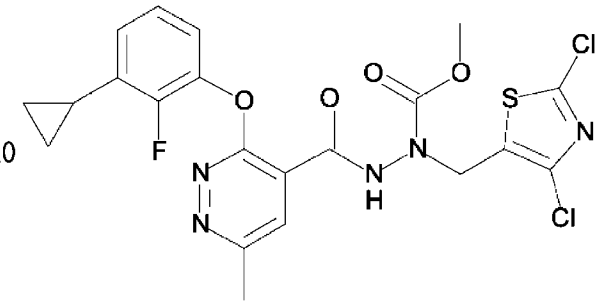
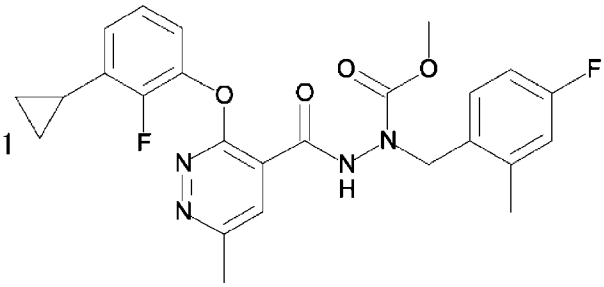
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-114		VISCOUS OIL	1.70min
b-115		m.p.:70-72℃	
b-116		VISCOUS OIL	1.95min
b-117		AMORPHOUS	1.6min

[0477]

[表25]

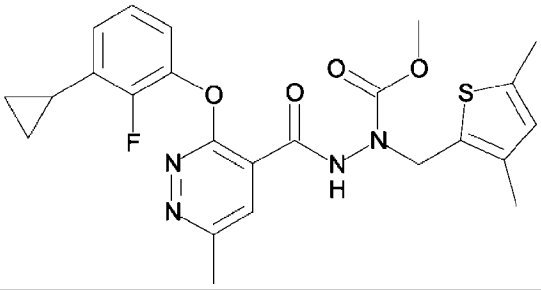
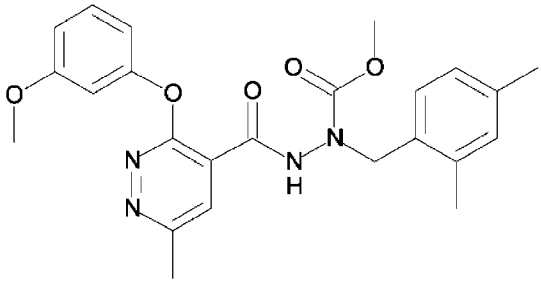
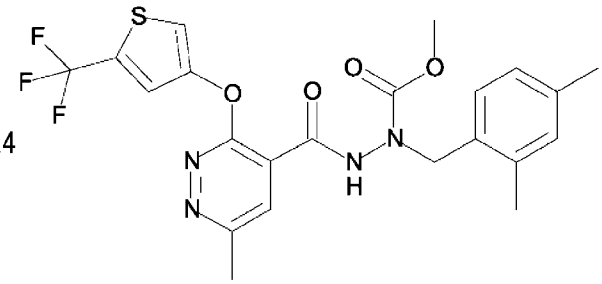
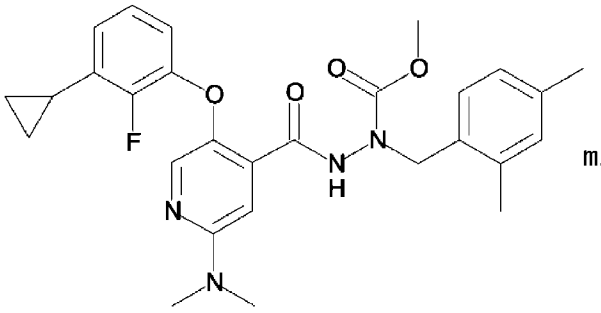
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-118		VISCOUS OIL	1.79min
b-119		AMORPHOUS	1.83min
b-120		VISCOUS OIL	1.63min
b-121		VISCOUS OIL	1.63min

[0478]

[表26]

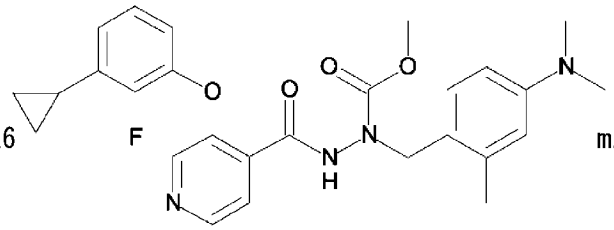
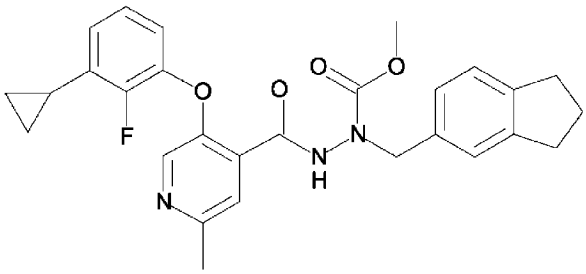
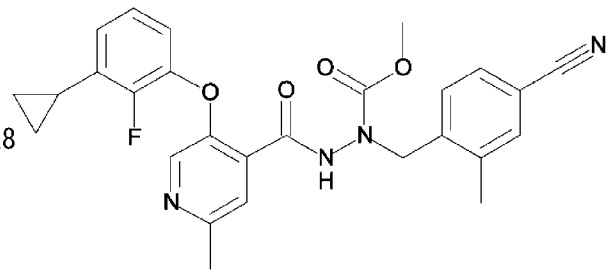
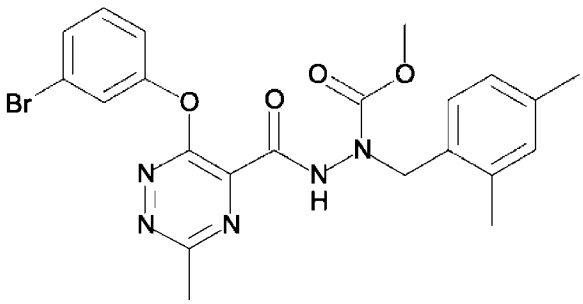
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-122		VISCOUS OIL	1.69min
b-123		VISCOUS OIL	1.51min
b-124		VISCOUS OIL	1.72min
b-125		m.p.:151-153℃	

[0479]

[表27]

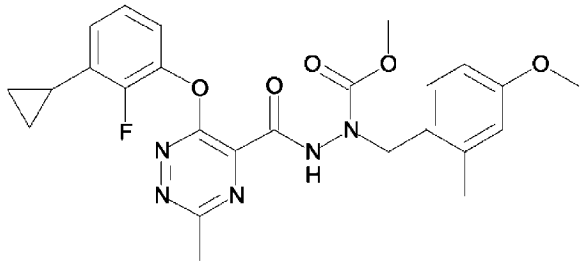
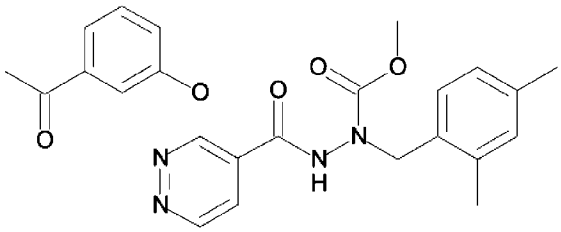
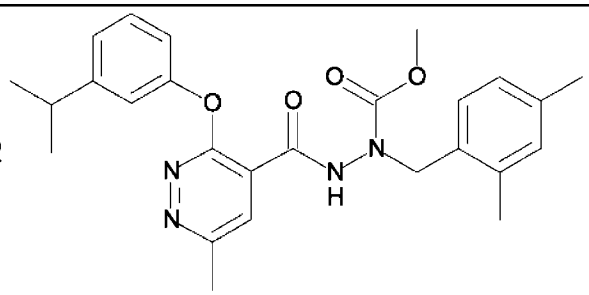
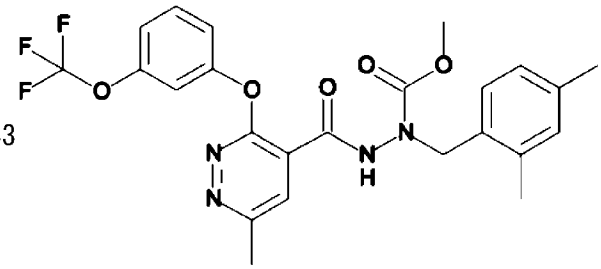
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-126		m.p.:160-162℃	
b-127		m.p.:53-55℃	
b-128		VISCOUS OIL	1.59min
b-129		m.p.:73-75℃	

[0480]

[表28]

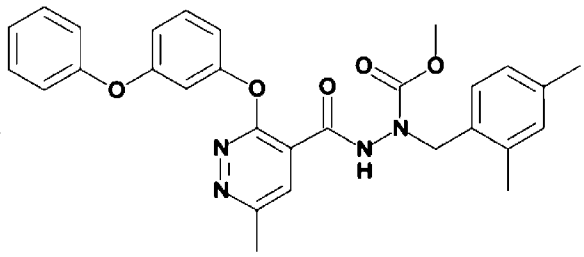
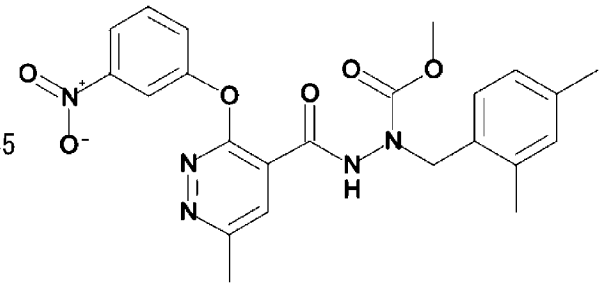
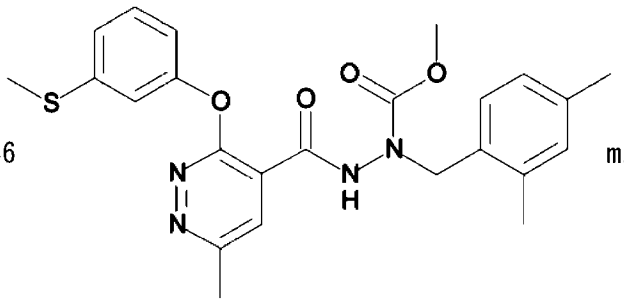
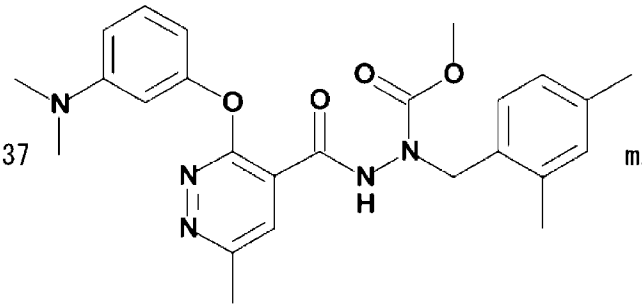
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-130		m.p.:68-70℃	
b-131		m.p.:85-87℃	
b-132		VISCOUS OIL	1.59min
b-133		m.p.:55-57℃	

[0481]

[表29]

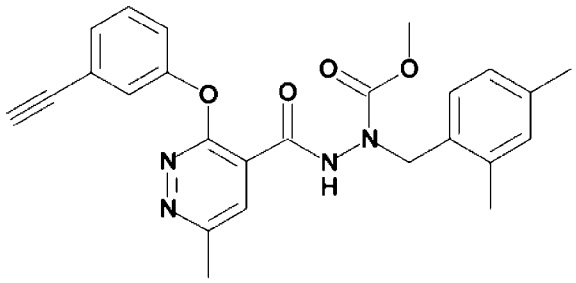
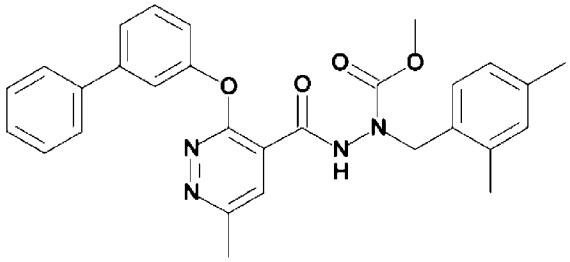
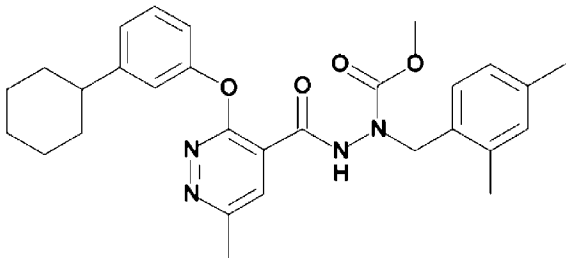
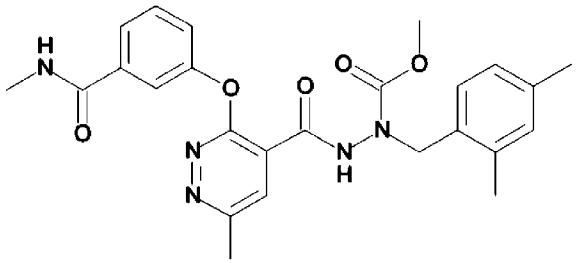
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-134		m.p.:60-62℃	
b-135		m.p.:78-80℃	
b-136		m.p.:58-60℃	
b-137		m.p.:72-74℃	

[0482]

[表30]

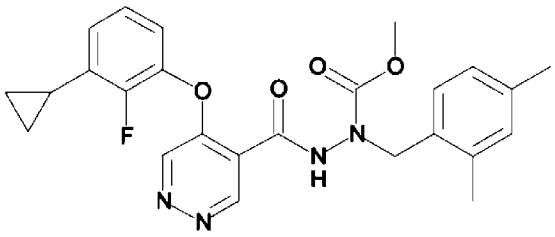
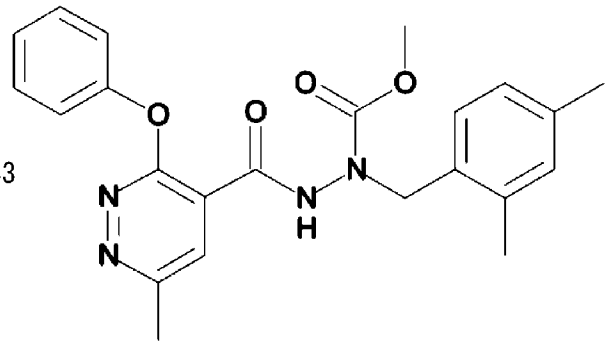
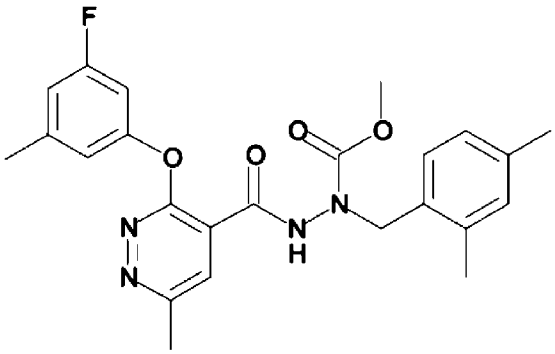
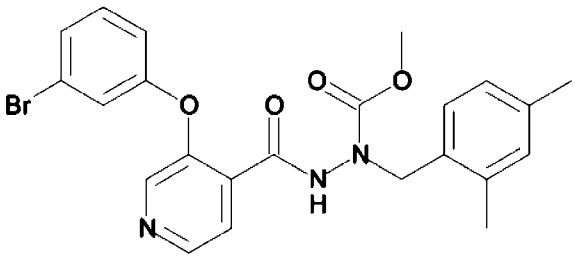
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-138		m.p.:71-73℃	
b-139		m.p.:68-70℃	
b-140		m.p.:70-72℃	
b-141		m.p.:99-101℃	

[0483]

[表31]

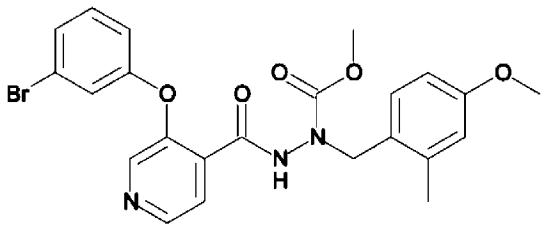
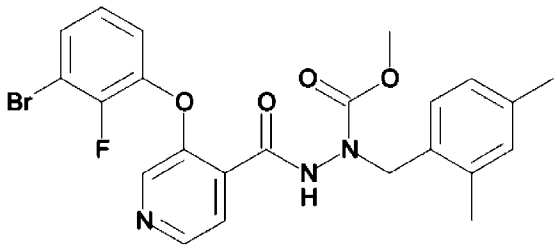
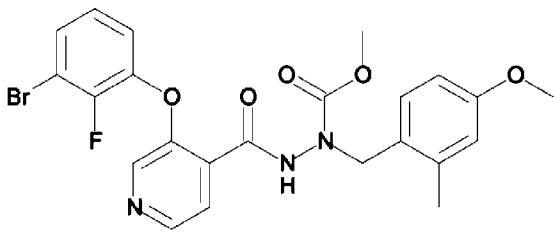
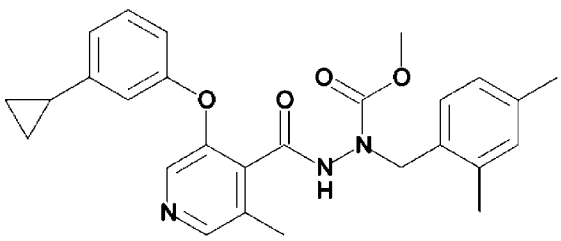
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-142		VISCOUS OIL	1.61min
b-143		VISCOUS OIL	1.56min
b-144		VISCOUS OIL	1.65min
b-145		VISCOUS OIL	1.71min

[0484]

[表32]

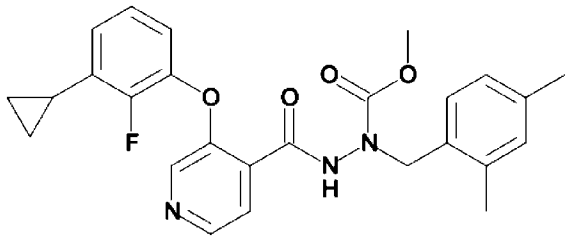
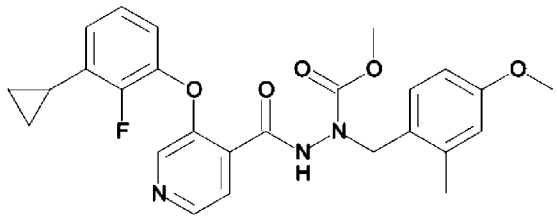
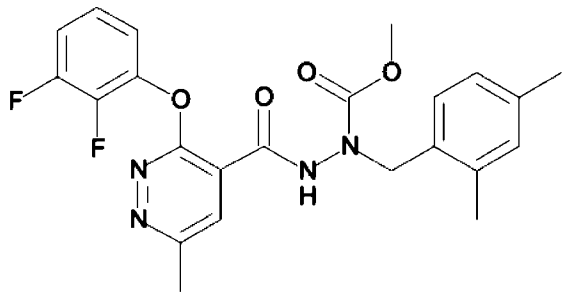
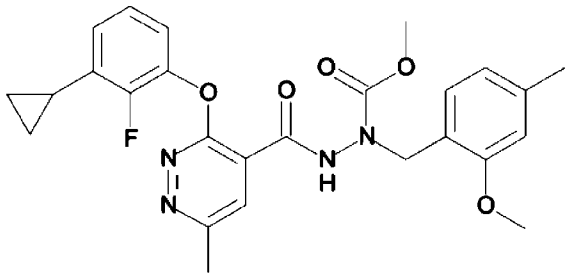
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-146		VISCOUS OIL	1.57min
b-147		VISCOUS OIL	1.69min
b-148		VISCOUS OIL	1.56min
b-149		VISCOUS OIL	1.70min

[0485]

[表33]

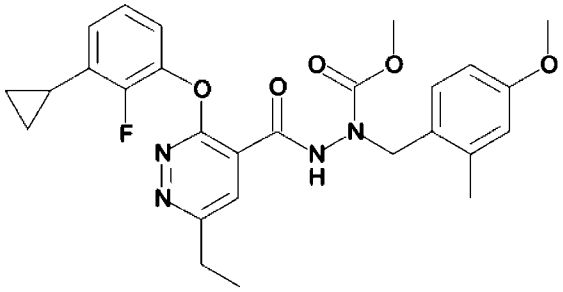
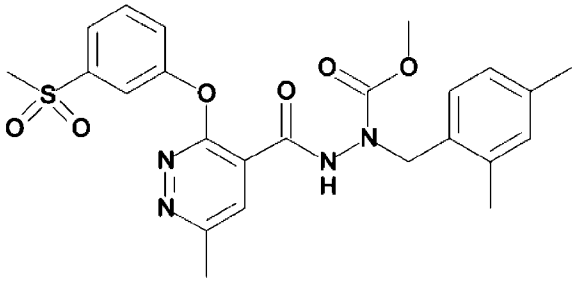
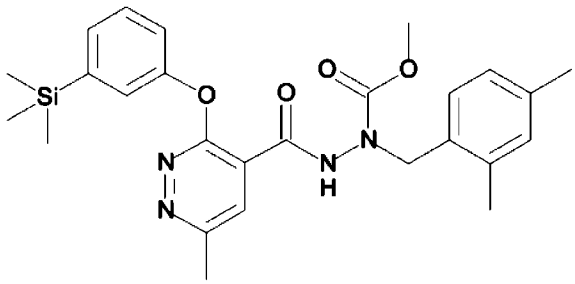
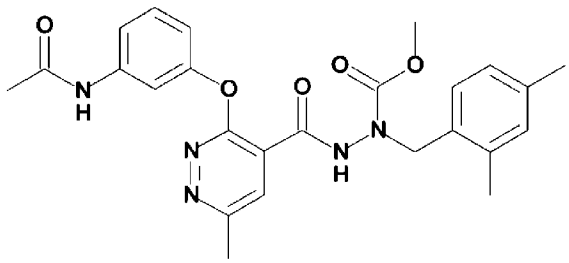
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-150		VISCOUS OIL	1.74min
b-151		VISCOUS OIL	1.61min
b-152		m.p.:70-72℃	
b-153		m.p.:68-73℃	

[0486]

[表34]

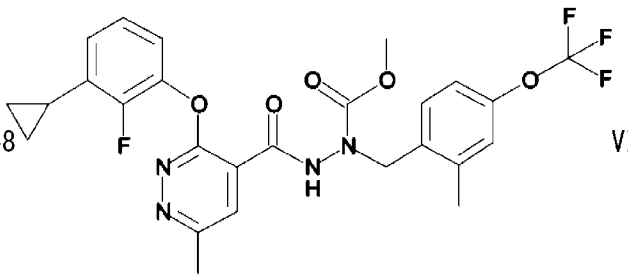
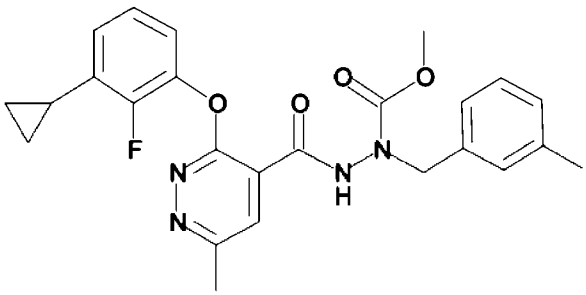
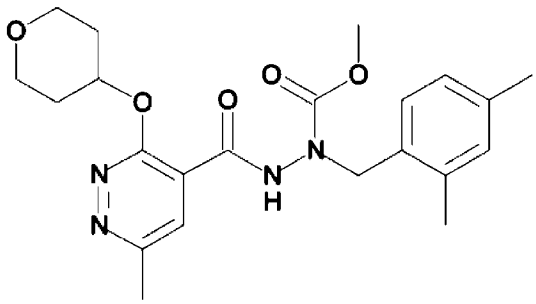
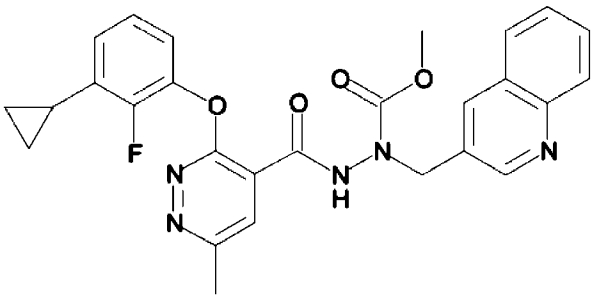
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-154		m.p.:75-77℃	
b-155		m.p.:95-97℃	
b-156		m.p.:55-57℃	
b-157		m.p.:110-112℃	

[0487]

[表35]

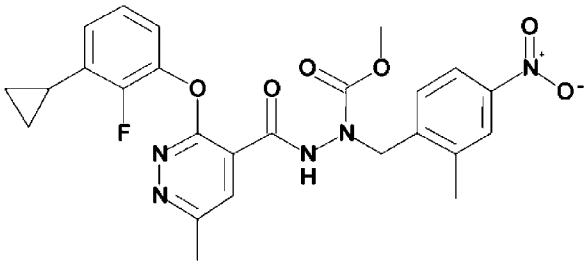
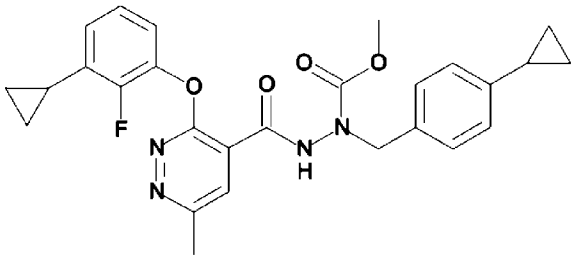
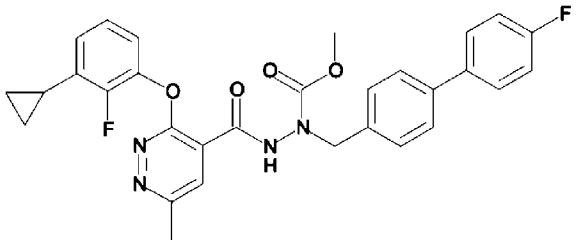
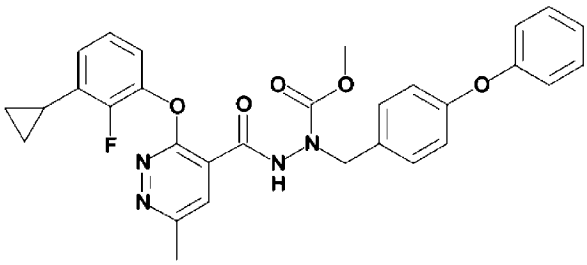
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-158		VISCOUS OIL	1.82min
b-159		VISCOUS OIL	1.66min
b-160		VISCOUS OIL	1.36min
b-161		m.p.:72-78℃	

[0488]

[表36]

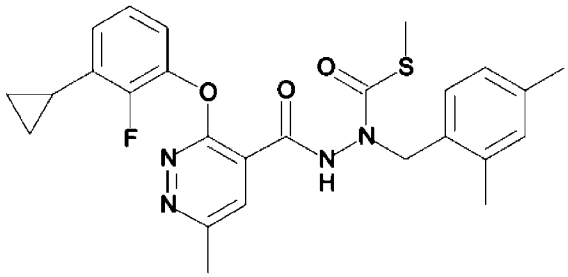
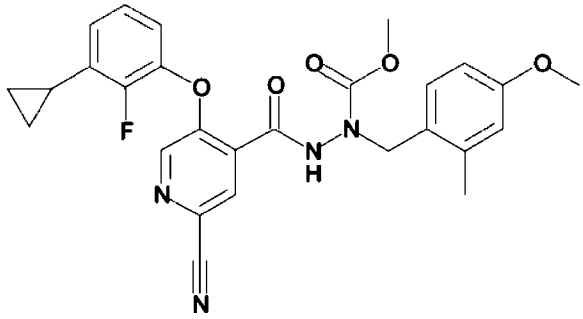
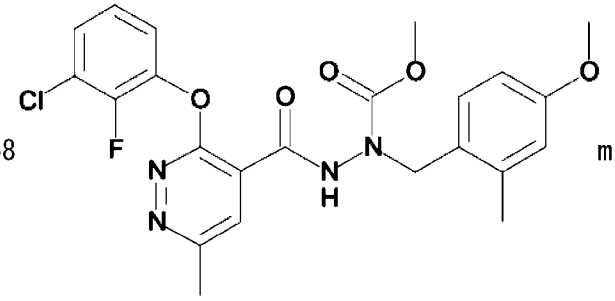
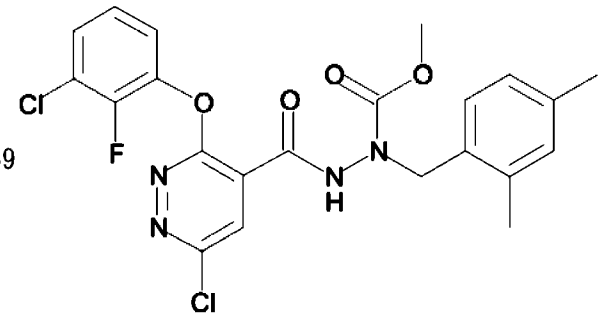
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-162		m.p.:77-82℃	
b-163		m.p.:65-71℃	
b-164		m.p.:69-74℃	
b-165		m.p.:62-67℃	

[0489]

[表37]

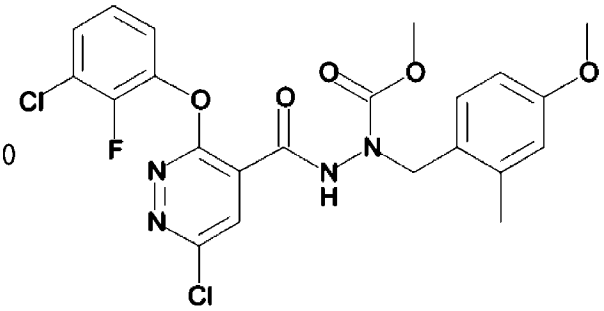
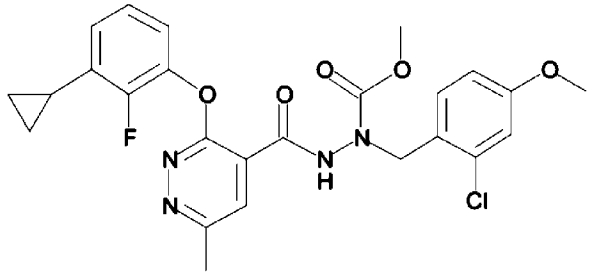
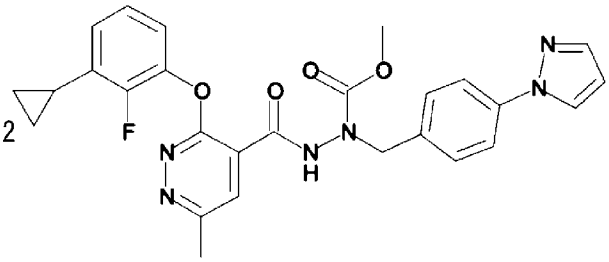
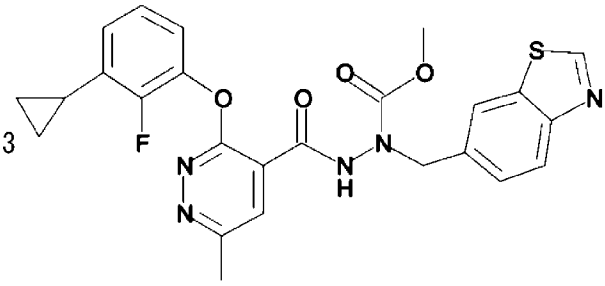
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-166		VISCOUS OIL	1.84min
b-167		m.p.:68-76℃	
b-168		m.p.:107-109℃	
b-169		m.p.:74-76℃	

[0490]

[表38]

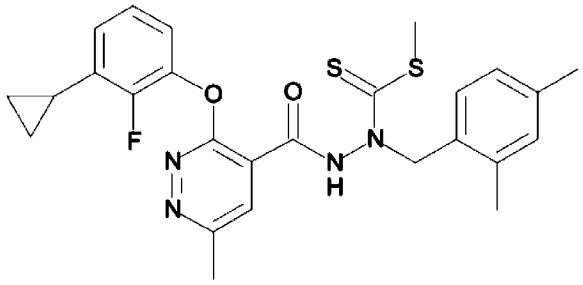
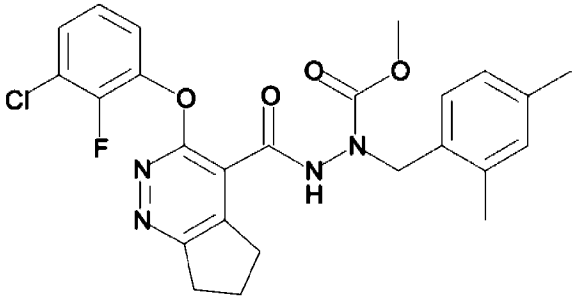
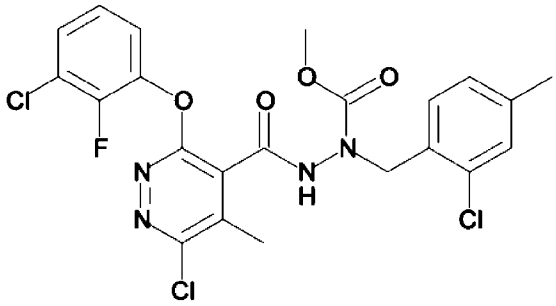
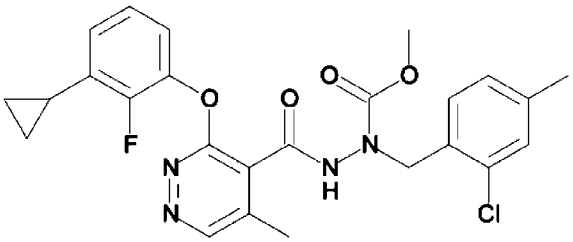
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-170		m.p.:74-76℃	
b-171		m.p.:57-62℃	
b-172		m.p.:74-80℃	
b-173		m.p.:76-80℃	

[0491]

[表39]

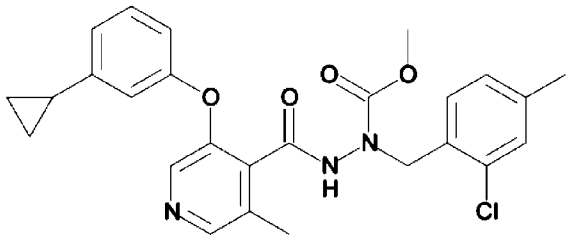
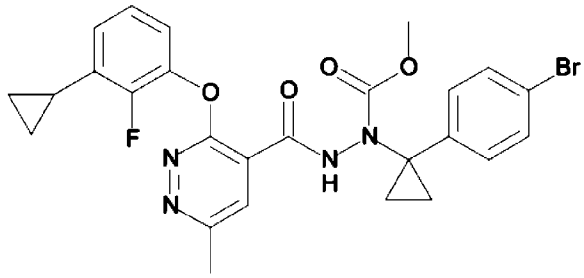
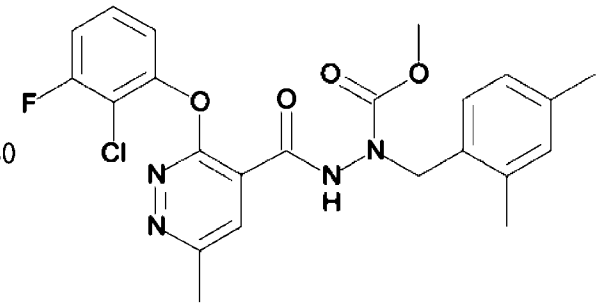
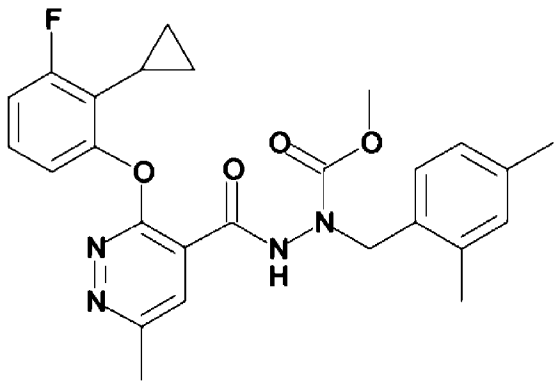
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-174		m.p.:84-86℃	
b-175		VISCOUS OIL	1.65min
b-176		m.p.:134-136℃	
b-177		m.p.:94-96℃	

[0492]

[表40]

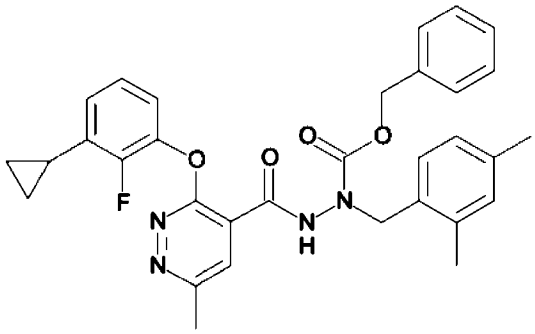
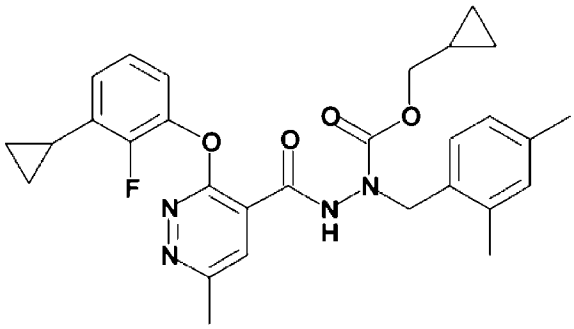
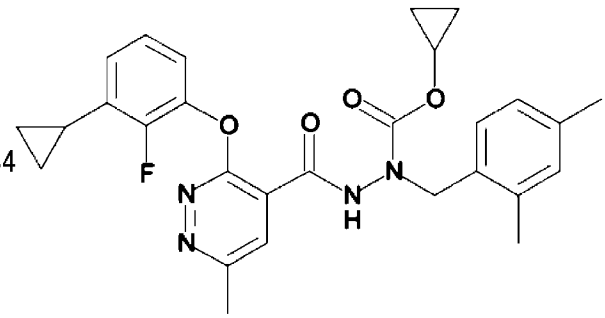
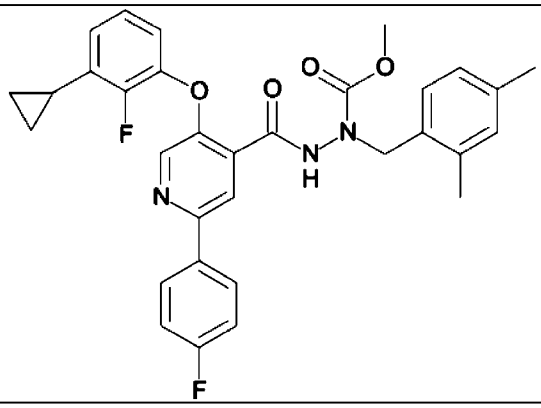
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-178		AMORPHOUS	1.73min
b-179		VISCOUS OIL	1.82min
b-180		m.p.:75-77℃	
b-181		VISCOUS OIL	1.73min

[0493]

[表41]

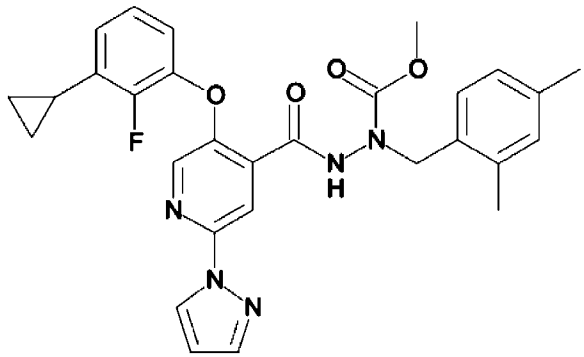
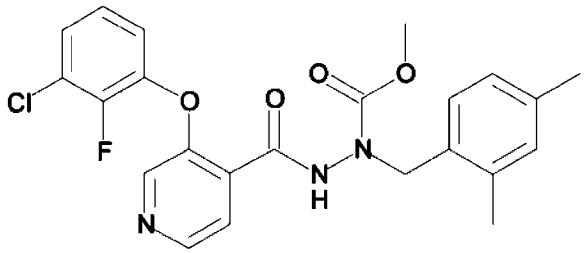
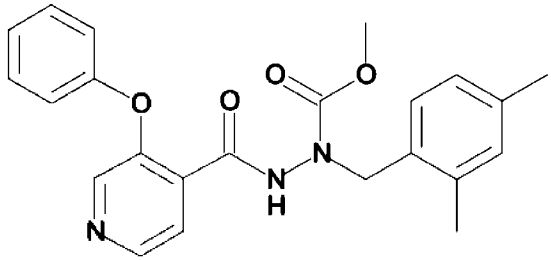
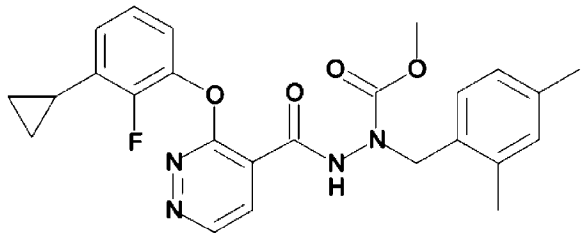
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-182		m.p.:57-59℃	
b-183		m.p.:48-50℃	
b-184		m.p.:45-47℃	
b-185		VISCOUS OIL	2.09min

[0494]

[表42]

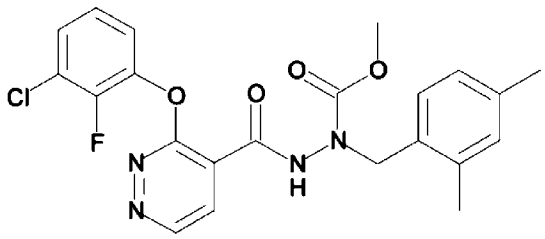
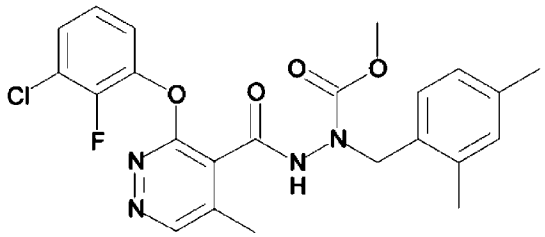
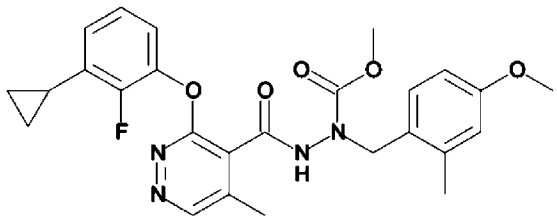
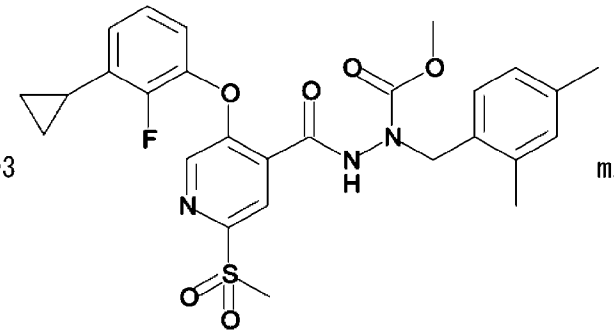
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-186		VISCOUS OIL	1.97min
b-187		AMORPHOUS	1.67min
b-188		AMORPHOUS	1.58min
b-189		AMORPHOUS	1.70min

[0495]

[表43]

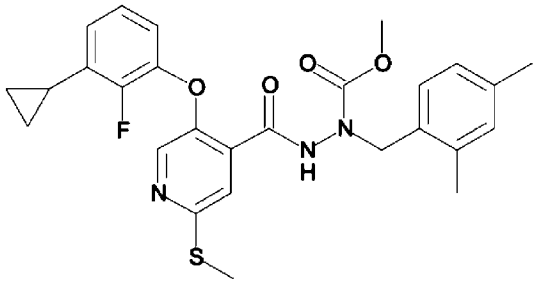
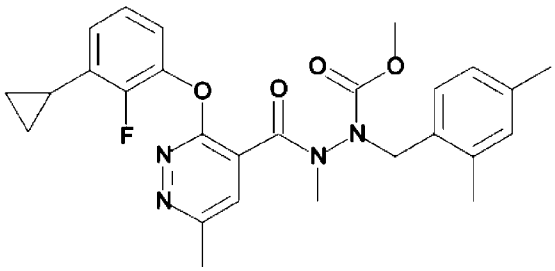
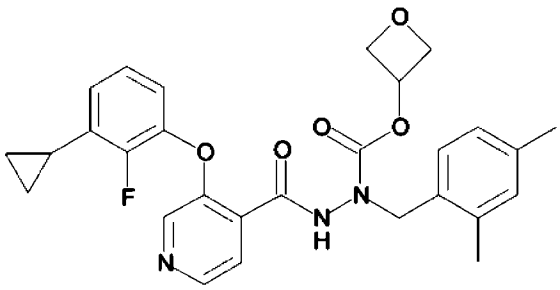
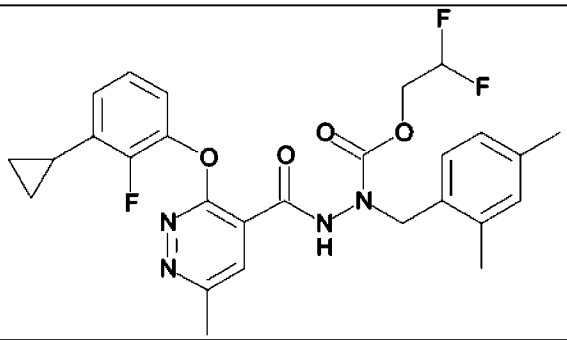
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-190		AMORPHOUS	1.63min
b-191		AMORPHOUS	1.62min
b-192		m.p.:155-157℃	
b-193		m.p.:130-132℃	

[0496]

[表44]

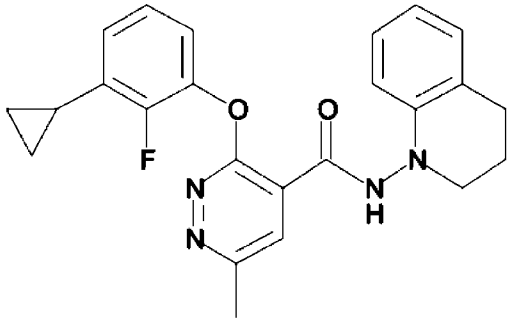
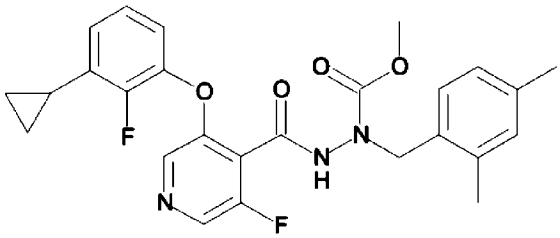
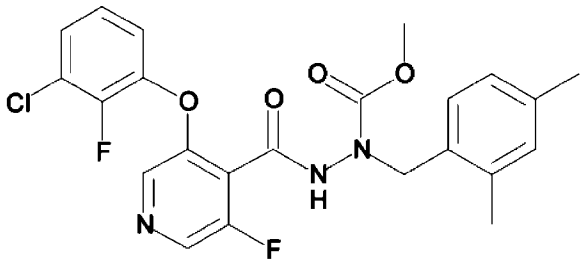
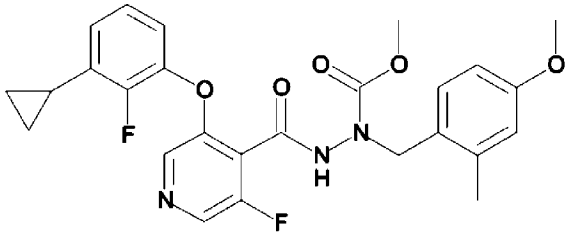
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-194		VISCOUS OIL	2.01min
b-195		m.p.:68-70℃	
b-196		m.p.:82-84℃	
b-197		AMORPHOUS	1.81min

[0497]

[表45]

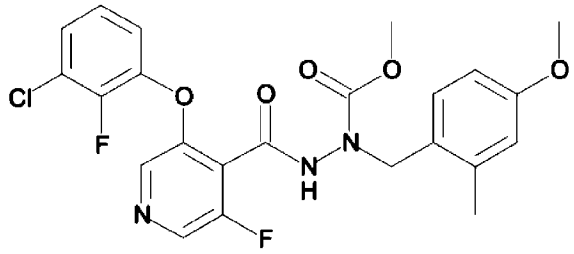
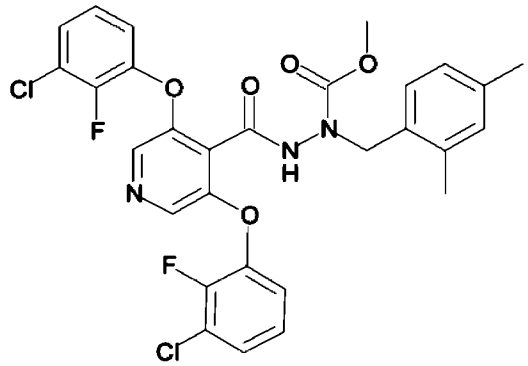
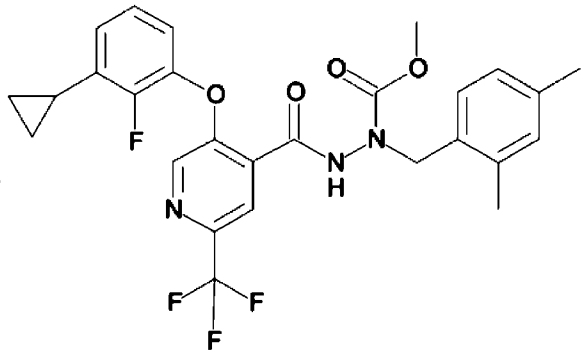
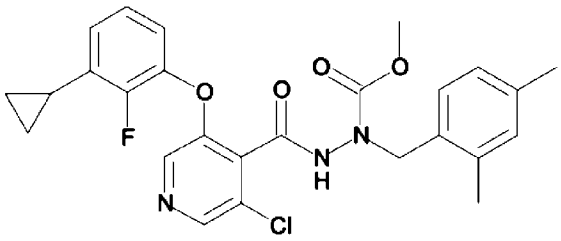
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-198		AMORPHOUS	1.71min
b-199		m.p.:58-60℃	
b-200		AMORPHOUS	1.72min
b-201		AMORPHOUS	1.67min

[0498]

[表46]

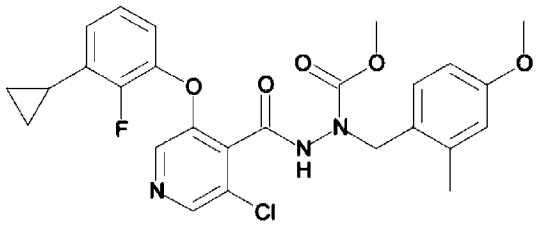
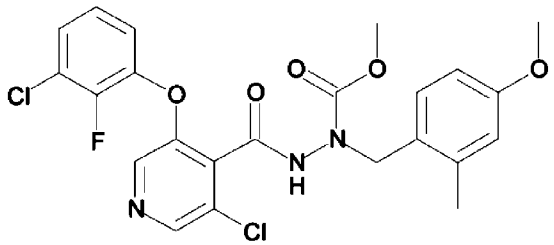
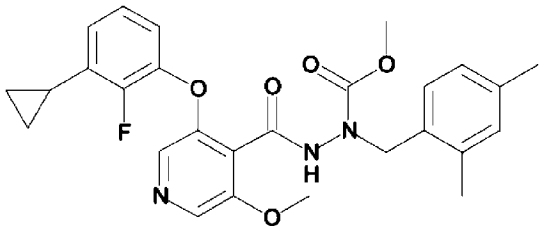
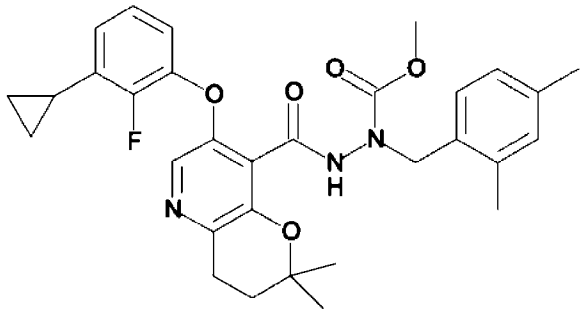
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-202		AMORPHOUS	1.59min
b-203		m.p.:108-110℃	
b-204		AMORPHOUS	1.97min
b-205		m.p.:161-163℃	

[0499]

[表47]

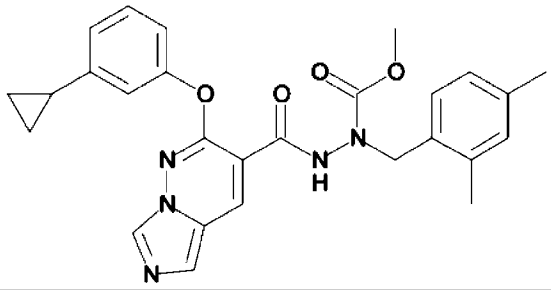
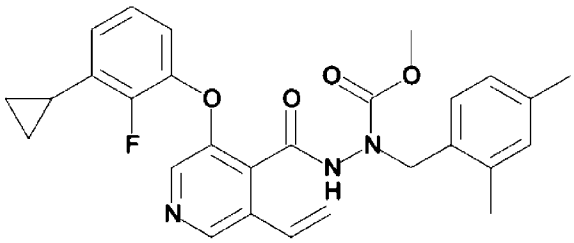
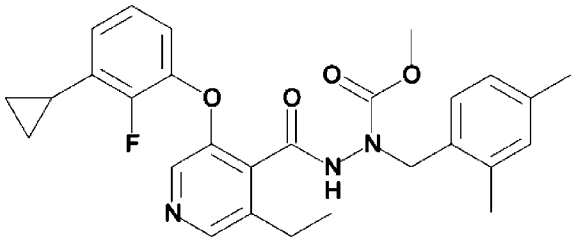
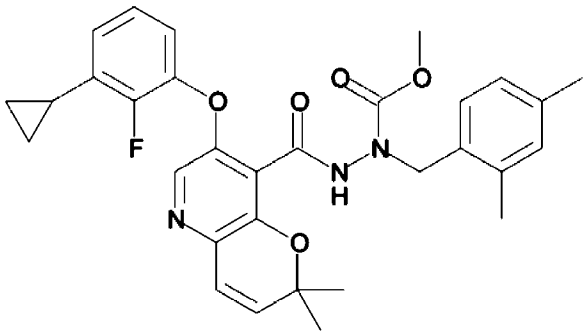
表 2(続き)

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-206		AMORPHOUS	1.70min
b-207		m.p.:67-69℃	
b-208		m.p.:142-144℃	
b-209		m.p.:87-89℃	

[0500]

[表48]

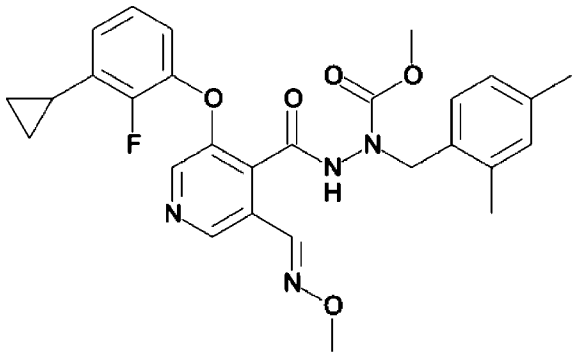
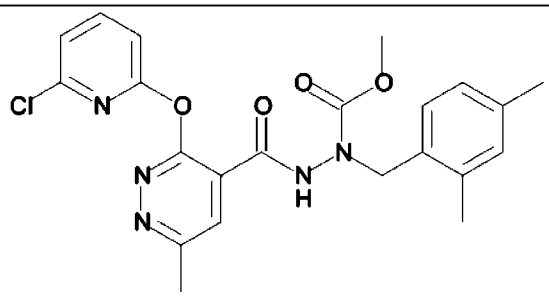
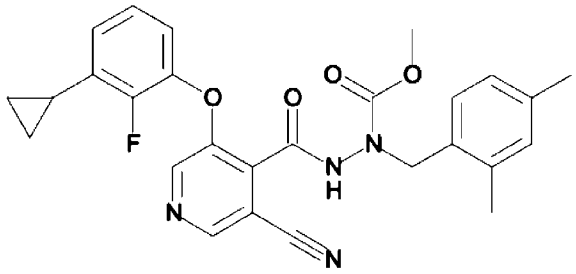
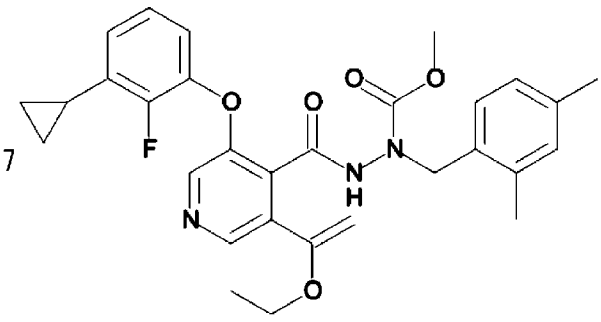
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-210		m.p.:130-132℃	
b-211		m.p.:65-67℃	
b-212		VISCOUS OIL	1.76min
b-213		m.p.:80-82℃	

[0501]

[表49]

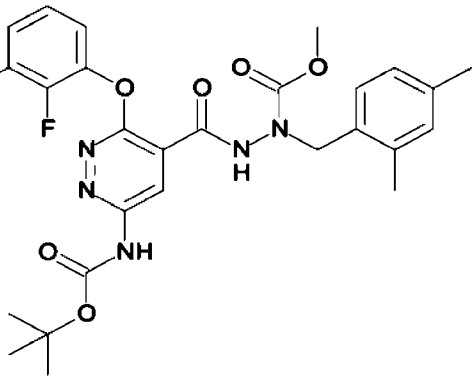
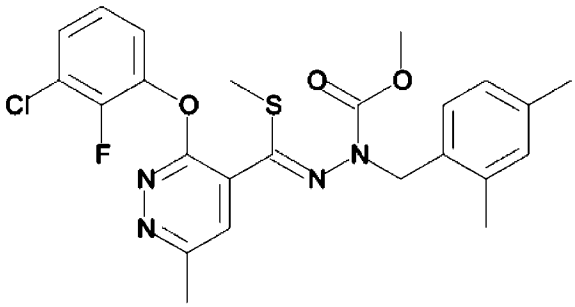
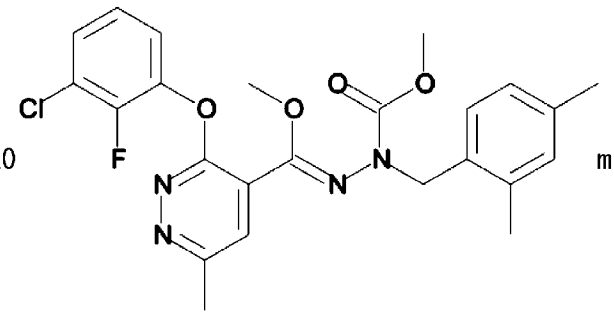
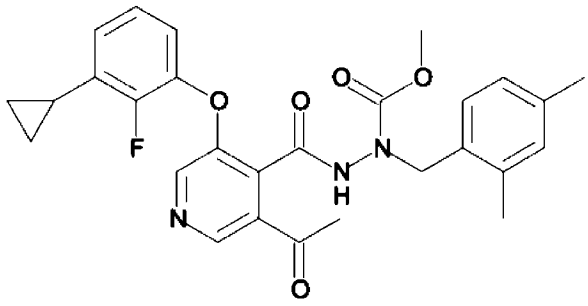
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-214		m.p.:80-82℃	
b-215		m.p.:88-90℃	
b-216		VISCOUS OIL	1.80min
b-217		VISCOUS OIL	1.82min

[0502]

[表50]

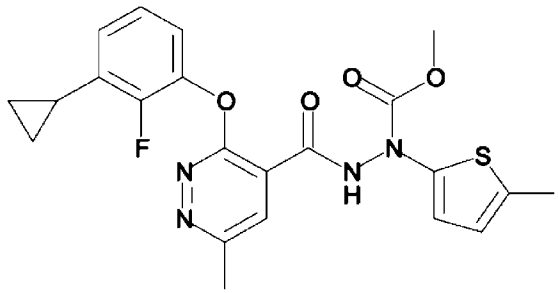
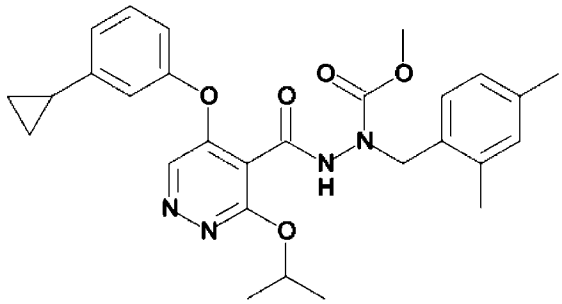
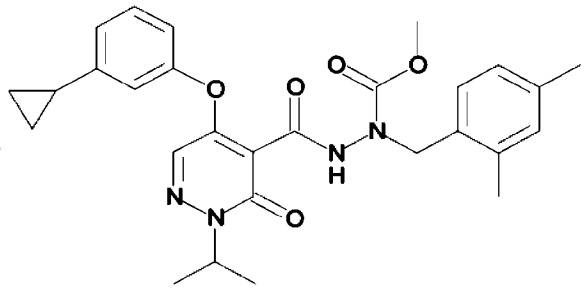
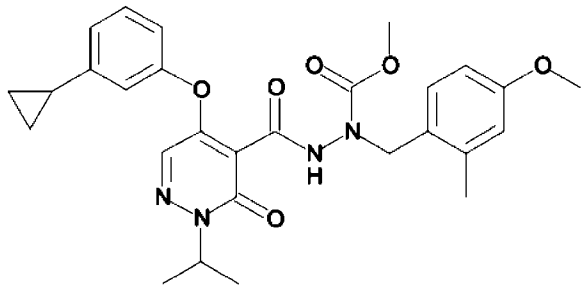
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-218		VISCOUS OIL	1.86min
b-219		m.p.:58-60℃	
b-220		m.p.:102-104℃	
b-221		VISCOUS OIL	1.69min

[0503]

[表51]

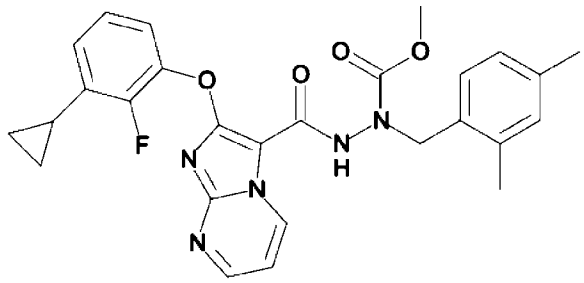
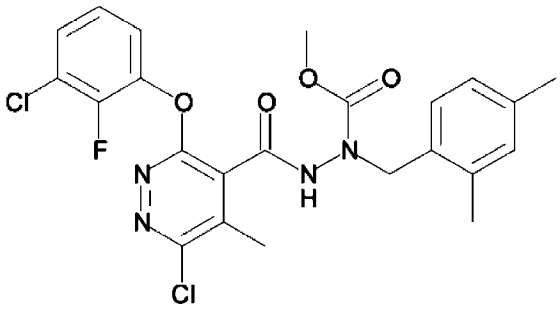
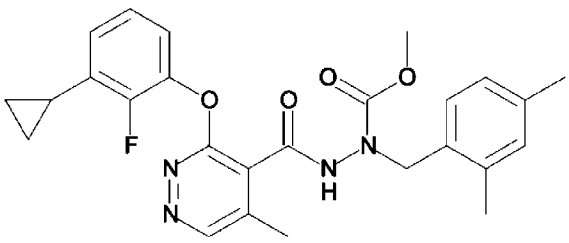
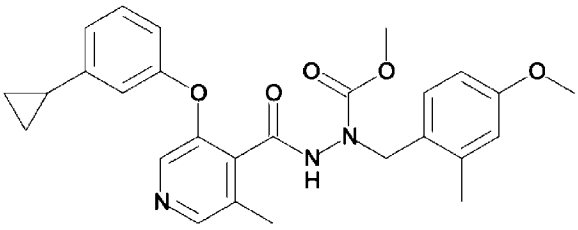
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-222		VISCOUS OIL	1.61min
b-223		AMORPHOUS	1.74min
b-224		VISCOUS OIL	1.86min
b-225		VISCOUS OIL	1.75min

[0504]

[表52]

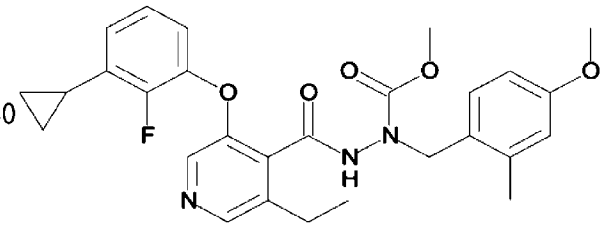
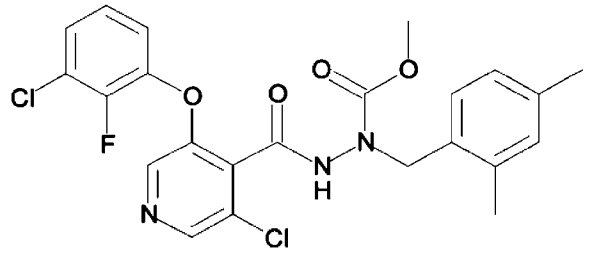
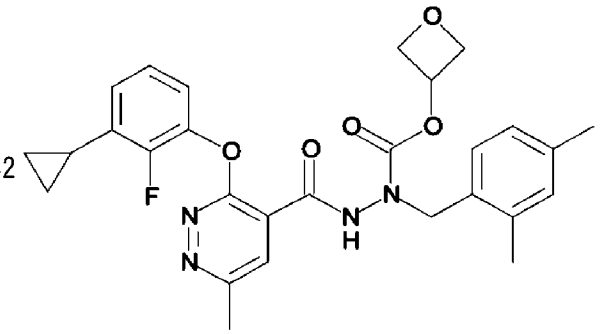
表 2（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-226		VISCOUS OIL	1.75min
b-227		m.p.:117-119℃	
b-228		m.p.:85-87℃	
b-229		VISCOUS OIL	1.59min

[0505]

[表53]

表２（続き）

化合物番号	構造式	特性	LCMS(SQD2)保持時間
b-230		VISCOUS OIL	1.64min
b-231		m.p.:66-68℃	
b-232		VISCOUS OIL	1.70min

[0506] 本発明による効果を下記の殺菌効果試験および病害防除試験によって例示する。

[0507] （灰色かび病菌に対する殺菌効果試験）

灰色かび病菌（Botrytis cinerea、Vogel培地）の胞子懸濁液を用意した。本発明のヒドラジド化合物をジメチルスルホキシドに添加して薬剤液を得た。この薬剤液と前記の胞子懸濁液とを等量（体積基準）で混ぜ合わせて、本発明のヒドラジド化合物の濃度が２５体積ｐｐｍである試験液を得た。９６穴マイクロプレートに試験液を滴下した（薬剤処理区）。

ジメチルスルホキシドと前記の胞子懸濁液とを等量（体積基準）で混ぜ合わせて、対照液を得た。９６穴マイクロプレートに対照液を滴下した（無処理区）。

これらを２０℃、暗所に、５日間静置して、培養した。マイクロプレートリーダーを用いて、波長４０５ｎｍにおける濁度ＯＤを測定した。以下の式により生育阻害率を算出した。

生育阻害率（％）＝１００－１００×

｛［（培養後の薬剤処理区のＯＤ）－（培養前の薬剤処理区のＯＤ）］

／［（培養後の無処理区のＯＤ）－（培養前の無処理区のＯＤ）］｝

[0508] 化合物番号ｂ－１～ｂ－１８、ｂ－２０～ｂ－４０、ｂ－４２～ｂ－４６、ｂ－４８、ｂ－５０～ｂ－５５、ｂ－５７～ｂ－５９、ｂ－６１～ｂ－６４、ｂ－６６～ｂ－６９、ｂ－７１、ｂ－７２、ｂ－７４～ｂ－９０、ｂ－９２～ｂ－９４、ｂ－９６、ｂ－９８～ｂ－１３０、ｂ－１３３、ｂ－１３５～ｂ－１３６、ｂ－１３８、ｂ－１４２～ｂ－１５４、ｂ－１５８～ｂ－１５９、ｂ－１６２～ｂ－１７２、ｂ－１７５～ｂ－１８０、ｂ－１８２～ｂ－１９７、ｂ－１９９～ｂ－２０２、ｂ－２０４～ｂ－２０９、ｂ－２１１～ｂ－２１５、ｂ－２１７、ｂ－２１８、ｂ－２２０、ｂ－２２１、ｂ－２２３～ｂ－２２５、およびｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物について灰色かび病菌に対する殺菌効果試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の生育阻害率を示した。

[0509] （リンゴ炭疽病菌に対する殺菌効果試験）

灰色かび病菌（Botrytis cinerea、Vogel培地）の胞子懸濁液をリンゴ炭疽病菌（Colletotrichum acutatum、Czapek培地）の胞子懸濁液に変え、且つ静置時の温度および期間を２５℃および４日間に変えた以外は灰色かび病菌に対する殺菌効果試験と同じ方法で濁度を測定し、生育阻害率を算出した。

[0510] 化合物番号ｂ－１～ｂ－３４、ｂ－３６～ｂ－６９、ｂ－７１、ｂ－７２

、ｂ－７４～ｂ－８４、ｂ－８７～ｂ－９０、ｂ－９２～ｂ－９４、ｂ－９６、ｂ－１００～ｂ－１３３、ｂ－１３５～ｂ－１３８、ｂ－１４２～ｂ－１５４、ｂ－１５８～ｂ－１５９、ｂ－１６１～ｂ－１７９、ｂ－１８２～ｂ－１９７、ｂ－１９９～ｂ－２１７、ｂ－２２０～ｂ－２２１、ｂ－２２３～ｂ－２２５、および、ｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物についてリンゴ炭疽病菌に対する殺菌効果試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の生育阻害率を示した。

[0511] （ブドウ晩腐病菌に対する殺菌効果試験）

灰色かび病菌（Botrytis cinerea、Vogel培地）の胞子懸濁液をブドウ晩腐病菌（Glomerella cingulata、Vogel培地）の胞子懸濁液に変え、且つ静置時の温度および期間を２５℃および３日間に変えた以外は灰色かび病菌に対する殺菌効果試験と同じ方法で濁度を測定し、生育阻害率を算出した。

[0512] 化合物番号ｂ－１～ｂ－１８、ｂ－２０～ｂ－３４、ｂ－３６～ｂ－６９、ｂ－７１～ｂ－９０、ｂ－９２～ｂ－９４、ｂ－９６～ｂ－９７、ｂ－１００～ｂ－１０３、ｂ－１０５～ｂ－１３３、ｂ－１３５～ｂ－１３８、ｂ－１４２～ｂ－１５４、ｂ－１５８～ｂ－１５９、ｂ－１６１～ｂ－１７９、ｂ－１８２～ｂ－２１７、ｂ－２２０～ｂ－２２５、および、ｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物についてブドウ晩腐病菌に対する殺菌効果試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の生育阻害率を示した。

[0513] （コムギ赤かび病菌に対する殺菌効果試験）

灰色かび病菌（Botrytis cinerea、Vogel培地）の胞子懸濁液をコムギ赤かび病菌（Fusarium graminearum、SD培地）の胞子懸濁液に変え、且つ静置時の温度および期間を２５℃および４日間に変えた以外は灰色かび病菌に対する殺菌効果試験と同じ方法で濁度を測定し、生育阻害率を算出した。

[0514] 化合物番号ｂ－１、ｂ－３、ｂ－６～ｂ－８、ｂ－１４～ｂ－１６、ｂ－２２、ｂ－２３、ｂ－２７、ｂ－２８、ｂ－３１～ｂ－３４、ｂ－３６～ｂ－３８、ｂ－４２、ｂ－４３、ｂ－４５、ｂ－４６、ｂ－５３、ｂ－５５、ｂ－６７、ｂ－７４～ｂ－７７、ｂ－８０、ｂ－８７、ｂ－８８、ｂ－９０

、ｂ－９４、ｂ－１０６～ｂ－１０８、ｂ－１１１～ｂ－１１３、ｂ－１１６～ｂ－１１９、ｂ－１２４、ｂ－１２６～ｂ－１２８、ｂ－１３５、ｂ－１３８、ｂ－１４３、ｂ－１４５～ｂ－１５０、ｂ－１５２～ｂ－１５４、ｂ－１６７～ｂ－１７１、ｂ－１７５～ｂ－１７８、ｂ－１８４、ｂ－１８７、ｂ－１８８、ｂ－１９１、ｂ－１９４、ｂ－１９６、ｂ－１９９、ｂ－２００、ｂ－２０２、ｂ－２０４、ｂ－２０７～ｂ－２０９、ｂ－２１１～ｂ－２１５、ｂ－２１７、ｂ－２２３、および、ｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物についてコムギ赤かび病菌に対する殺菌効果試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の生育阻害率を示した。

[0515] （キュウリ灰色かび病の防除試験）

本発明のヒドラジド化合物５質量部、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド９３．５質量部、およびポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート１．５質量部を混ぜ合わせて、有効成分５質量％の乳剤（１）を得た。

[0516] 前記乳剤（１）に水を加え、本発明のヒドラジド化合物の濃度が１２５質量ｐｐｍまたは２５質量ｐｐｍである薬剤液を得た。続いて育苗用ポットで栽培したキュウリ幼苗（品種「地這」系、子葉期）に前記薬剤液を散布し、次いで風乾した。その後、これに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た（処理区）。対照として、薬剤液を散布しなかったキュウリ幼苗に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た（無処理区）。それらを２０℃の湿室に静置した。接種から４日間経過した日にキュウリ幼苗の葉を目視観察して、病斑面積率から、下記の式によって防除価を算出した。

[0517] 防除価（％）＝

１００－{処理区における病斑面積率／無処理区における病斑面積率}×１００

[0518] 化合物番号ｂ－３、ｂ－５～ｂ－６、ｂ－９～ｂ－１０、ｂ－１３～ｂ－１８、ｂ－２０～ｂ－２３、ｂ－２５、ｂ－２７～ｂ－３１、ｂ－３３～ｂ－３４、ｂ－３６～ｂ－３８、ｂ－４２～ｂ－４６、ｂ－５０、ｂ－５２～

ｂ－５３、ｂ－５５、ｂ－５７～ｂ－５９、ｂ－６４、ｂ－６６～ｂ－６８、ｂ－７４～ｂ－７７、ｂ－７９～ｂ－８１、ｂ－８３、ｂ－８５～ｂ－８６、ｂ－８８、ｂ－９０、ｂ－９２、ｂ－９４、ｂ－９６、ｂ１０１、ｂ－１０３～ｂ－１０４、ｂ－１０６～ｂ－１０９、ｂ－１１１～ｂ－１１４、ｂ－１１７～ｂ－１１８、ｂ－１２１～ｂ－１２２、ｂ－１２４、ｂ－１２６～ｂ－１２７、ｂ－１３０、ｂ－１３８、ｂ－１４５～ｂ－１５４、ｂ－１５８～ｂ－１５９、ｂ－１６３、ｂ－１６８～ｂ－１７１、ｂ－１７６～ｂ－１７８、ｂ－１８２～ｂ－１８４、ｂ－１８６～ｂ－１９２、ｂ－１９６～ｂ－１９７、ｂ－１９９～ｂ－２０２、ｂ－２０４～ｂ－２０９、ｂ－２１１～ｂ－２１４、ｂ－２２０、ｂ－２２３～ｂ－２２４、および、ｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物について濃度１２５質量ｐｐｍでキュウリ灰色かび病の防除試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の防除価を示した。

[0519] 化合物番号ｂ－３、ｂ－５、ｂ－６、ｂ－９、ｂ－１４～ｂ－１７、ｂ－２１～ｂ－２３、ｂ－２５、ｂ－２７～ｂ－３２、ｂ－３４、ｂ－３６、ｂ－３８、ｂ－４２～ｂ－４６、ｂ－５２、ｂ－５３、ｂ－５５、ｂ－６６、ｂ－６７、ｂ－７２、ｂ－７４～ｂ－７７、ｂ－８０、ｂ－８５、ｂ－８６、ｂ－８８、ｂ－９０、ｂ－９２、ｂ－９４、ｂ－１０１、ｂ－１０３～ｂ－１０６、ｂ－１０８～ｂ－１０９、ｂ－１１３、ｂ－１１５～ｂ－１１９、ｂ－１２１、ｂ－１２７、ｂ－１３０、ｂ－１３５、ｂ－１３８、ｂ－１４５、ｂ－１４７～ｂ－１５４、ｂ－１５８～ｂ－１５９、ｂ－１６３、ｂ－１７１、ｂ－１７６～ｂ－１７８、ｂ－１８２～ｂ－１８４、ｂ－１８６～ｂ－１９２、ｂ－１９６～ｂ－１９７、ｂ－１９９～ｂ－２０２、ｂ－２０４、ｂ－２０６～ｂ－２０９、ｂ－２１１～ｂ－２１３、ｂ－２２３、および、ｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物について濃度２５質量ｐｐｍでキュウリ灰色かび病の防除試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の防除価を示した。

[0520] （リンゴ黒星病の防除試験）

前記乳剤（１）に本発明のヒドラジド化合物の濃度が１２５質量ｐｐｍになるように水を加え、溶解させて薬剤液を得た。続いて育苗用ポットで栽培したリンゴ幼苗（品種「王林」、３～４葉期）に、前記薬剤液を散布し、次いで風乾した。その後、これにリンゴ黒星病菌（Venturia inaequalis）の分生胞子を接種した（処理区）。対照として、薬剤液を散布しなかったリンゴ幼苗に同様に接種した（無処理区）。それらを、明暗を１２時間毎に繰り返す２０℃の湿室に静置した。

接種から１２日から１４日間経過した日にリンゴ幼苗の葉を目視観察して、病斑面積率から、前記のキュウリ灰色かび病の防除試験にて防除価の算出に用いた式により、防除価を算出した。

[0521] 化合物番号ｂ－５、ｂ－６、ｂ－９、ｂ－１５～ｂ－１８、ｂ－２０～ｂ－２３、ｂ－２５～ｂ－２６、ｂ－２８～ｂ－３１、ｂ－３３～ｂ－３６、ｂ－３８、ｂ－４２～ｂ－４６、ｂ－５２～ｂ－５３、ｂ－５５、ｂ－５７、ｂ－６５～ｂ－６８、ｂ－７１、ｂ－７４～ｂ－７７、ｂ－７９～ｂ－８１、ｂ－８３、ｂ－８５～ｂ－８６、ｂ－８８、ｂ－９０、ｂ－９２、ｂ－９４、ｂ－９６、ｂ－１００～ｂ－１０４、ｂ－１０６～ｂ－１１４、ｂ－１１７～ｂ－１１８、ｂ－１２１、ｂ－１２３～ｂ－１２４、ｂ－１２７、ｂ－１３８、ｂ－１４４～ｂ－１５４、ｂ－１５８～ｂ－１５９、ｂ－１６３～ｂ－１６５、ｂ－１６８～ｂ－１７４、ｂ－１７６～ｂ－１７８、ｂ－１８０、ｂ－１８２～ｂ－１８４、ｂ－１８６～ｂ－１８７、ｂ－１８９～ｂ－１９２、ｂ－１９６、ｂ－１９９、ｂ－２０１～ｂ－２０２、ｂ－２０４～ｂ－２０６、ｂ－２０８、ｂ－２１２、ｂ－２２０、ｂ－２２３、および、ｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物についてリンゴ黒星病の防除試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の防除価を示した。

[0522] （コムギうどんこ病の防除試験）

前記乳剤（１）に本発明のヒドラジド化合物の濃度が１２５質量ｐｐｍになるように水を加え、溶解させて薬剤液を得た。続いて育苗用ポットで栽培したコムギ幼苗（品種「チホク」、１～２葉期）に、前記薬剤液を散布し、

風乾した。その後、コムギうどんこ病菌（Erysiphe graminis f.sp.tritici）の分生胞子を振りかけて接種した（処理区）。対照として、薬剤液を散布しなかったコムギ幼苗にコムギうどんこ病菌（Erysiphe graminis f.sp.tritici）の分生胞子を振りかけて接種した（無処理区）。それらを２０℃の温室に静置した。接種から６日間経過した日にコムギ幼苗の葉を目視観察して、病斑面積率を求め、先の試験と同様に防除価を算出した。

[0523] 化合物番号ｂ－３、ｂ－５、ｂ－６、ｂ－９、ｂ－１３～ｂ－１８、ｂ－２０～ｂ－２３、ｂ－２５、ｂ－２８～ｂ－３１、ｂ－３３、ｂ－３４、ｂ－３６～ｂ－３８、ｂ－４０、ｂ－４２～ｂ－４６、ｂ－５０～ｂ－５３、ｂ－５５、ｂ－５７、ｂ－５８、ｂ－６０、ｂ－６２、ｂ－６５～ｂ－６９、ｂ－７４～ｂ－７７、ｂ－８０、ｂ－８１、ｂ－８３、ｂ－８５、ｂ－８６、ｂ－８８、ｂ－９０、ｂ－９２～ｂ－９４、ｂ－９６、ｂ－１００～ｂ－１０４、ｂ－１０６～ｂ－１１４、ｂ－１１７、ｂ－１１８、ｂ－１２１、ｂ－１２３～ｂ－１２５、ｂ－１２７、ｂ－１４５～ｂ－１５４、ｂ－１５８、ｂ－１５９、ｂ－１６２、ｂ－１６３、ｂ－１６８～ｂ－１７１、ｂ－１７６～ｂ－１７８、ｂ－１８０、ｂ－１８２～ｂ－１８４、ｂ－１８７～ｂ－１９２、ｂ－１９６、ｂ－１９９～ｂ－２０２、ｂ－２０４～ｂ－２０８、ｂ－２１１～ｂ－２１３、ｂ－２２０、ｂ－２２３、および、ｂ－２２７～ｂ－２３２の化合物についてコムギうどんこ病の防除試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の防除価を示した。

[0524] （コムギ赤さび病の防除試験）

前記乳剤（１）に本発明のヒドラジド化合物の濃度が１２５質量ｐｐｍになるように水を加え、溶解させて薬剤液を得た。続いて育苗用ポットで栽培したコムギ幼苗（品種「農林６１号」、１～２葉期）に前記薬剤液を散布し、風乾した。その後、コムギ赤さび病菌（Puccinia recondita）の夏胞子をふり掛けて接種した（処理区）。対照として、薬剤液を散布しなかったコムギ幼苗にコムギ赤さび病菌（Puccinia recondita）の夏胞子をふり掛けて接種した（無処理区）。それらを２０℃の高湿度の部屋に１日間静置した。そ

の後、２０℃の低湿度の部屋に１２日間静置した。次いで、コムギ幼苗の葉を目視観察して、病斑面積率を求め、先の試験と同様に防除価を算出した。

[0525] 化合物番号ｂ－５１およびｂ－６２の化合物についてコムギ赤さび病の防除試験を行った。いずれの化合物も７５％以上の防除価を示した。

[0526] 本発明のヒドラジド化合物の中から無作為に選択したものが、いずれも上記のような効果を奏することから、本発明のヒドラジド化合物は、例示しきれなかった化合物を含め、殺菌効果を有し、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化合物であることが理解できる。

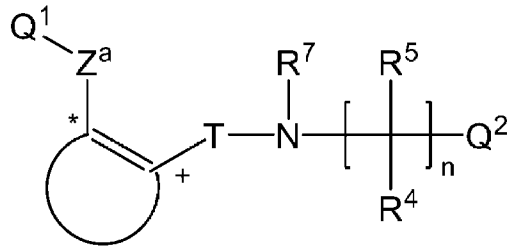
産業上の利用可能性

[0527] 本発明のヒドラジド化合物は、農園芸植物に影響を及ぼす病原菌に対して優れた殺菌活性を有し、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できる。本発明の農園芸用殺菌剤は農園芸植物の病害を効果的に防除することができる。

請求の範囲

[請求項1] 式（Ｚ－Ｉ）で表される化合物またはその塩。

[化1]



（Ｚ－Ｉ）

〔式（Ｚ－Ｉ）中、

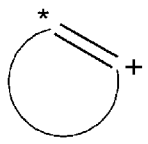
Q^1は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2中の環を形成する炭素原子は、R^7を有する窒素原子とR^7に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[化2]



(Het)

は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

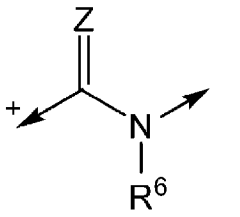
Z^aは、酸素原子、硫黄原子、または式：NR^aで表される基を示

し、

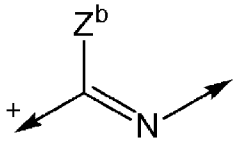
R^aは、水素原子、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基を示し、

Ｔは、部分構造（Ｔ－１）または部分構造（Ｔ－２）を示し、

[化3]



（Ｔ－１）



（Ｔ－２）

部分構造（Ｔ－１）中、Ｚは、酸素原子、硫黄原子、または式：ＮR^bで表される基を示し、＋を付した矢印は部分構造中の＋を付した炭素原子と結合し、他方の矢印はR^7を有する窒素原子と結合し、

R^bは、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、水酸基、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基を示し、

R^6は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基を示し、

部分構造（Ｔ－２）中、Z^bは、Ｃ１～６アルコキシ基、またはＣ１～６アルキルチオ基を示し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若

しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

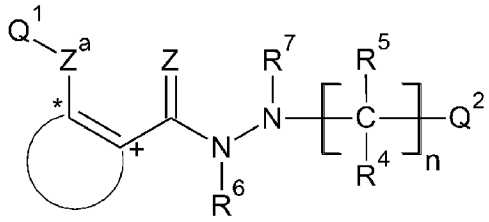
R^7は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、R^c－SO_2－で表される基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはシアノ基を示し、

R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル

オキシ基を示す。〕

[請求項2] 前記式（Ｚ－Ｉ）が式（Ｉ）で表される請求項１に記載の化合物またはその塩。

[化4]



(I)

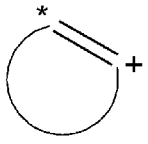
〔式（Ｉ）中、

Q^1、Q^2、Z^a、R^4、R^5、R^7およびｎは、前記式（Ｚ－Ｉ）におけるQ^1、Q^2、Z^a、R^4、R^5、R^7およびｎと同じ意味を示し、

ＺおよびＲ⁶は、前記部分構造（Ｔ－１）におけるＺおよびＲ⁶と同じ意味を示す。〕

[請求項3] 前記部分構造Ｈｅｔ：

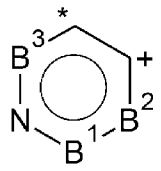
[化5]



(Het)

が、式（ＩＩ）で表される６員ヘテロアリール環である、請求項１に記載の化合物またはその塩。

[化6]



(II)

〔式（ＩＩ）中、

B^1は、窒素原子、または式：ＣＲ¹で表される基を示し、

Ｒ¹は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置

換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、

B^2は、窒素原子、または式：CR^2で表される基を示し、

R^2は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキ

シ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、Ｎ－（Ｃ１～６アルコキシ）イミノ基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、

R^1とR^2は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

B^3は、窒素原子、または式：CR^3で表される基を示し、

R^3は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニルオキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、置換若しくは無置換のフェニルオキシ基、置換もしくは無置換のナフチルオキシ基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリルオキシ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のアミノカルボニル基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応する。〕

［請求項4］ 前記Z^aが、酸素原子であり、

前記Ｚが、酸素原子であり、

前記R^6が、水素原子であり、

前記R^7が、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c

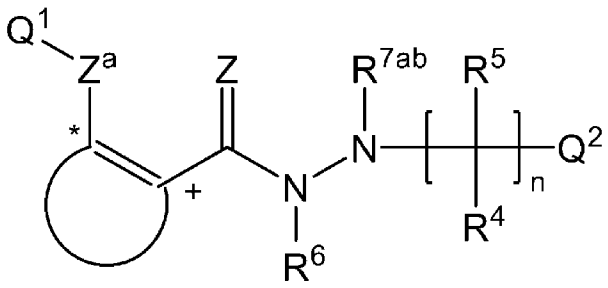
－ＣＳ－で表される基、式：Ｒ^{c}－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはＲ^{c}－ＳＯ$_{2}$－で表される基である、

請求項３に記載の化合物またはその塩。

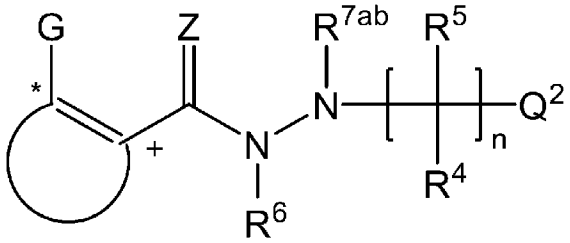
[請求項5] 請求項１～４のいずれかひとつに記載の化合物およびその塩からなる群から選ばれる少なくとも１つを有効成分として含有する、農園芸用殺菌剤。

[請求項6] 式（Ｉ－１）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－１）で表される化合物と、式（ｉｍ－２）で表される化合物とを、酸捕捉剤の存在下、反応させる工程を含む、方法。

[化7]



（Ｉ－１）



（ｉｍ－１）



（ｉｍ－２）

〔上記の各式中、

Ｑ^{1}は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

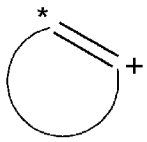
Ｑ^{2}は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、また

は置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Ｑ[2]中の環を形成する炭素原子は、Ｒ[7ab]を有する窒素原子とＲ[7ab]に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[化8]



(IIet)

は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

Ｚ[a]は、酸素原子、硫黄原子、または式：ＮＲ[a]で表される基を示し、

Ｒ[a]は、水素原子、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基を示し、

Ｚは、酸素原子、硫黄原子、または式：ＮＲ[b]で表される基を示し、

Ｒ[b]は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、水酸基、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基を示し、

Ｒ[4]は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

Ｒ[5]は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～

６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^6は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基を示し、

R^{7ab}は、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、R^c－SO_2－で表される基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはシアノ基を示し、

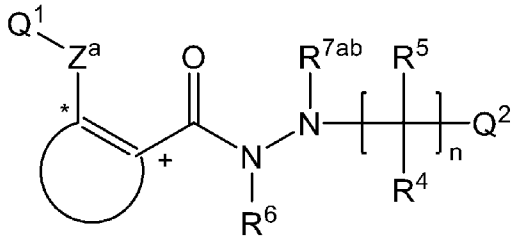
R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置

換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

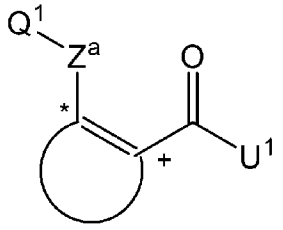
Ｇは、ハロゲノ基を示す。〕

[請求項7] 式（Ｉ－３）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－５）で表される化合物と、式（ｉｍ－６）で表される化合物とを、式（ｉｍ－５）中のU^1が水酸基である場合は縮合試薬の存在下で、U^1がハロゲノ基である場合は酸捕捉剤の存在下で、反応させる工程を含む、方法。

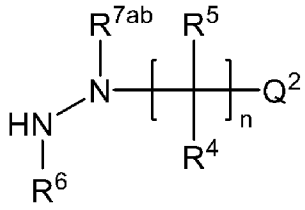
[化9]



（Ｉ－３）



（ｉｍ－５）



（ｉｍ－６）

〔上記の各式中、

Q^1は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

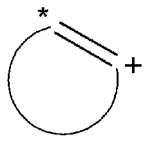
Q^2は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、また

は置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Ｑ^{2}中の環を形成する炭素原子は、Ｒ^{7ab}を有する窒素原子とＲ^{7ab}に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[化10]



(Het)

は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

前記部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

Ｚ^{a}は、酸素原子、硫黄原子、または式：ＮＲ^{a}で表される基を示し、

Ｒ^{a}は、水素原子、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基を示し、

Ｒ^{b}は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、水酸基、または置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基を示し、

Ｒ^{4}は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

Ｒ^{5}は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～

６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^6は、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシカルボニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、または置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基を示し、

R^{7ab}は、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、R^c－SO_2－で表される基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはシアノ基を示し、

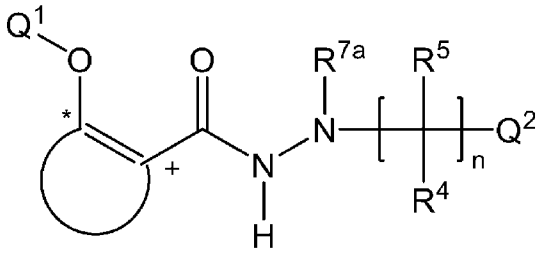
R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル

オキシ基を示す。

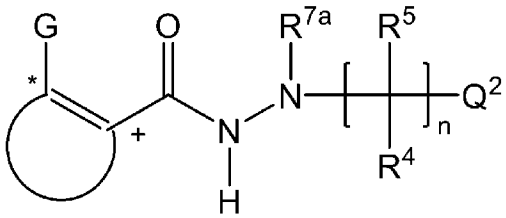
U^1は、水酸基またはハロゲノ基を示す。〕

[請求項8] 式（Ｉ－Ａ１）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－Ａ１）で表される化合物と、式（ｉｍ－Ａ２）で表される化合物とを、酸捕捉剤の存在下、反応させる工程を含む、方法。

[化11]



（Ｉ－Ａ１）



（ｉｍ－Ａ１）



（ｉｍ－Ａ２）

〔上記の各式中、

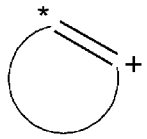
Q^1は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2中の環を形成する炭素原子は、R^{7a}を有する窒素原子とR^{7a}に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[化12]



(Hct)

は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^{7a}は、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはR^c－SO_2－で表される基を示し、

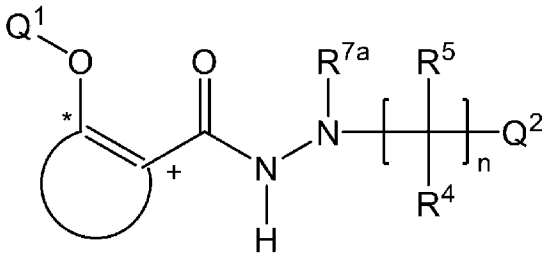
R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル

基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

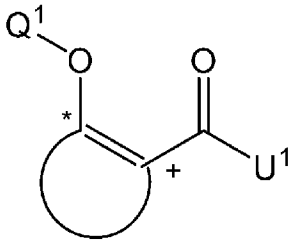
Ｇは、ハロゲノ基を示す。〕

[請求項9] 式（Ｉ－Ａ１）で表される化合物の製法方法であって、前記方法は、式（ｉｍ－Ａ５）で表される化合物と、式（ｉｍ－６ａ）で表される化合物とを、式（ｉｍ－Ａ５）中のＵ[1]が水酸基である場合は縮合試薬の存在下で、Ｕ[1]がハロゲノ基である場合は酸捕捉剤の存在下で、反応させる工程を含む、方法。

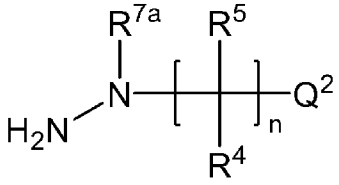
[化13]



（Ｉ－Ａ１）



（ｉｍ－Ａ５）



（ｉｍ－６ａ）

〔上記の各式中、

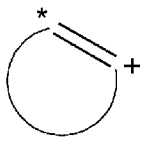
Q^1は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2は、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の９～１０員ヘテロシクリル基を示し、

Q^2中の環を形成する炭素原子は、R^{7a}を有する窒素原子とR^{7a}に代わり結合してもよく、

部分構造Ｈｅｔ：

[化14]



(IIet)

は、置換もしくは無置換の６員ヘテロアリール環、オキソ基を有する置換もしくは無置換の６員含窒素ヘテロ環、または置換もしくは無置換の９～１０員ヘテロアリール環を示し、

部分構造中の＊および＋を付した炭素原子は式（Ｚ－Ｉ）中の＊および＋を付した炭素原子に対応し、

R^4は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

R^5は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルケニル基、置換若しくは無置換のＣ２～６アルキニル基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしく

は無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の５～６員ヘテロシクリル基、またはハロゲノ基を示し、

同一炭素原子上のR^4とR^5は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

ｎは、１～３のいずれかの整数を示し、

R^{7a}は、ホルミル基、式：R^c－ＣＯ－で表される基、式：R^c－ＣＳ－で表される基、式：R^c－ＣＯ－ＣＯ－で表される基、またはR^c－SO_2－で表される基を示し、

R^cは、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキル基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルコキシ基、置換若しくは無置換のＣ１～６アルキルチオ基、置換若しくは無置換のアミノ基、置換若しくは無置換のＣ３～６シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、置換もしくは無置換のナフチル基、置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリル基、または置換若しくは無置換の３～６員ヘテロシクリルオキシ基を示す。

U^1は、水酸基またはハロゲノ基を示す。〕

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2023/046585

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D 213/65(2006.01)i; ***A01N 43/40***(2006.01)i; ***A01N 43/54***(2006.01)i; ***A01N 43/58***(2006.01)i; ***A01N 47/24***(2006.01)i; ***A01P 3/00***(2006.01)i; ***C07D 213/81***(2006.01)i; ***C07D 213/84***(2006.01)i; ***C07D 213/86***(2006.01)i; ***C07D 231/18***(2006.01)i; ***C07D 231/20***(2006.01)i; ***C07D 237/24***(2006.01)i; ***C07D 237/26***(2006.01)i; ***C07D 237/28***(2006.01)i; ***C07D 239/34***(2006.01)i; ***C07D 249/04***(2006.01)i; ***C07D 253/07***(2006.01)i; ***C07D 401/12***(2006.01)i; ***C07D 403/12***(2006.01)i; ***C07D 405/12***(2006.01)i; ***C07D 409/12***(2006.01)i; ***C07D 487/04***(2006.01)i

FI: C07D213/65; A01N43/40 101D; A01N43/54 B; A01N43/58 A; A01N43/58 E; A01N47/24 D; A01P3/00; C07D213/81 CSP; C07D213/84 Z; C07D213/86; C07D231/18; C07D231/20 Z; C07D237/24 CSP; C07D237/26; C07D237/28; C07D239/34; C07D249/04 506; C07D253/07; C07D401/12; C07D403/12; C07D405/12; C07D409/12; C07D487/04 144

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)

C07D213/65; A01N43/40; A01N43/54; A01N43/58; A01N47/24; A01P3/00; C07D213/81; C07D213/84; C07D213/86; C07D231/18; C07D231/20; C07D237/24; C07D237/26; C07D237/28; C07D239/34; C07D249/04; C07D253/07; C07D401/12; C07D403/12; C07D405/12; C07D409/12; C07D487/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Published examined utility model applications of Japan 1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2024
Registered utility model specifications of Japan 1996-2024
Published registered utility model applications of Japan 1994-2024

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 2023/049199 A1 (ZENO MANAGEMENT, INC.) 30 March 2023 (2023-03-30) paragraph [0158], etc.	1-2
P, A		3-9
P, X	CN 116332922 A (WUHAN RENFU INNOVATION DRUG RESEARCH AND DEVELOPMENT CENTER CO., LTD.) 27 June 2023 (2023-06-27) paragraph [0147], etc.	1-2
P, A		3-9

☑ 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
"D" document cited by the applicant in the international application
"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
12 March 2024	**26 March 2024**

Name and mailing address of the ISA/JP	Authorized officer
Japan Patent Office (ISA/JP) **3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915** **Japan**	Telephone No.

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2004/007481 A2 (AMGEN INC.) 22 January 2004 (2004-01-22) pages 353, 357, etc.	1-2
A		3-9
X	WO 2006/058730 A1 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 08 June 2006 (2006-06-08) page 103, etc.	1-2
A		3-9
X	WO 2021/102204 A1 (VIVACE THERAPEUTICS, INC.) 27 May 2021 (2021-05-27) example 8 and later, etc.	1-2
A		3-9
X	WO 2007/081630 A2 (JANSSEN PHARMACEUTICA, N.V.) 19 July 2007 (2007-07-19) page 124, etc.	1-2
A		3-9
X	WO 2009/055299 A1 (JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.) 30 April 2009 (2009-04-30) claim 11, etc.	1-2
A		3-9
X	US 8153791 B2 (XU, Guozhang) 10 April 2012 (2012-04-10) column 154, etc.	1-2
A		3-9
X	WO 2011/107394 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 09 September 2011 (2011-09-09) page 4, etc.	1-2
A		3-9
X	WO 2013/083991 A1 (IMPERIAL INNOVATIONS LIMITED) 13 June 2013 (2013-06-13) page 113 and later, etc.	1-2
A		3-9
X	CN 104193675 A (ZHEJIANG UNIVERSITY OF TECHNOLOGY) 10 December 2014 (2014-12-10) examples, etc.	1-2, 6, 8
A		3-5, 7, 9
X	CN 104744358 A (ZHEJIANG UNIVERSITY OF TECHNOLOGY) 01 July 2015 (2015-07-01) examples, etc.	1-2, 6, 8
A		3-5, 7, 9
X	WO 01/78648 A2 (DONG WHA PHARM. IND. CO., LTD.) 25 October 2001 (2001-10-25) example 22, etc.	1-2, 7
A		3-6, 8-9
X	WO 2004/056823 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 08 July 2004 (2004-07-08) examples, tables, etc.	1-2, 7
A		3-6, 8-9
X	WO 2009/013462 A1 (UCB PHARMA S.A.) 29 January 2009 (2009-01-29) pages 31-32, etc.	1-2, 7
A		3-6, 8-9
X	WO 02/089745 A2 (CYTOVIA, INC.) 14 November 2002 (2002-11-14) examples, etc.	1-2, 7, 9
A		3-6, 8
X	WO 2010/059838 A2 (DECODE GENETICS EHF) 27 May 2010 (2010-05-27) paragraphs [00255], [00263], etc.	1-2, 7, 9
A		3-6, 8

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2006/045514 A1 (APPLIED RESEARCH SYSTEMS ARS HOLDING N.V.) 04 May 2006 (2006-05-04) examples 28, 55, etc.	1-3, 7
A		4-6, 8-9
X	Pharmaceutical Chemistry Journal 2011, vol. 45, pages 153-155 page 153, etc.	1-2
A		3-9
X	Bioorg. Med. Chem. Lett. 2008, vol. 18, pages 4896-4899 scheme 4, etc.	1-2
A		3-9
X	Bioorg. Med. Chem. Lett. 2010, vol. 20, pages 5803-5806 scheme 1, etc.	1-2
A		3-9
X	Org. Proc. Res. Dev. 2010, vol. 14, pages 1153-1161 scheme 4, etc.	1-2
A		3-9
X	J. Med. Chem. 2014, vol. 57, pages 2773-2788 schemes 3-4, etc.	1-2
A		3-9
X	Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal 1998, vol. 32, pages 15-16 page 15, left column, etc.	1-2
A		3-9
X	Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal 1991, vol. 25, pages 20-21 page 20, left column, etc.	1-2
A		3-9
X	Chin. J. Org. Chem. 2016, vol. 36, pages 1051-1059 scheme 1, etc.	1-2, 7, 9
A		3-6, 8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/JP2023/046585

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
WO 2023/049199 A1	30 March 2023	(Family: none)	
CN 116332922 A	27 June 2023	WO 2023/116877 A1	
WO 2004/007481 A2	22 January 2004	JP 2006-502118 A	
		JP 2004-527499 A	
		US 2003/0203922 A1	
		US 2003/0195230 A1	
		US 2006/0194848 A1	
		EP 1562933 A2	
		EP 1467721 A2	
		CN 1538836 A	
		KR 10-2003-0078068 A	
WO 2006/058730 A1	08 June 2006	JP 2008-521856 A	
		US 2007/0265231 A1	
		EP 1819224 A1	
		KR 10-2007-0090898 A	
		CN 101068468 A	
WO 2021/102204 A1	27 May 2021	US 2023/0106583 A1	
		EP 4061364 A4	
		CN 115279368 A	
WO 2007/081630 A2	19 July 2007	US 2007/0270425 A1	
		US 2008/0249304 A1	
		US 2012/0157412 A1	
		WO 2008/073519 A1	
WO 2009/055299 A1	30 April 2009	US 2009/0111810 A1	
US 8153791 B2	10 April 2012	US 2007/0270425 A1	
		US 2008/0249304 A1	
		US 2012/0157412 A1	
		WO 2008/073519 A1	
		WO 2007/081630 A2	
WO 2011/107394 A1	09 September 2011	(Family: none)	
WO 2013/083991 A1	13 June 2013	(Family: none)	
CN 104193675 A	10 December 2014	(Family: none)	
CN 104744358 A	01 July 2015	(Family: none)	
WO 01/78648 A2	25 October 2001	US 2003/0092709 A1	
		KR 10-2001-0096176 A	
WO 2004/056823 A1	08 July 2004	JP 2007-514704 A	
		JP 2006-513258 A	
		JP 2006-503108 A	
		US 2007/0111995 A1	
		US 2008/0132536 A1	
		US 2006/0252790 A1	
		US 2006/0089375 A1	
		US 2008/0175914 A1	
		WO 2005/058892 A1	
		WO 2004/024728 A2	
		EP 1581532 A1	
		EP 1737857 A1	
		EP 1539753 A2	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/JP2023/046585

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
		CN 1751042 A	
		CN 1914205 A	
		KR 10-2005-0088214 A	
		KR 10-2005-0052501 A	
WO 2009/013462 A1	29 January 2009	US 2010/0179124 A1	
		EP 2183253 A1	
WO 02/089745 A2	14 November 2002	US 2003/0013743 A1	
		US 2004/0186078 A1	
		EP 1392219 A4	
WO 2010/059838 A2	27 May 2010	(Family: none)	
WO 2006/045514 A1	04 May 2006	JP 2008-517024 A	
		US 2009/0093462 A1	
		US 2011/0224192 A1	
		US 2012/0295889 A1	
		US 2014/0051686 A1	
		EP 1802579 A1	
		CN 101065358 A	
		KR 10-2007-0067727 A	

国際調査報告

国際出願番号
PCT/JP2023/046585

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

C07D 213/65(2006.01)i; A01N 43/40(2006.01)i; A01N 43/54(2006.01)i; A01N 43/58(2006.01)i; A01N 47/24(2006.01)i; A01P 3/00(2006.01)i; C07D 213/81(2006.01)i; C07D 213/84(2006.01)i; C07D 213/86(2006.01)i; C07D 231/18(2006.01)i; C07D 231/20(2006.01)i; C07D 237/24(2006.01)i; C07D 237/26(2006.01)i; C07D 237/28(2006.01)i; C07D 239/34(2006.01)i; C07D 249/04(2006.01)i; C07D 253/07(2006.01)i; C07D 401/12(2006.01)i; C07D 403/12(2006.01)i; C07D 405/12(2006.01)i; C07D 409/12(2006.01)i; C07D 487/04(2006.01)i

FI: C07D213/65; A01N43/40 101D; A01N43/54 B; A01N43/58 A; A01N43/58 E; A01N47/24 D; A01P3/00; C07D213/81 CSP; C07D213/84 Z; C07D213/86; C07D231/18; C07D231/20 Z; C07D237/24 CSP; C07D237/26; C07D237/28; C07D239/34; C07D249/04 506; C07D253/07; C07D401/12; C07D403/12; C07D405/12; C07D409/12; C07D487/04 144

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））

C07D213/65; A01N43/40; A01N43/54; A01N43/58; A01N47/24; A01P3/00; C07D213/81; C07D213/84; C07D213/86; C07D231/18; C07D231/20; C07D237/24; C07D237/26; C07D237/28; C07D239/34; C07D249/04; C07D253/07; C07D401/12; C07D403/12; C07D405/12; C07D409/12; C07D487/04

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	１９７１－２０２４年
日本国実用新案登録公報	１９９６－２０２４年
日本国登録実用新案公報	１９９４－２０２４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 2023/049199 A1 (ZENO MANAGEMENT, INC.) 30.03.2023 (2023-03-30) 段落［０１５８］など	1-2
P, A		3-9
P, X	CN 116332922 A (WUHAN RENFU INNOVATION DRUG RESEARCH AND DEVELOPMENT CENTER CO., LTD.) 27.06.2023 (2023-06-27) 段落［０１４７］など	1-2
P, A		3-9

☑ 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
“D” 国際出願で出願人が先行技術文献として記載した文献
“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抵触するものではなく、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
12.03.2024	26.03.2024

名称及びあて先
日本国特許庁(ISA/JP)
〒100-8915
日本国
東京都千代田区霞が関三丁目４番３号

権限のある職員（特許庁審査官）
早川　裕之 4P 4500

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

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
X	WO 2004/007481 A2 (AMGEN INC.) 22.01.2004 (2004-01-22) ３５３，３５７頁など	1-2
A		3-9
X	WO 2006/058730 A1 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 08.06.2006 (2006-06-08) １０３頁など	1-2
A		3-9
X	WO 2021/102204 A1 (VIVACE THERAPEUTICS, INC.) 27.05.2021 (2021-05-27) 例８以降など	1-2
A		3-9
X	WO 2007/081630 A2 (JANSSEN PHARMACEUTICA, N.V.) 19.07.2007 (2007-07-19) １２４頁など	1-2
A		3-9
X	WO 2009/055299 A1 (JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.) 30.04.2009 (2009-04-30) 請求項１１など	1-2
A		3-9
X	US 8153791 B2 (XU GUOZHANG) 10.04.2012 (2012-04-10) 第１５４欄など	1-2
A		3-9
X	WO 2011/107394 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 09.09.2011 (2011-09-09) ４頁など	1-2
A		3-9
X	WO 2013/083991 A1 (IMPERIAL INNOVATIONS LIMITED) 13.06.2013 (2013-06-13) １１３頁以降など	1-2
A		3-9
X	CN 104193675 A (ZHEJIANG UNIVERSITY OF TECHNOLOGY) 10.12.2014 (2014-12-10) 実施例など	1-2,6,8
A		3-5,7,9
X	CN 104744358 A (ZHEJIANG UNIVERSITY OF TECHNOLOGY) 01.07.2015 (2015-07-01) 実施例など	1-2,6,8
A		3-5,7,9
X	WO 01/78648 A2 (DONG WHA PHARM. IND. CO., LTD.) 25.10.2001 (2001-10-25) 例２２など	1-2,7
A		3-6,8-9
X	WO 2004/056823 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 08.07.2004 (2004-07-08) 実施例およびテーブルなど	1-2,7
A		3-6,8-9
X	WO 2009/013462 A1 (UCB PHARMA S.A.) 29.01.2009 (2009-01-29) ３１～３２頁など	1-2,7
A		3-6,8-9
X	WO 02/089745 A2 (CYTOVIA, INC.) 14.11.2002 (2002-11-14) 実施例など	1-2,7,9
A		3-6,8
X	WO 2010/059838 A2 (DECODE GENETICS EHF) 27.05.2010 (2010-05-27) 段落［００２５５］，［００２６３］など	1-2,7,9
A		3-6,8

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
X	WO 2006/045514 A1 (APPLIED RESEARCH SYSTEMS ARS HOLDING N.V.) 04.05.2006 (2006-05-04) 例２８，５５など	1-3,7
A		4-6,8-9
X	Pharmaceutical Chemistry Journal 2011, v.45, pp.153-155 １５３頁など	1-2
A		3-9
X	Bioorg. Med. Chem. Lett. 2008, v.18, pp.4896-4899 スキーム４など	1-2
A		3-9
X	Bioorg. Med. Chem. Lett. 2010, v.20, pp.5803-5806 スキーム１など	1-2
A		3-9
X	Org. Proc. Res. Dev. 2010, v.14, pp.1153-1161 スキーム４など	1-2
A		3-9
X	J. Med. Chem. 2014, v.57, pp.2773-2788 スキーム３～４など	1-2
A		3-9
X	Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal 1998, v.32, pp.15-16 １５頁左欄など	1-2
A		3-9
X	Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal 1991, v.25, pp.20-21 ２０頁左欄など	1-2
A		3-9
X	Chin. J. Org. Chem. 2016, v.36, pp.1051-1059 スキーム１など	1-2,7,9
A		3-6,8

国際調査報告
パテントファミリーに関する情報

国際出願番号
PCT/JP2023/046585

引用文献	公表日	パテントファミリー文献	公表日
WO 2023/049199 A1	30.03.2023	（ファミリーなし）	
CN 116332922 A	27.06.2023	WO 2023/116877 A1	
WO 2004/007481 A2	22.01.2004	JP 2006-502118 A	
		JP 2004-527499 A	
		US 2003/0203922 A1	
		US 2003/0195230 A1	
		US 2006/0194848 A1	
		EP 1562933 A2	
		EP 1467721 A2	
		CN 1538836 A	
		KR 10-2003-0078068 A	
WO 2006/058730 A1	08.06.2006	JP 2008-521856 A	
		US 2007/0265231 A1	
		EP 1819224 A1	
		KR 10-2007-0090898 A	
		CN 101068468 A	
WO 2021/102204 A1	27.05.2021	US 2023/0106583 A1	
		EP 4061364 A4	
		CN 115279368 A	
WO 2007/081630 A2	19.07.2007	US 2007/0270425 A1	
		US 2008/0249304 A1	
		US 2012/0157412 A1	
		WO 2008/073519 A1	
WO 2009/055299 A1	30.04.2009	US 2009/0111810 A1	
US 8153791 B2	10.04.2012	US 2007/0270425 A1	
		US 2008/0249304 A1	
		US 2012/0157412 A1	
		WO 2008/073519 A1	
		WO 2007/081630 A2	
WO 2011/107394 A1	09.09.2011	（ファミリーなし）	
WO 2013/083991 A1	13.06.2013	（ファミリーなし）	
CN 104193675 A	10.12.2014	（ファミリーなし）	
CN 104744358 A	01.07.2015	（ファミリーなし）	
WO 01/78648 A2	25.10.2001	US 2003/0092709 A1	
		KR 10-2001-0096176 A	
WO 2004/056823 A1	08.07.2004	JP 2007-514704 A	
		JP 2006-513258 A	
		JP 2006-503108 A	
		US 2007/0111995 A1	
		US 2008/0132536 A1	
		US 2006/0252790 A1	
		US 2006/0089375 A1	
		US 2008/0175914 A1	
		WO 2005/058892 A1	
		WO 2004/024728 A2	
		EP 1581532 A1	
		EP 1737857 A1	
		EP 1539753 A2	

国際調査報告
パテントファミリーに関する情報

国際出願番号
PCT/JP2023/046585

引用文献	公表日	パテントファミリー文献	公表日
		CN 1751042 A	
		CN 1914205 A	
		KR 10-2005-0088214 A	
		KR 10-2005-0052501 A	
WO 2009/013462 A1	29.01.2009	US 2010/0179124 A1	
		EP 2183253 A1	
WO 02/089745 A2	14.11.2002	US 2003/0013743 A1	
		US 2004/0186078 A1	
		EP 1392219 A4	
WO 2010/059838 A2	27.05.2010	（ファミリーなし）	
WO 2006/045514 A1	04.05.2006	JP 2008-517024 A	
		US 2009/0093462 A1	
		US 2011/0224192 A1	
		US 2012/0295889 A1	
		US 2014/0051686 A1	
		EP 1802579 A1	
		CN 101065358 A	
		KR 10-2007-0067727 A	