

(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  
2023年1月5日(05.01.2023)



(10) 国際公開番号

WO 2023/276813 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 237/14 (2006.01) C07D 237/16 (2006.01)  
A01N 43/58 (2006.01) C07D 237/22 (2006.01)  
A01N 47/12 (2006.01) C07D 237/24 (2006.01)  
A01P 3/00 (2006.01) C07D 401/04 (2006.01)  
A01P 5/00 (2006.01) C07D 409/12 (2006.01)  
A61K 31/50 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)  
A61P 31/10 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2022/024872

(22) 国際出願日: 2022年6月22日(22.06.2022)

(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 2021-106256 2021年6月28日(28.06.2021) JP  
特願 2021-164636 2021年10月6日(06.10.2021) JP

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

(72) 発明者: 岸本 真実 (KISHIMOTO, Mami); 〒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). ▲ 桑 ▼ 原 頼人 (KUWAHARA, Raito); 〒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). 川 ▲ 崎 ▼ 達弘 (KAWASAKI, Tatsuhiro); 〒2500280

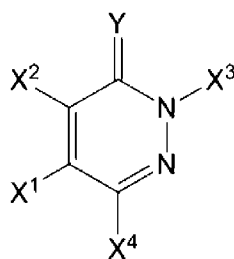
神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 幸堀 伸哉 (KOUBORI, Shinya); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 寺西 貴昭 (TERANISHI, Takaaki); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 石原 拓真 (ISHIHARA, Takuma); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 斎賀 睦幸 (SAIGA, 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).

(74) 代理人: 廣田 雅紀 (HIROTA, Masanori); 〒1070052 東京都港区赤坂二丁目2番19号 アドレスビル6階 Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, 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, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD,

(54) Title: PYRIDAZINONE COMPOUND, AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL GERMICIDE, NEMATOCIDE, AND MEDICAL AND ANIMAL ANTIFUNGAL AGENT

(54) 発明の名称: ピリダジノン化合物並びに農園芸用殺菌剤、殺線虫剤、および医療用・動物用抗真菌剤



(57) Abstract: The present invention addresses the problem of providing a pyridazinone compound which has excellent bactericidal/antibacterial activity and excellent safety, while being industrially beneficially synthesized; and an agricultural/horticultural germicide containing the pyridazinone compound as an active ingredient. The pyridazinone compound is a compound represented by formula (I) or a salt thereof. In formula (I), Y represents an oxygen atom or a sulfur atom; X<sup>1</sup> and X<sup>2</sup> each independently represent a hydrogen atom, a halogen group, a substituted or unsubstituted C1-6 alkyl group, or the like; X<sup>3</sup> represents a hydrogen atom, a substituted (I) or unsubstituted linear C1-C6 alkyl group, a substituted or unsubstituted linear C2-C6 alkenyl group, or the like; X<sup>4</sup> represents a group represented by Q-A-, a group represented by Q-A-B-, or the like; A represents a substituted or unsubstituted C1-C6 alkylene group, a substituted or unsubstituted C2-C6 alkenylene group, or the like; B represents an oxygen atom, a sulfur atom or the like; and Q represents a substituted or unsubstituted C6-10 aryl group or a substituted or unsubstituted heterocyclyl group having a 5-membered to 10-membered ring.

WO 2023/276813 A1

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, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告 (条約第21条(3))

(57) 要約: 本発明の課題は、殺菌・抗菌活性に優れ、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるピリダジノン化合物、およびこれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤などを提供することである。ピリダジノン化合物は、式(1)で表される化合物またはその塩である。式(1)中、Yは、酸素原子または硫黄原子を示し;  $X^1$ および $X^2$ は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC1~6アルキル基などを表し、 $X^3$ は、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C1~6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C2~6アルケニル基などを示し、 $X^4$ は、Q-A-で表される基、Q-A-B-で表される基などを示し、Aは、置換若しくは無置換のC1~6アルキレン基、置換若しくは無置換のC2~6アルケニレン基などを示し、Bは、酸素原子、硫黄原子などを示し、Qは、置換若しくは無置換のC6~10アリール基、または置換若しくは無置換の5~10員環のヘテロシクリル基を示す。

## 明 細 書

発明の名称：

ピリダジノン化合物並びに農園芸用殺菌剤、殺線虫剤、および医療用・動物用抗真菌剤

## 技術分野

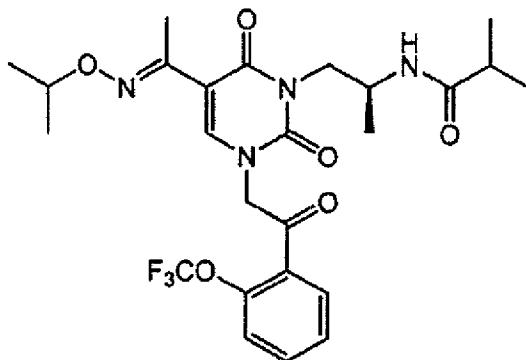
[0001] 本発明は、ピリダジノン化合物および農園芸用殺菌剤に関する。より詳細に、本発明は、殺菌・抗菌活性に優れ、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるピリダジノン化合物、並びにこれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。さらに、前記の化合物を有効成分として含有する殺線虫剤に関する。さらに、前記の化合物を有効成分として含有する医療用・動物用抗真菌剤に関する。

## 背景技術

[0002] 農園芸作物の栽培に当り作物の病害に対して防除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)で表される化合物などが開示されている。この化合物が殺菌活性、抗真菌活性などを有することが、開示されている。

[化1]



(A)

## 先行技術文献

### 特許文献

[0004] 特許文献1：WO2021/085389A

### 発明の概要

#### 発明が解決しようとする課題

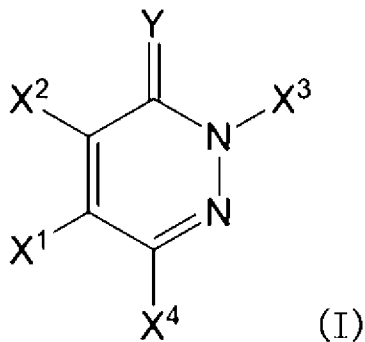
[0005] 本発明の課題は、殺菌・抗菌活性に優れ、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるピリダジノン化合物、およびこれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤を提供することである。さらには、前記の化合物を有効成分として含有する殺線虫剤を提供することにある。さらには、前記の化合物を有効成分として含有する医療用・動物用抗真菌剤を提供することにある。

#### 課題を解決するための手段

[0006] 本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意検討した結果、以下の態様を包含する本発明を完成するに至った。

[0007] 〔1〕式（1）で表される化合物またはその塩。

[化2]



[0008] 式（1）中、

Yは、酸素原子または硫黄原子を示し；

X<sup>1</sup>、およびX<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルキル基、置換若しくは無置換のC<sub>2</sub>～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC<sub>2</sub>～6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC<sub>2</sub>～6アルケニルオ

キシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルスルホニル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、 $R^1-CO-$ で表される基、カルボキシ基、 $R^2-O-CO-$ で表される基、 $R^3R^4N-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-$ で表される基、 $R^1-CO-O-$ で表される基、 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2-O-CO-O-$ で表される基、 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基、 $R^1O-N=CR^6-$ で表される基、 $R^3R^4N-N=CR^6-$ で表される基、または $R^1-N=CR^6-$ で表される基を示し、

$R^1$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^2$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

R<sup>3</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6 アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6 アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6 シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

R<sup>4</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基を示し、

ここで、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

R<sup>5</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基を示し、

R<sup>6</sup>は、ハロゲノ基、アミノ基、置換若しくは無置換のモノC 1～6 アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のジC 1～6 アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキルチオ基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し；

X<sup>3</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6 アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6 アルキニル基、R<sup>1</sup>-CO-で表される基、置換若しくは無置換のC 3～6 シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基、置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基、R<sup>N1</sup>O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>N-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>N2</sup>-で表される基、またはR<sup>N1</sup>-C(=NR<sup>N1</sup>)-NR<sup>N2</sup>-で表される基

を示し、

$R^{N1}$ 、および  $R^{N2}$  は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖 C 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖 C 2～6 アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖 C 2～6 アルキニル基、置換若しくは無置換の C 3～6 シクロアルキル基、置換若しくは無置換の C 6～10 アリール基、または置換若しくは無置換の 4～6 員環のヘテロシクリル基を示し、ここで、 $R^{N1}$  と  $R^{N1}$ 、または  $R^{N1}$  と  $R^{N2}$  は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく；

$X^4$  は、 $Q-A-$  で表される基、 $Q-A-B-$  で表される基、 $Q-B-A-$  で表される基、 $Q-SO_2-NR^{N3}$  で表される基、 $Q-C(R^7)=N-$  で表される基、 $Q-NR^{N3}-SO_2-$  で表される基、 $Q-N=C(R^7)-$  で表される基、または  $Q-B-$  で表される基を示し、

A は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換の C 1～6 アルキレン基、置換若しくは無置換の C 2～6 アルケニレン基、置換若しくは無置換の C 2～6 アルキニレン基、置換若しくは無置換の C 3～6 シクロアルキレン基、またはカルボニル基を示し；

B は、それぞれ独立に、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、または  $-NR^{N3}-$  で表される基を示し、 $R^{N3}$  は、水素原子、置換若しくは無置換の C 1～6 アルキル基、ホルミル基、または置換若しくは無置換の C 1～6 アルキルカルボニル基を示し、

$R^7$  は、水素原子、または置換若しくは無置換の C 1～6 アルキル基を示し、

Q は、置換若しくは無置換の C 6～10 アリール基、または置換若しくは無置換の 5～10 員環のヘテロシクリル基を示す。

[0009] [2]  $X^2$  が、 $R^1O-N=C R^6-$  で表される基である、[1] に記載の化合物またはそれらの塩。

[3] [1] または [2] に記載の化合物、およびそれら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。

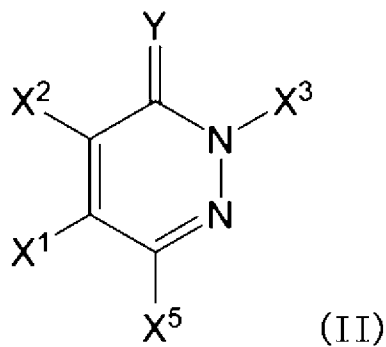
〔４〕種子処理用である、〔３〕に記載の農園芸用殺菌剤。

〔５〕〔１〕または〔２〕に記載の化合物、およびそれら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殺線虫剤。

〔６〕〔１〕または〔２〕に記載の化合物、およびそれら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医療用・動物用抗真菌剤。

[0010] 〔７〕式（II）で表される化合物またはその塩。

[化3]



[0011] 式（II）中、

Yは、酸素原子または硫黄原子を示し；

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルスルホニル基、置換



若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、 $R^1-CO-$ で表される基、カルボキシ基、 $R^2-O-CO-$ で表される基、 $R^3R^4N-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-$ で表される基、 $R^1-CO-O-$ で表される基、 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2-O-CO-O-$ で表される基、 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基、 $R^1O-N=CR^6-$ で表される基、 $R^3R^4N-N=CR^6-$ で表される基、または $R^1-N=CR^6-$ で表される基を示し；

$R^1$ 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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^2$ 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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^3$ 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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^4$ 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、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示し、

ここで、 $R^3$ と $R^4$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

$R^5$ 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、または置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基を示し、

R<sup>6</sup>は、ハロゲン基、アミノ基、置換若しくは無置換のモノC 1～6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のジC 1～6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換もしくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し；

X<sup>3</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C 1～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルキニル基、R<sup>1</sup>-CO-で表される基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基、R<sup>N1</sup>O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>N-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>N2</sup>-で表される基、またはR<sup>N1</sup>-C(=NR<sup>N1</sup>)-NR<sup>N2</sup>-で表される基を示し、

R<sup>N1</sup>、およびR<sup>N2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C 1～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基を示し、ここで、R<sup>N1</sup>とR<sup>N1</sup>、またはR<sup>N1</sup>とR<sup>N2</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく；

X<sup>5</sup>は、HO-A-で表される基、C 1～6アルコキシカルボニル基、また

はハロゲン基を示し、

Aは、置換若しくは無置換のC 1～6アルキレン基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニレン基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニレン基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキレン基、またはカルボニル基を示す。

〔8〕 X<sup>2</sup>が、R<sup>1</sup>O-N=C R<sup>6</sup>-で表される基である、〔7〕に記載の化合物またはそれらの塩。

### 発明の効果

[0012] 本発明のピリダジノン化合物は、殺菌・抗菌活性に優れ、効果が確実で、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及び殺線虫剤は、優れた防除効果を有し、植物体に薬害を生じることがなく、人畜魚類に対する毒性や環境への影響が少ない。

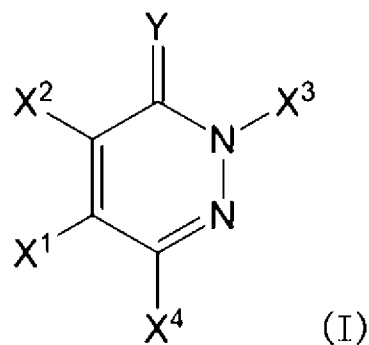
本発明の医療用・動物用抗真菌剤は、優れた抗菌効果を有し、人畜魚類に対する毒性が少ない。

### 発明を実施するための形態

[0013] 〔ピリダジノン化合物〕

本発明のピリダジノン化合物は、式（1）で表される化合物（以下、化合物（1）と表記することがある。）または化合物（1）の塩である。

[化4]



[0014] 本発明において、用語「無置換 (unsubstituted)」は、母核となる基のみであることを意味する。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、用語「置換(substituted)」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個であってもよいし、2個以上であってもよい。2個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。

[0015] 「置換基」は化学的に許容され、本発明の効果を有する限りにおいて特に制限されない。

「置換基」となり得る基の具体例としては、以下の基を挙げることができる。

フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などのハロゲノ基；

メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*s*-ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基などのC 1~6アルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などのC 2~6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、2-メチル-3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などのC 2~6アルキニル基；

[0016] 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C 3~6シクロアルキル基；

2-シクロプロペニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロヘキセニル基などのC3~6シクロアルケニル基；

フェニル基、ナフチル基などのC6~10アリール基；

ベンジル基、フェネチル基などのC6~10アリールC1~6アルキル基；

3~6員環のヘテロシクリル基；

3~6員環のヘテロシクリルC1~6アルキル基；

[0017] 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、ナフトキシ基などのC6~10アリールオキシ基；

ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC6~10アリールC1~6アルコキシ基；

[0018] カルボキシ基；

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；

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；

[0019] 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；

3, 3-ジフルオロシクロブチル基などのC3~6ハロシクロアルキル基；

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、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基などの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；

[0020] 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、ナフチルアミノ基などのC6~10アリールアミノ基；

ベンジルアミノ基、フェネチルアミノ基などのC6~10アリールC1~6アルキルアミノ基；

[0021] ホルミルアミノ基；

アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、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；

カルバモイル基、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；

[0022] 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；

ビニルチオ基、アリルチオ基などのC2~6アルケニルチオ基；

エチニルチオ基、プロパルギルチオ基などのC2~6アルキニルチオ基；

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；

アリルスルフィニル基などのC2~6アルケニルスルフィニル基；

プロパルギルスルフィニル基などのC2~6アルキニルスルフィニル基；

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C 1～6 ハロアルキルスルホニル基；

アリルスルホニル基などのC 2～6 アルケニルスルホニル基；

プロパルギルスルホニル基などのC 2～6 アルキニルスルホニル基；

アミノチオカルボニル基；

S, S-ジメチルスルホキシイミノ基などのC 1～6 アルキルスルホキシイミノ基；

[0023] 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C 1～6 アルキル置換シリル基；

トリフェニルシリル基などのトリC 6～10 アリール置換シリル基；

シアノ基；

ニトロ基；

[0024] 「C 1～6」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、エトキシブチル基は、母核となる基がブチル基であり、置換基がエトキシ基であるので、C 2アルコキシC 4アルキル基に分類する。

[0025] また、上記の「3～6員環のヘテロシクリル基」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。「3～6員環のヘテロシクリル基」としては、3～6員環の飽和ヘテロシクリル基、5～6員環のヘテロアリール基、5～6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げるができる。

[0026] 3～6員環の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、テトラヒドロフランニル基、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、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げるができる。

[0027] 5員環の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員環のヘテロアリアル基としては、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員環の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、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などを挙げることができる。

6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基としては、ジヒドロピラニル基などを挙げることができる。

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。

[0028] [Y]

Yは、酸素原子または硫黄原子を示す。

本発明においては、好ましいYは酸素原子である。

[0029] [X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>]

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアルスルホニル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の5

～6員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、 $R^1-CO-$ で表される基、カルボキシ基、 $R^2-O-CO-$ で表される基、 $R^3R^4N-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-$ で表される基、 $R^1-CO-O-$ で表される基、 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2-O-CO-O-$ で表される基、 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基、 $R^1O-N=CR^6-$ で表される基、 $R^3R^4N-N=CR^6-$ で表される基、または $R^1-N=CR^6-$ で表される基を示す。

[0030]  $R^1$ 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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

$R^2$ 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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

$R^3$ 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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

$R^4$ 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、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示す。

ここで、 $R^3$ と $R^4$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

$R^5$ 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、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示す。

R<sup>6</sup>は、ハロゲノ基、アミノ基、置換若しくは無置換のモノC 1～6 アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のジC 1～6 アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、置換もしくは無置換のC 1～6 アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキルチオ基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

[0031] X<sup>1</sup>、およびX<sup>2</sup>における「ハロゲノ基」としては、フルオロ基、クロロ基、ブromo基、イオド基などを挙げることができる。

[0032] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 1～6 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。X<sup>1</sup>における「C 1～6 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。

[0033] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 2～6 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。

[0034] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 2～6 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。

[0035] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 1～6 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、*n*-ブトキシ基、*n*-ペンチルオキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、*i*-プロポキシ基、*i*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、*i*-ヘキシルオキシ基などを挙げることができる。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 2～6 アルケニルオキシ基」としては、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を挙げることができる。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 2～6 アルキニルオキシ基」としては、エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などを挙げることができる。

[0036] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 1～6 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*-プロピルチオ基などを挙げることができる。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 1～6 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。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 1～6 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。

[0037] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 1～6 アルキル基」、「C 2～6 アルケニル基」、「C 2～6 アルキニル基」、「C 1～6 アルコキシ基」、「C 2～6 アルケニルオキシ基」、「C 2～6 アルキニルオキシ基」、「C 1～6 アルキルチオ基」、「C 1～6 アルキルスルフィニル基」、または「C 1～6 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C 1～6 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C 1～6 ハロアルコキシ基；(エチリデンアミノ)オキシ基、プロパン-2

ーイリデンアミノ) オキシ基などの (C 1~6 アルキリデンアミノ) オキシ基 ; シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などの C 3~6 シクロアルキル基 ; フェニル基、ナフチル基などの C 6~10 アリール基 ; 4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1~6 アルキル基、C 1~6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1~6 ハロアルキル基、または C 1~6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された C 6~10 アリール基 ; 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 5 員環のヘテロアリール基 ; C 1~6 アルキル基、C 1~6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1~6 ハロアルキル基、または C 1~6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 5 員環のヘテロアリール基 ; ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの 6 員環のヘテロアリール基 ; C 1~6 アルキル基、C 1~6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1~6 ハロアルキル基、または C 1~6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 6 員環のヘテロアリール基 ; またはシアノ基が好ましい。

[0038] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 3~6 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。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 3~6 シクロアルキルオキシ基」としては、シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基などを挙げることができる。

[0039] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 6~10 アリール基」としては、フェニル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、テトラリニル基、などを挙げることができる。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 6～10アリアルオキシ基」としては、フェノキシ基、ナフトキシ基などを挙げるができる。

[0040] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 6～10アリアルチオ基」としては、フェニルチオ基、ナフチルチオ基などを挙げるができる。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 6～10アリアルスルフィニル基」としては、フェニルスルフィニル基、ナフチルスルフィニル基などを挙げるができる。

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C 6～10アリアルスルホニル基」としては、フェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基などを挙げるができる。

[0041] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「5～6員環のヘテロシクリル基」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員環のヘテロシクリル基」としては、5～6員環の飽和ヘテロシクリル基、5～6員環のヘテロアリアル基、5～6員環の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。

[0042] 5～6員環の飽和ヘテロシクリル基としては、ピロリジニル基、テトラヒドロフランニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロ-2H-ピラニル基、ペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキサラニル基、ジオキサニル基などを挙げることができる。

5～6員環のヘテロアリアル基としては、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の5員環のヘテロアリアル基；ピリジニル基、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の6員環のヘテロアリアル基を挙げるができる。

5～6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基としては、ピロリニル基、ジヒドロフランニル基、イミダゾリニル基、ピラゾリニル基、オキサゾリニル基、

イソキサゾリニル基などの5員環の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員環の部分不飽和ヘテロシクリル基を挙げることができる。

[0043] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「5～6員環のヘテロシクリルオキシ基」は、5～6員環のヘテロシクリル基とオキシ基が結合した構造を有する。具体例としては、チアゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基などを挙げることができる。

[0044] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「C3～6シクロアルキル基」、「C3～6シクロアルキルオキシ基」、「C6～10アリール基」、「C6～10アリールオキシ基」、「C6～10アリールチオ基」、「C6～10アリールスルフィニル基」、「C6～10アリールスルホニル基」、「5～6員環のヘテロシクリル基」、または「5～6員環のヘテロシクリルオキシ基」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；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；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-ブチル基などのC1～6ハロアルキル基；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；フェニル基、ナフチル基などのC6～10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC6～10アリール基；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5員環のヘテロアリアル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリアル基；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の6員環のヘテロアリアル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリアル基；またはシアノ基が好ましい。

さらに、「C 3～6シクロアルキル基」、「C 3～6シクロアルキルオキシ基」、「5～6員環のヘテロシクリル基」、または「5～6員環のヘテロシクリルオキシ基」上の置換基としては、オキソ基も好ましい。

[0045] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>1</sup>-CO-で表される基」中、R<sup>1</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

[0046] R<sup>1</sup>における「C 1～6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ができる。

R<sup>1</sup>における「C 2～6アルケニル基」としては、ビニル基、1-プロペニル基などを挙げるができる。

R<sup>1</sup>における「C 2～6アルキニル基」としては、エチニル基、1-プロピニル基などを挙げるができる。

R<sup>1</sup>における「C 1～6アルキル基」、「C 2～6アルケニル基」、または



「C 2～6 アルキニル基」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C 1～6 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C 1～6 ハロアルコキシ基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3～6 シクロアルキル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10 アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、またはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10 アリール基；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5員環のヘテロアリール基；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、またはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、またはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール基；またはシアノ基が好ましい。

[0047] R<sup>1</sup>における「C 3～6 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ができる。

R<sup>1</sup>における「C 6～10 アリール基」としては、フェニル基、ナフチル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げるができる

。

[0048] R<sup>1</sup>における「5～6員環のヘテロシクリル基」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員環のヘテロシクリル基」としては、5～6員環の飽和ヘテロシクリル基、5～6員環のヘテロアリール基、5～6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げるができる。

5～6員環の飽和ヘテロシクリル基としては、ピロリジニル基、テトラヒドロフランニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロ-2H-ピラニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げるができる。

5～6員環の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の5員環のヘテロアリール基；ピリジニル基、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の6員環のヘテロアリール基を挙げるができる。

5～6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基としては、ピロリニル基、ジヒドロフランニル基、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などの5員環の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員環の部分不飽和ヘテロシクリル基が挙げられる。

[0049] R<sup>1</sup>における「C<sub>3</sub>～6シクロアルキル基」、「C<sub>6</sub>～10アリール基」、または「5～6員環のヘテロシクリル基」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；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C<sub>1</sub>～6アルキル基；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

ージクロロ-*n*-プロピル基、1-フルオロ-*n*-ブチル基などのC 1~6ハロアルキル基；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C 1~6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C 1~6ハロアルコキシ基；フェニル基、ナフチル基などのC 6~10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1~6アルキル基、C 1~6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1~6ハロアルキル基、またはC 1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6~10アリール基；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5員環のヘテロアリール基；C 1~6アルキル基、C 1~6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1~6ハロアルキル基、またはC 1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；C 1~6アルキル基、C 1~6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1~6ハロアルキル基、またはC 1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール基；またはシアノ基が好ましい。

さらに、「C 3~6シクロアルキル基」、または「5~6員環のヘテロシクリル基」上の置換基としては、オキソ基も好ましい。

[0050] 「R<sup>1</sup>-CO-で表される基」の具体例としては、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、*i*-プロピルカルボニル基などを挙げるることができる。

[0051] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>2</sup>-O-CO-で表される基」中、R<sup>2</sup>は、置換若しくは無置換のC 1~6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2~6アル

ケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

R<sup>2</sup>における置換基の具体例は、R<sup>1</sup>において例示したものと同一ものを挙げるができる。

[0052] 「R<sup>2</sup>-O-CO-で表される基」の具体例としては、メトキシカルボニル基、エ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ができる。

[0053] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-で表される基」中、R<sup>3</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、R<sup>4</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基を示す。

R<sup>3</sup>またはR<sup>4</sup>における置換基の具体例は、R<sup>1</sup>において例示したものと同一ものを挙げるができる。

[0054] ここで、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

形成できる二価の有機基としては、置換若しくは無置換のC 2～5アルキレン基または置換若しくは無置換のC 1～3アルキレンオキシC 1～3アルキレン基を挙げるができる。

「C 2～5アルキレン基」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を挙げるができる。

「C 1～3アルキレンオキシC 1～3アルキレン基」としては、ジメチレンオキシジメチレン基などを挙げるができる。

「C 2～5アルキレン基」または「C 1～3アルキレンオキシC 1～3アルキレン基」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；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*-ブチル基などのC 1~6アルキル基；またはクロロメチル基、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*-ブチル基などのC 1~6ハロアルキル基が好ましい。

[0055] 「R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-で表される基」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、*i*-プロピルアミノ基などを挙げることができる。

[0056] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-CO-で表される基」中、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は上記の「R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-CO-で表される基」の具体例としては、カルバモイル基、N, N-ジメチルアミノカルボニル基、N-(*i*-プロピル)アミノカルボニル基、N-(*i*-プロピル)-N-メチルアミノカルボニル基などを挙げることができる。

[0057] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>1</sup>-CO-O-で表される基」中、R<sup>1</sup>は上記の「R<sup>1</sup>-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>1</sup>-CO-O-で表される基」の具体例としては、アセチルオキシ基、*i*-プロピルカルボニルオキシ基などを挙げることができる。

[0058] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>1</sup>-CO-NR<sup>5</sup>-で表される基」中、R<sup>1</sup>は上記の「R<sup>1</sup>-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

R<sup>5</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1~6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6~10アリール基を示す。

R<sup>5</sup>における置換基の具体例は、R<sup>1</sup>において例示したものと同一ものを挙げることができる。

「R<sup>1</sup>-CO-NR<sup>5</sup>-で表される基」の具体例としては、アセチルアミノ基、*i*-プロピルカルボニルアミノ基などを挙げることができる。

[0059] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>2</sup>-O-CO-O-で表される基」中、R<sup>2</sup>は上記の「R<sup>2</sup>-O-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>2</sup>-O-CO-O-で表される基」の具体例としては、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などを挙げることができる。

[0060]  $X^1$ および $X^2$ における「 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基」中、 $R^2$ は上記の「 $R^2-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^5$ は上記の「 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基」の具体例としては、メトキシカルボニルアミノ基などを挙げるができる。

[0061]  $X^1$ および $X^2$ における「 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基」中、 $R^3$ および $R^4$ は上記の「 $R^3R^4N-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基」の具体例としては、カルバモイルオキシ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノカルボニルオキシ基などを挙げるができる。

[0062]  $X^1$ および $X^2$ における「 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基」中、 $R^3$ および $R^4$ は上記の「 $R^3R^4N-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。 $R^5$ は上記の「 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基」の具体例としては、カルバモイルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノカルボニルアミノ基などを挙げるができる。

[0063]  $X^1$ および $X^2$ における「 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基」中、 $R^2$ は上記の「 $R^2-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^5$ は上記の「 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基」の具体例としては、メタンスルホニルアミノ基などを挙げるができる。

[0064]  $X^1$ および $X^2$ における「 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基」中、 $R^3$ および $R^4$ は上記の「 $R^3R^4N-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基」の具体例としては、N, N-ジメチルアミノスルホニル基などを挙げるができる。

[0065]  $X^1$ および $X^2$ における「 $R^1O-N=CR^6-$ で表される基」中、 $R^1$ は上記の「 $R^1-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

$R^6$ は、ハロゲノ基、アミノ基、置換若しくは無置換のモノC1~6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のジC1~6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のC1~6アルキル基、置換もしくは無置換の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、または置換若しくは無置換の5~6員環のヘテロシクリル基を示す。

$R^6$ における「置換若しくは無置換のC1~6アルキル基」または「置換若しくは無置換の5~6員環のヘテロシクリル基」の具体例は、 $R^1$ において例示したものと同一ものを挙げるができる。

$R^6$ 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ができる。

$R^6$ における「置換若しくは無置換のモノC1~6アルキルアミノ基」の「モノC1~6アルキルアミノ基」としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基、i-プロピルアミノ基などを挙げるができる。

$R^6$ における「置換若しくは無置換のジC1~6アルキルアミノ基」の「ジC1~6アルキルアミノ基」としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、N-メチル-N-i-プロピルアミノ基などを挙げるができる。

$R^6$ における「置換もしくは無置換のC1~6アルコキシ基」の「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、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、i-プロポキシ基、i-ブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、i-ヘキシルオキシ基などを挙げるができる。

$R^6$ における「置換若しくは無置換のC1~6アルキルチオ基」の「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-

ープロピルチオ基などを挙げるができる。

R<sup>6</sup>における「C<sub>1</sub>～6アルコキシ基」、「モノC<sub>1</sub>～6アルキルアミノ基」、「ジC<sub>1</sub>～6アルキルアミノ基」、または「C<sub>1</sub>～6アルキルチオ基」上の置換基としては、R<sup>1</sup>において「C<sub>1</sub>～6アルキル基」上の置換基として例示した置換基と同じものを挙げるができる。

「R<sup>1</sup>O-N=C R<sup>6</sup>-で表される基」の具体例としては、1-（i-プロポキシイミノ）エチル基などを挙げるができる。

[0066] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-N=C R<sup>6</sup>-で表される基」中、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は上記の「R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。R<sup>6</sup>は上記の「R<sup>1</sup>O-N=C R<sup>6</sup>-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

[0067] X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>における「R<sup>1</sup>-N=C R<sup>6</sup>-で表される基」中、R<sup>1</sup>およびR<sup>6</sup>は上記の「R<sup>1</sup>O-N=C R<sup>6</sup>-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

[0068] 本発明においては、好ましいX<sup>1</sup>としては、水素原子または置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルキル基を挙げるができる。

好ましいX<sup>2</sup>としては、「R<sup>1</sup>O-N=C R<sup>6</sup>-で表される基」を挙げることができる。

[0069] [X<sup>3</sup>]

X<sup>3</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C<sub>1</sub>～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C<sub>2</sub>～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C<sub>2</sub>～6アルキニル基、R<sup>1</sup>-CO-で表される基、置換若しくは無置換のC<sub>3</sub>～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC<sub>6</sub>～10アリール基、または置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基を示す。

[0070] X<sup>3</sup>における「直鎖C<sub>1</sub>～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-ヘキシル基を挙げることができる。

X<sup>3</sup>における「直鎖C<sub>2</sub>～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-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-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-ヘキセニル基を挙げることができる。

X<sup>3</sup>における「直鎖C 2~6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-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-ヘキシニル基などを挙げることができる。

X<sup>3</sup>における「4員環のヘテロシクリル基」としては、アゼチジニル基、オキセタニル基を挙げることができる。

X<sup>3</sup>におけるその他の置換基の具体例は、X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>において例示したものと同一ものを挙げることができる。

[0071] 本発明において、好ましいX<sup>3</sup>としては、置換若しくは無置換の直鎖C 1~6アルキル基、置換若しくは無置換のC 3~6シクロアルキル基、または置換若しくは無置換のC 6~10アリール基を挙げることができる。

本発明において、さらに好ましいX<sup>3</sup>としては、置換の直鎖C 1~6アルキル基である。

[0072] 直鎖C 1~6アルキル基上の置換基、直鎖C 2~6アルケニル基上の置換基、直鎖C 2~6アルキニル基上の置換基、C 3~6シクロアルキル基上の置換基、C 6~10アリール基上の置換基、または4~6員環のヘテロシクリル基上の置換基としては、以下の置換基群より選択される1または2以上の置換基を挙げることができる（以下、この置換基を記号「G」で表すことがある。）。

また、置換基（G）は2以上ある場合、そのうちの2つが一緒になって二価の有機基を形成してもよい。以下に置換基群を示す。

ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1~6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2~6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2~6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のC 1~6アルコキシ基、置換若しくは無置

換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルホニル基、置換若しくは無置換の3～10員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の3～10員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、 $R^a-CO-$ で表される基、カルボキシ基、 $R^b-O-CO-$ で表される基、 $R^cR^dN-$ で表される基、 $R^cR^dN-CO-$ で表される基、 $R^cR^dN-NR^d-CO-$ で表される基、 $R^bSO_2-NR^d-CO-$ で表される基、 $R^a-CO-O-$ で表される基、 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基、 $R^a-CO-CO-NR^e-$ で表される基、 $R^a-CO-NR^e-NR^e-$ で表される基、 $R^a-CO-NR^e-NR^e-CO-$ で表される基、 $R^b-O-CO-O-$ で表される基、 $R^b-O-CO-NR^e-$ で表される基、 $R^cR^dN-CO-O-$ で表される基、 $R^cR^dN-CO-NR^e-$ で表される基、 $R^cR^dN-CO-CO-NR^e-$ で表される基、 $R^a-CS-NR^e-$ で表される基、 $R^cR^dN-CS-NR^e-$ で表される基、 $R^bSO_2-NR^e-$ で表される基、 $R^cR^dN-SO_2-$ で表される基、 $R^aO-N=CR^f-$ で表される基、 $R^hR^iC=N-O-$ で表される基、 $R^a-C(=NR^g)-NR^e-$ で表される基、 $R^cR^dN-C(=NR^g)-$ で表される基、 $R^hR^iS(=O)=N-CO-$ で表される基、 $R^hR^iS=N-CO-$ で表される基。

[0073] 上記の置換基群中、 $R^a$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置

換若しくは無置換の3～10員環のヘテロシクリル基を示す。

R<sup>b</sup>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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

R<sup>c</sup>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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

R<sup>d</sup>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C1～6アルコキシ基、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示し、ここで、R<sup>c</sup>とR<sup>d</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

R<sup>e</sup>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C1～6アルコキシ基、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示す。

R<sup>f</sup>は、水素原子、アミノ基、または置換若しくは無置換のC1～6アルキル基を示す。

R<sup>g</sup>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、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示す。

R<sup>h</sup>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、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示す。

R<sup>i</sup>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、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示し、ここで、R<sup>h</sup>とR<sup>i</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

[0074] Gにおける「ハロゲン基」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。

[0075] Gにおける「C 1～6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。

Gにおける「C 1～6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ができる。

[0076] Gにおける「C 2～6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ができる。

[0077] Gにおける「C 2～6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ができる。

[0078] Gにおける「C 1～6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、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、i-プロポキシ基、i-ブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、i-ヘキシルオキシ基などを挙げるができる。

Gにおける「C 2～6アルケニルオキシ基」としては、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を挙げるができる。

Gにおける「C 2～6 アルキニルオキシ基」としては、エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などを挙げるができる。

[0079] Gにおける「C 1～6 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-プロピルチオ基などを挙げるができる。

Gにおける「C 1～6 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ができる。

Gにおける「C 1～6 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ができる。

[0080] Gにおける「C 1～6 アルキル基」、「C 2～6 アルケニル基」、「C 2～6 アルキニル基」、「C 1～6 アルコキシ基」、「C 2～6 アルケニルオキシ基」、「C 2～6 アルキニルオキシ基」、「C 1～6 アルキルチオ基」、「C 1～6 アルキルスルフィニル基」、または「C 1～6 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C 1～6 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C 1～6 ハロアルコキシ基；メチルチオ基、エチルチオ基などのC 1～6 アルキルチオ基；メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基などのC 1～6 アルキルスルフィニル基；メチルスルホニル基、エチルスルホニル基などのC 1～6 アルキルスルホニル基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3～6 シクロアルキル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10 アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1～6 アルキル基、C 1

～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC6～10アリール基；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5員環のヘテロアリール基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール基；またはシアノ基が好ましい。

[0081] G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ができる。

Gにおける「C3～6シクロアルキルオキシ基」としては、シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基などを挙げるができる。

[0082] Gにおける「C6～10アリール基」としては、フェニル基、ナフチル基などを挙げることができる。

Gにおける「C6～10アリールオキシ基」としては、フェノキシ基、ナフトキシ基などを挙げることができる。

[0083] Gにおける「C6～10アリールチオ基」としては、フェニルチオ基、ナフチルチオ基などを挙げることができる。

Gにおける「C6～10アリールスルフィニル基」としては、フェニルスルフィニル基、ナフチルスルフィニル基などを挙げることができる。

Gにおける「C6～10アリールスルホニル基」としては、フェニルスル

ホニル基、ナフチルスルホニル基などを挙げるができる。

[0084] Gにおける「3～10員環のヘテロシクリル基」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。単環および多環のいずれでもよい。

「3～10員環のヘテロシクリル基」としては、3～6員環の飽和ヘテロシクリル基、5～10員環のヘテロアリアル基、5～10員環の部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げるができる。

[0085] 3～6員環の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、テトラヒドロフランニル基、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、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げるができる。

5～10員環のヘテロアリアル基としては、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の5員環のヘテロアリアル基；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の6員環のヘテロアリアル基；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などの9員ヘテロアリアル基；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の10員ヘテロアリアル基；を挙げるができる。

5～10員環の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、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などの5員環の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員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；インドリニル基、イソインドリニル基、2,3-ジヒドロベンゾフラニル基、1,3-ジヒドロベンゾフラニル基などの9員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル基などの10員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；を挙げることができる。

[0086] Gにおける「3～10員環のヘテロシクリルオキシ基」は、3～10員環のヘテロシクリル基とオキシ基が結合した構造を有する。具体例としては、チアゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基などを挙げることができる。

[0087] Gにおける「C3～6シクロアルキル基」、「C3～6シクロアルキルオキシ基」、「C6～10アリール基」、「C6～10アリールオキシ基」、「C6～10アリールチオ基」、「C6～10アリールスルフィニル基」、「C6～10アリールスルホニル基」、「3～10員環のヘテロシクリル基」、または「3～10員環のヘテロシクリルオキシ基」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；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；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*-ブチル基などのC1～6ハロアルキル基；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C1～6アルコキシ基；C6～10アリールC1～6アルコキシ基；(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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC6～10アリール)C1～6アルコキシ基；5員環のヘテロアリールC1～6アルコキシ基



; (C 1 ~ 6 アルキル基、C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1 ~ 6 ハロアルキル基、またはC 1 ~ 6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 5 員環のヘテロアリール) C 1 ~ 6 アルコキシ基; 6 員環のヘテロアリールC 1 ~ 6 アルコキシ基; (C 1 ~ 6 アルキル基、C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1 ~ 6 ハロアルキル基、またはC 1 ~ 6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 6 員環のヘテロアリール) C 1 ~ 6 アルコキシ基; メチルチオ基、エチルチオ基などのC 1 ~ 6 アルキルチオ基; メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基などのC 1 ~ 6 アルキルスルフィニル基; メチルスルホニル基、エチルスルホニル基などのC 1 ~ 6 アルキルスルホニル基; 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C 1 ~ 6 ハロアルキルチオ基; 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C 1 ~ 6 ハロアルキルスルフィニル基; 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C 1 ~ 6 ハロアルキルスルホニル基; シクロプロピル基、シクロブチル基などのC 3 ~ 6 シクロアルキル基; C 1 ~ 6 アルキル基、C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1 ~ 6 ハロアルキル基、C 1 ~ 6 ハロアルコキシ基、またはシアノ基のいずれか 1 以上の置換基で置換されたC 3 ~ 6 シクロアルキル基; C 3 ~ 6 シクロアルケニル基; フェニル基、ナフチル基などのC 6 ~ 10 アリール基; 4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1 ~ 6 アルキル基、C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1 ~ 6 ハロアルキル基、またはC 1 ~ 6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換されたC 6 ~ 10 アリール基; 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の 3 ~ 4 員環の飽和ヘテロシクリル基; C 1 ~ 6 アルキル基、C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1 ~ 6 ハロアルキル基、またはC 1 ~ 6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 3 ~ 4 員環の飽和ヘテロシクリル基; 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、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、ジオキサニル基、ジオキサニル基などの5～6員環の飽和ヘテロシクリル基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環の飽和ヘテロシクリル基；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5員環のヘテロアリール基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール基；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などの5員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環の部分飽和ヘテロシクリル基；ジヒドロピラニル基などの6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環の部分飽和ヘテロシクリル基；

$R^{G1}-CO-$ で表される基（式中、 $R^{G1}$ は、水素原子；C1～6アルキル基；ハロゲノ基、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、若しくは5～6員環のヘテロアリール基のいずれか1以上の置換基で置換されたC1～6アルキル基；（C1～6ア

ルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された C 6～10 アリール) C 1～6 アルキル基；(C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 5～6 員環のヘテロアリール) C 1～6 アルキル基；C 2～6 アルケニル基；C 2～6 ハロアルケニル基；C 2～6 アルキニル基；C 2～6 ハロアルキニル基；C 3～6 シクロアルキル基；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 ハロアルコキシ基、若しくはシアノ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された C 3～6 シクロアルキル基；C 6～10 アリール基；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された C 6～10 アリール基；5～6 員環のヘテロアリール基；または；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 5～6 員環のヘテロアリール基；を示す。以下の R<sup>G1</sup>においても同じ。)；

カルボキシ基；

R<sup>G2</sup>-O-CO-で表される基 (式中、R<sup>G2</sup>は、C 1～6 アルキル基；ハロゲノ基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 3～6 シクロアルキル基、フェニル基、若しくは 5～6 員環のヘテロアリール基のいずれか 1 以上の置換基で置換された C 1～6 アルキル基；(C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された C 6～10 アリール) C 1～6 アルキル基；(C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか 1 以上の置換基で置換された 5～6 員環のヘテロアリール) C 1～6 アルキル基；C 2～6 アルケニル基；C 2～6 ハロアルケニ

ル基；C 2～6アルキニル基；C 2～6ハロアルキニル基；C 3～6シクロアルキル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6ハロアルコキシ基、若しくはシアノ基で置換されたC 3～6シクロアルキル基；C 6～10アリール基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリール基；5～6員環のヘテロアリール基；または；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリール基；を示す。以下のR<sup>G2</sup>においても同じ。）；

R<sup>G1</sup>R<sup>G1</sup>N-で表される基（式中のR<sup>G1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>G1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>G1</sup>R<sup>G1</sup>N-CO-で表される基（式中のR<sup>G1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>G1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>G1</sup>-CO-O-で表される基；R<sup>G1</sup>-CO-NR<sup>G3</sup>-で表される基（式中、R<sup>G3</sup>は、水素原子；C 1～6アルキル基；ハロゲノ基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～6シクロアルキル基、フェニル基、若しくは5～6員環のヘテロアリール基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 1～6アルキル基；（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリール）C 1～6アルキル基；または（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリール）C 1～6アルキル基；を示す。以下のR<sup>G3</sup>においても同じ。）；

R<sup>G2</sup>-O-CO-O-で表される基；R<sup>G2</sup>-O-CO-NR<sup>G3</sup>-で表される

基； $R^{G1}R^{G1}N-CO-O-$ で表される基（式中の $R^{G1}$ は同一でも異なってもよい。 $R^{G1}$ 同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

$R^{G1}R^{G1}N-CO-NR^{G3}-$ で表される基（式中の $R^{G1}$ は同一でも異なってもよい。 $R^{G1}$ 同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）； $R^{G2}SO_2-NR^{G3}-$ で表される基； $R^{G1}R^{G1}N-SO_2-$ で表される基（式中の $R^{G1}$ は同一でも異なってもよい。 $R^{G1}$ 同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

$R^{G1}-O-N=C(R^{G4})-$ で表される基（式中、 $R^{G4}$ は、水素原子またはC1～6アルキル基を示す。）； $(R^{G1})_2C=N-O-$ で表される基（式中の $R^{G1}$ は同一でも異なってもよい。 $R^{G1}$ 同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

$R^{G1}-O-N=C(R^{G4})-$ で表される基（式中、 $R^{G4}$ は、水素原子またはC1～6アルキル基を示す。）； $(R^{G1})_2C=N-O-$ で表される基（式中の $R^{G1}$ は同一でも異なってもよい。 $R^{G1}$ 同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

ペンタフルオロスルファニル基、ニトロ基、またはシアノ基が好ましい。

さらに、「C3～6シクロアルキル基」、「C3～6シクロアルキルオキシ基」、「3～10員環のヘテロシクリル基」、または「3～10員環のヘテロシクリルオキシ基」上の置換基としては、オキソ基も好ましい。

[0088] Gにおける「 $R^a-CO-$ で表される基」中、 $R^a$ 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、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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の3～10員環のヘテロシクリル基を示す。

[0089]  $R^a$ 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。

R<sup>a</sup>における「C2~6アルケニル基」としては、ビニル基、1-プロペニル基などを挙げることができる。

R<sup>a</sup>における「C2~6アルキニル基」としては、エチニル基、1-プロピニル基などを挙げることができる。

R<sup>a</sup>における「C1~6アルキル基」、「C2~6アルケニル基」、または「C2~6アルキニル基」上の置換基としては、フルオロ基、クロロ基、ブromo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；メチルチオ基、エチルチオ基などのC1~6アルキルチオ基；メチルスルフィニル基、エ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；メチルスルホニル基、エチルスルホニル基などのC1~6アルキルスルホニル基；カルボキシ基；メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基などのC1~6アルコキシカルボニル基；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、ナフチル基などのC6~10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、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、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC6~10アリール基；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5員環のヘテロアリアル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリアル基；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の6員環のヘテロアリアル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリアル基；またはシアノ基が好ましい。

[0090] R<sup>a</sup>における「C 3～6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事ができる。

R<sup>a</sup>における「C 6～10アリアル基」としては、フェニル基、ナフチル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げる事ができる。

[0091] R<sup>a</sup>における「3～10員環のヘテロシクリル基」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。単環および多環のいずれでもよい。

「3～10員環のヘテロシクリル基」としては、3～6員環の飽和ヘテロシクリル基、5～10員環のヘテロアリアル基、5～10員環の部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げる事ができる。

3～6員環の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、テトラヒドロフランニル基、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、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げる事ができる。

5～10員環のヘテロアリアル基としては、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の5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；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などの9員ヘテロアリール基；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の10員ヘテロアリール基；を挙げることができる。

5～10員環の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、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などの5員環の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員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；インドリニル基、イソインドリニル基、2,3-ジヒドロベンゾフラニル基、1,3-ジヒドロベンゾフラニル基などの9員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル基などの10員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；を挙げることができる。

[0092] R<sup>a</sup>における「C3～6シクロアルキル基」、「C6～10アリール基」、または「3～10員環のヘテロシクリル基」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ン基；メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*s*-ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基などのC1～6アルキル基；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*-ブチル基などのC1～6ハロアルキル基；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*



ーブトキシ基などのC 1～6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C 1～6ハロアルコキシ基；C 3～6シクロアルキルC 1～6アルコキシ基；C 6～10アリールC 1～6アルコキシ基；(C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリール) C 1～6アルコキシ基；5員環のヘテロアリールC 1～6アルコキシ基；(C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール) C 1～6アルコキシ基；6員環のヘテロアリールC 1～6アルコキシ基；(C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール) C 1～6アルコキシ基；メチルチオ基、エチルチオ基などのC 1～6アルキルチオ基；メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基などのC 1～6アルキルスルフィニル基；メチルスルホニル基、エチルスルホニル基などのC 1～6アルキルスルホニル基；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C 1～6ハロアルキルチオ基；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C 1～6ハロアルキルスルフィニル基；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C 1～6ハロアルキルスルホニル基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基などのC 3～6シクロアルキル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6ハロアルコキシ基、またはシアノ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 3～6シクロアルキル基；C 3～6シクロアルケニル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフ

エニル基などの、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリール基；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の3～4員環の飽和ヘテロシクリル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された3～4員環の飽和ヘテロシクリル基；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、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、ジオキサニル基、ジオキサニル基などの5～6員環の飽和ヘテロシクリル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環の飽和ヘテロシクリル基；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5員環のヘテロアリール基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール基；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などの5員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環の部分飽和ヘテロシクリル基；ジヒドロピラニル基などの6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；

C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環の部分飽和ヘテロシクリル基；

$R^{q1}-CO-$ で表される基（式中、 $R^{q1}$ は、水素原子；C 1～6アルキル基；ハロゲノ基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～6シクロアルキル基、フェニル基、若しくは5～6員環のヘテロアリアル基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 1～6アルキル基；（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリアル）C 1～6アルキル基；（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリアル）C 1～6アルキル基；C 2～6アルケニル基；C 2～6ハロアルケニル基；C 2～6アルキニル基；C 2～6ハロアルキニル基；C 3～6シクロアルキル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6ハロアルコキシ基、若しくはシアノ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 3～6シクロアルキル基；C 6～10アリアル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリアル基；5～6員環のヘテロアリアル基；または；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリアル基；を示す。以下の $R^{q1}$ においても同じ。）；

カルボキシ基；

$R^{q2}-O-CO-$ で表される基（式中、 $R^{q2}$ は、C 1～6アルキル基；ハロゲノ基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～6シクロアルキル基、フェニル基、若しくは5～6員環のヘテロアリアル基のい

れか1以上の置換基で置換されたC1～6アルキル基；（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以上の置換基で置換されたC6～10アリール）C1～6アルキル基；（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以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリール）C1～6アルキル基；C2～6アルケニル基；C2～6ハロアルケニル基；C2～6アルキニル基；C2～6ハロアルキニル基；C3～6シクロアルキル基；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、C1～6ハロアルコキシ基、若しくはシアノ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC3～6シクロアルキル基；C6～10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以上の置換基で置換されたC6～10アリール基；5～6員環のヘテロアリール基；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以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリール基；を示す。以下のR<sup>q2</sup>において同じ。）；

R<sup>q1</sup>R<sup>q1</sup>N-で表される基（式中のR<sup>q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>q1</sup>R<sup>q1</sup>N-CO-で表される基（式中のR<sup>q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>q1</sup>-CO-O-で表される基；R<sup>q1</sup>-CO-NR<sup>q3</sup>-で表される基（式中、R<sup>q3</sup>は、水素原子；C1～6アルキル基；ハロゲノ基、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、若しくは5～6員環のヘテロアリール基のいずれか1以上の置換基で置換

されたC 1～6アルキル基；（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲン基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリール）C 1～6アルキル基；または（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲン基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリール）C 1～6アルキル基；を示す。以下のR<sup>q3</sup>において同じ。）；

R<sup>q2</sup>-O-CO-O-で表される基；R<sup>q2</sup>-O-CO-NR<sup>q3</sup>-で表される基；R<sup>q1</sup>R<sup>q1</sup>N-CO-O-で表される基（式中のR<sup>q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>q1</sup>R<sup>q1</sup>N-CO-NR<sup>q3</sup>-で表される基（式中のR<sup>q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；R<sup>q2</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>q3</sup>-で表される基；R<sup>q1</sup>R<sup>q1</sup>N-SO<sub>2</sub>-で表される基（式中のR<sup>q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>q1</sup>-O-N=C(R<sup>q4</sup>)-で表される基（式中、R<sup>q4</sup>は、水素原子またはC 1～6アルキル基を示す。）；(R<sup>q1</sup>)<sub>2</sub>C=N-O-で表される基（式中のR<sup>q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

ペンタフルオロスルファニル基、ニトロ基、またはシアノ基が好ましい。

さらに、「C 3～6シクロアルキル基」、または「3～10員環のヘテロシクリル基」上の置換基としては、オキソ基も好ましい。

[0093] 「R<sup>a</sup>-CO-で表される基」の具体例としては、ホルミル基、アセチル基

、*i*-プロピルカルボニル基などを挙げるができる。

[0094] Gにおける「 $R^b-O-CO-$ で表される基」中、 $R^b$ は、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

$R^b$ における置換基の具体例は、 $R^a$ において例示したのと同じものを挙げるができる。

[0095] 「 $R^b-O-CO-$ で表される基」の具体例としては、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ができる。

[0096] Gにおける「 $R^c-R^d-N-$ で表される基」中、 $R^c$ は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、 $R^d$ は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示す。

$R^c$ または $R^d$ における置換基の具体例は、 $R^a$ において例示したのと同じものを挙げるができる。

$R^d$ における「C 1～6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、*n*-ブトキシ基、*n*-ペンチルオキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、*i*-プロポキシ基、*i*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、*i*-ヘキシルオキシ基などを挙げるができる。

$R^d$ における「C 1～6アルコキシ基」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C 1~6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C 1~6ハロアルコキシ基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3~6シクロアルキル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6~10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1~6アルキル基、C 1~6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1~6ハロアルキル基、またはC 1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6~10アリール基；またはシアノ基が好ましい。

[0097] ここで、R<sup>c</sup>とR<sup>d</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

形成できる二価の有機基としては、置換若しくは無置換のC 2~5アルキレン基、置換若しくは無置換のC 1~3アルキレンオキシC 1~3アルキレン基、置換若しくは無置換のC 1~3アルキレンチオC 1~3アルキレン基、または置換若しくは無置換のC 1~3アルキレンイミノC 1~3アルキレン基などを挙げるができる。

さらに、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-などのケイ素含有の2価炭化水素基を挙げるができる。

「C 2~5アルキレン基」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を挙げるができる。

「C 1~3アルキレンオキシC 1~3アルキレン基」としては、ジメチレンオキシジメチレン基などを挙げるができる。

「C 1~3アルキレンチオC 1~3アルキレン基」としては、ジメチレンチオジメチレン基などを挙げるができる。

「C 1~3アルキレンイミノC 1~3アルキレン基」としては、ジメチレンイミノジメチレン基、などを挙げるができる。

ここで、「C 1~3アルキレンアルキレンイミノC 1~3アルキレン基」

のイミノ基とは、 $-NH-$ を意味する。

「C<sub>2</sub>~5アルキレン基」、「C<sub>1</sub>~3アルキレンオキシC<sub>1</sub>~3アルキレン基」、「C<sub>1</sub>~3アルキレンチオC<sub>1</sub>~3アルキレン基」及び「C<sub>1</sub>~3アルキレンイミノC<sub>1</sub>~3アルキレン基」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ン基；メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*s*-ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基などのC<sub>1</sub>~6アルキル基；メチリデン基；またはクロロメチル基、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*-ブチル基などのC<sub>1</sub>~6ハロアルキル基が好ましい。

[0098] 「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-で表される基」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、*i*-プロピルアミノ基などを挙げることができる。

[0099] Gにおける「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CO-で表される基」中、R<sup>c</sup>およびR<sup>d</sup>は上記の「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CO-で表される基」の具体例としては、カルバモイル基、N, N-ジメチルアミノカルボニル基、N-(*i*-プロピル)アミノカルボニル基、N-(*i*-プロピル)-N-メチルアミノカルボニル基などを挙げることができる。

[0100] Gにおける「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-NR<sup>d</sup>-CO-で表される基」中、R<sup>c</sup>およびR<sup>d</sup>は上記の「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-NR<sup>d</sup>-CO-で表される基」の具体例としては、2, 2-ジメチルヒドラジン-1-カルボニル基などを挙げることができる。

[0101] Gにおける「R<sup>b</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>d</sup>-CO-で表される基」中、R<sup>b</sup>は上記の「R<sup>b</sup>-O-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示し、R<sup>d</sup>は上記の「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>b</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>d</sup>-CO-で表される基」の具体例としては、(メチルスルホニル)カルバモイル基、(シクロプロピルスルホニル)カルバモイル基、((1-メチルシクロプロピル)スルホニル)カルバモイル基などを挙げ



ることができる。

[0102] Gにおける「 $R^a-CO-O-$ で表される基」中、 $R^a$ は上記の「 $R^a-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^a-CO-O-$ で表される基」の具体例としては、アセチルオキシ基などを挙げるることができる。

[0103] Gにおける「 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基」中、 $R^a$ は上記の「 $R^a-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

$R^e$ 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、または置換若しくは無置換のC6~10アリール基を示す。

$R^e$ における置換基の具体例は、 $R^a$ において例示したものと同一ものを挙げるることができる。

「 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基」の具体例としては、アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、*i*-プロピルカルボニルアミノ基などを挙げるることができる。

[0104] Gにおける「 $R^a-CO-CO-NR^e-$ で表される基」中、 $R^a$ は上記の「 $R^a-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^e$ は、上記の「 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^a-CO-CO-NR^e-$ で表される基」の具体例としては、オキサプロパンアミド基などを挙げるることができる。

[0105] Gにおける「 $R^a-CO-NR^e-NR^e-$ で表される基」中、 $R^a$ は上記の「 $R^a-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^e$ は、上記の「 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^a-CO-NR^e-NR^e-$ で表される基」の具体例としては、アセチルヒドラジニル基、*i*-プロピルカルボニルヒドラジニル基などを挙げるることができる。

[0106] Gにおける「 $R^a-CO-NR^e-NR^e-CO-$ で表される基」中、 $R^a$ は

上記の「 $R^a-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^e$ は、上記の「 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^a-CO-NR^e-NR^e-CO-$ で表される基」の具体例としては、2-アセチルヒドラジン-1-カルボニル基などを挙げることができる。

[0107] Gにおける「 $R^b-O-CO-O-$ で表される基」中、 $R^b$ は上記の「 $R^b-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^b-O-CO-O-$ で表される基」の具体例としては、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などを挙げることができる。

[0108] Gにおける「 $R^b-O-CO-NR^e-$ で表される基」中、 $R^b$ は上記の「 $R^b-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^e$ は上記の「 $R^b-CO-NR^e-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^b-O-CO-NR^e-$ で表される基」の具体例としては、メトキシカルボニルアミノ基などを挙げることができる。

[0109] Gにおける「 $R^cR^dN-CO-O-$ で表される基」中、 $R^c$ および $R^d$ は上記の「 $R^cR^dN-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「 $R^cR^dN-CO-O-$ で表される基」の具体例としては、カルバモイルオキシ基、N, N-ジメチルアミノカルボニルオキシ基などを挙げることができる。

[0110] Gにおける「 $R^cR^dN-CO-NR^e-$ で表される基」中、 $R^c$ および $R^d$ は上記の「 $R^cR^dN-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。 $R^e$ は上記の「 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^cR^dN-CO-NR^e-$ で表される基」の具体例としては、カルバモイルアミノ基、N, N-ジメチルアミノカルボニルアミノ基などを挙げることができる。

[0111] Gにおける「 $R^cR^dN-CO-CO-NR^e-$ で表される基」中、 $R^c$ および $R^d$ は上記の「 $R^cR^dN-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

す。R<sup>e</sup>は上記の「R<sup>a</sup>-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CO-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基」の具体例としては、2-(メチルアミノ)-2-オキソアセトアミド基、2-(t-ブチルアミノ)-2-オキソアセトアミド基などを挙げることができる。

[0112] Gにおける「R<sup>a</sup>-CS-NR<sup>e</sup>-で表される基」中、R<sup>a</sup>は上記の「R<sup>a</sup>-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。R<sup>e</sup>は、上記の「R<sup>a</sup>-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>a</sup>-CS-NR<sup>e</sup>-で表される基」の具体例としては、エタンチオアミド基、プロパンチオアミド基、2-メチルプロパンチオアミド基などを挙げることができる。

[0113] Gにおける「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CS-NR<sup>e</sup>-で表される基」中、R<sup>c</sup>およびR<sup>d</sup>は上記の「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。R<sup>e</sup>は上記の「R<sup>a</sup>-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CS-NR<sup>e</sup>-で表される基」の具体例としては、3,3-ジメチルチオウレイド基などを挙げることができる。

[0114] Gにおける「R<sup>b</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>e</sup>-で表される基」中、R<sup>b</sup>は上記の「R<sup>b</sup>-O-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。R<sup>e</sup>は上記の「R<sup>a</sup>-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>b</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>e</sup>-で表される基」の具体例としては、メタンスルホニルアミノ基などを挙げることができる。

[0115] Gにおける「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-SO<sub>2</sub>-で表される基」中、R<sup>c</sup>およびR<sup>d</sup>は上記の「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-SO<sub>2</sub>-で表される基」の具体例としては、N,N-ジメチルアミノスルホニル基などを挙げることができる。

[0116] Gにおける「R<sup>a</sup>O-N=CR<sup>f</sup>-で表される基」中、R<sup>a</sup>は上記の「R<sup>a</sup>-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

$R^f$ は、水素原子、アミノ基、または置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基を示す。

$R^f$ における置換基の具体例は、 $R^a$ において例示したものと同一ものを挙げることができる。

「 $R^aO-N=CR^f-$ で表される基」の具体例としては、(ヒドロキシイミノ)メチル基、(エトキシイミノ)メチル基などを挙げることができる。

[0117] Gにおける「 $R^a-C(=NR^g)-NR^e-$ で表される基」中、 $R^a$ は上記の「 $R^a-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^e$ は上記の「 $R^a-CO-NR^e-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

$R^g$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示す。

$R^g$ における置換基の具体例は、 $R^a$ において例示したものと同一ものを挙げることができる。

[0118] Gにおける「 $R^cR^dN-C(=NR^g)-$ で表される基」中、 $R^c$ および $R^d$ は上記の「 $R^cR^dN-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。 $R^g$ は上記の「 $R^a-C(=NR^g)-NR^e-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

[0119] Gにおける「 $R^hR^iS(=O)=N-CO-$ で表される基」中、 $R^h$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示し、 $R^i$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示す。

$R^h$ または $R^i$ における置換基の具体例は、 $R^a$ において例示したものと同一ものを挙げることができる。

[0120] ここで、 $R^h$ と $R^i$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

形成できる二価の有機基としては、置換若しくは無置換のC 2～5アルキレン基または置換若しくは無置換のC 1～3アルキレンオキシC 1～3アル

キレン基を挙げることができる。

「C 2～5アルキレン基」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を挙げることができる。

「C 1～3アルキレンオキシC 1～3アルキレン基」としては、ジメチレンオキシジメチレン基などを挙げることができる。

「C 2～5アルキレン基」または「C 1～3アルキレンオキシC 1～3アルキレン基」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；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*-ブチル基などのC 1～6アルキル基；またはクロロメチル基、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*-ブチル基などのC 1～6ハロアルキル基が好ましい。

[0121] Gにおける「 $R^h R^i S = N - CO -$ で表される基」中、 $R^h$ または $R^i$ は上記の「 $R^h R^i S (=O) = N - CO -$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

[0122] Gにおける「 $R^h R^i C = N - O -$ で表される基」中、 $R^h$ および $R^i$ は上記の「 $R^h R^i S = N - O -$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^h R^i C = N - O -$ で表される基」の具体例としては、（プロパン-2-イリデンアミノ）オキシ基などを挙げることができる。

[0123] 置換基（G）が2以上ある場合に、そのうちの2つが一緒になって形成できる二価の有機基としては、置換若しくは無置換のC 1～5アルキレン基、置換若しくは無置換のオキシC 1～4アルキレン基、置換若しくは無置換のオキシC 2～3アルキレンオキシ基、または置換若しくは無置換のC 1～3アルキレンオキシC 1～3アルキレン基を挙げることができる。

「C 1～5アルキレン基」としては、メチレン基、ジメチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基などを挙げることができる。

「オキシC 1～4アルキレン基」としては、オキシメチレン基、オキシジメチレン基などを挙げることができる。

「オキシC<sub>2</sub>～3アルキレンオキシ基」としては、オキシジメチレンオキシ基などを挙げるができる。

「C<sub>1</sub>～3アルキレンオキシC<sub>1</sub>～3アルキレン基」としては、ジメチレンオキシジメチレン基などを挙げるができる。

「C<sub>1</sub>～5アルキレン基」、「オキシC<sub>1</sub>～4アルキレン基」、「オキシC<sub>2</sub>～3アルキレンオキシ基」、「C<sub>1</sub>～3アルキレンオキシC<sub>1</sub>～3アルキレン基」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；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*-ブチル基などのC<sub>1</sub>～6アルキル基；またはクロロメチル基、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*-ブチル基などのC<sub>1</sub>～6ハロアルキル基が好ましい。

[0124] 本発明において、好ましいGとしては、ハロゲノ基、置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルキル基、置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC<sub>3</sub>～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC<sub>6</sub>～10アリール基、置換若しくは無置換の3～10員環のヘテロシクリル基、R<sup>b</sup>-O-CO-で表される基、R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-で表される基、R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CO-で表される基、R<sup>a</sup>-CO-O-で表される基、R<sup>a</sup>-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基、R<sup>b</sup>-O-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基、R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CO-O-で表される基、R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CO-NR<sup>e</sup>-で表される基、R<sup>c</sup>R<sup>d</sup>N-CS-NR<sup>e</sup>-で表される基、R<sup>b</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>e</sup>-で表される基、R<sup>a</sup>O-N=CR<sup>f</sup>-で表される基、またはR<sup>h</sup>R<sup>i</sup>C=N-O-で表される基が挙げるができる。

[0125] [上記X<sup>3</sup>以外のX<sup>3</sup>及びR<sup>N1</sup>、R<sup>N2</sup>]

さらに、X<sup>3</sup>は、R<sup>N1</sup>O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-O-で表される基

、 $R^{N1}-CS-O-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CS-O-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N2}N-$ で表される基、 $R^{N1}-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}-CO-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}-O-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CO-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}-CS-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CS-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}SO_2-NR^{N2}-$ で表される基、または $R^{N1}-C(=NR^{N1})-NR^{N2}-$ で表される基を示す。

[0126]  $R^{N1}$ 、および $R^{N2}$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C 1～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基を示し、ここで、 $R^{N1}$ と $R^{N1}$ 、または $R^{N1}$ と $R^{N2}$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

[0127]  $R^{N1}$ 、および $R^{N2}$ における「直鎖C 1～6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*-ヘキシル基を挙げることができる。

$R^{N1}$ 、および $R^{N2}$ における「直鎖C 2～6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-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-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-ヘキセニル基を挙げることができる。

$R^{N1}$ 、および $R^{N2}$ における「直鎖C 2～6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-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-ヘキシニル基などを挙げることができる。

$R^{N1}$ 、および $R^{N2}$ における「4員環のヘテロシクリル基」しては、アゼチ

ジニル基、オキセタニル基を挙げることができる。

$R^{N1}$ 、および $R^{N2}$ におけるその他の置換基の具体例は、 $X^1$ において例示したものと同一ものを挙げることができる。

[0128] [ $X^4$ ]

$X^4$ は、 $Q-A-$ で表される基、 $Q-A-B-$ で表される基、 $Q-B-A-$ で表される基、 $Q-SO_2-NR^{N3}$ で表される基、 $Q-C(R^7)=N-$ で表される基、 $Q-NR^{N3}-SO_2-$ で表される基、 $Q-N=C(R^7)-$ で表される基、または $Q-B-$ で表される基を示す。

[0129] [A]

Aは、置換若しくは無置換のC1～6アルキレン基、置換若しくは無置換のC2～6アルケニレン基、置換若しくは無置換のC2～6アルキニレン基、置換若しくは無置換のC3～6シクロアルキレン基、またはカルボニル基を示す。

[0130] Aにおける「C1～6アルキレン基」としては、メチレン基、ジメチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基などを挙げることができる。

Aにおける「C2～6アルケニレン基」としては、ビニレン基 ( $-CH=CH-$ )、ジビニレン基 ( $-CH=CH-CH=CH-$ )、プロペニレン基 ( $-CH=CH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ )などを挙げることができる。

Aにおける「C2～6アルキニレン基」としては、エチニレン基 ( $-C\equiv C-$ )、プロピニレン基 ( $-CH_2-C\equiv C-$ 、 $-C\equiv C-CH_2-$ )、などを挙げることができる。

Aにおける「C3～6シクロアルキレン基」としては、1,2-シクロプロピレン基、1,2-シクロブタンジイル基、1,3-シクロブタンジイル基などを挙げることができる。

[0131] 本発明において、好ましいAとしては、置換若しくは無置換のC1～6アルキレン基または置換若しくは無置換のC2～6アルケニレン基を挙げることができる。



C 1～6アルキレン基またはC 2～6アルケニレン基上の置換基としては、以下の置換基群より選択される1または2以上の置換基を挙げることができる（以下、この置換基を記号「G a」で表すことがある。）。

また、置換基（G a）は2以上ある場合、そのうちの2つが一緒になって二価の有機基を形成してもよい。以下に置換基群を示す。

ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、メルカプト基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルホニル基、置換若しくは無置換の3～6員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の3～6員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、 $R^{a1}-CO-$ で表される基、カルボキシ基、 $R^{b1}-O-CO-$ で表される基、 $R^{c1}R^{d1}N-$ で表される基、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-$ で表される基、 $R^{a1}-CO-O-$ で表される基、 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基、 $R^{b1}-O-CO-O-$ で表される基、 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-$ で表される基、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-O-$ で表される基、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}-$ で表される基、 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-$ で表される基、 $R^{c1}R^{d1}N-SO_2-$ で表される基、 $R^{a1}O-N=CR^{f1}-$ で表される基、 $R^{g1}R^{h1}C=N-O-$ で表される基、オキソ基（O=）、チオキソ基（S=）、 $R^{a1}-N=$ で表される二価の基、 $R^{a1}O-N=$ で表される二価の基、 $R^{c1}R^{d1}N-N=$ で表される二価の基、 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-N=$ で表される二価の基

、 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-N=$ で表される二価の基、 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-N=$ で表される二価の基。

[0132] 上記の置換基群中、 $R^{a1}$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^{b1}$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^{c1}$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^{d1}$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示し、ここで、 $R^{c1}$ と $R^{d1}$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

$R^{e1}$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示し、

$R^{f1}$ は、水素原子、または置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基を示し、

$R^{g1}$ は、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル

ル基を示し、

$R^{h1}$ は、水素原子、または置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基を示し、ここで、 $R^{g1}$ と $R^{h1}$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

[0133] Ga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ができる。

[0134] Gaにおける「C 1～6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。Gaにおける「C 1～6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ができる。

[0135] Gaにおける「C 2～6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ができる。

[0136] Gaにおける「C 2～6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ができる。

[0137] Gaにおける「C 1～6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、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、i-プロポキシ基、i-ブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、i-ヘキシルオキシ基などを挙げるができる。

G aにおける「C 2～6アルケニルオキシ基」としては、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を挙げることができる。

G aにおける「C 2～6アルキニルオキシ基」としては、エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などを挙げるができる。

[0138] G aにおける「C 1～6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-プロピルチオ基などを挙げるができる。

G aにおける「C 1～6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ができる。

G aにおける「C 1～6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ができる。

[0139] G aにおける「C 1～6アルキル基」、「C 2～6アルケニル基」、「C 2～6アルキニル基」、「C 1～6アルコキシ基」、「C 2～6アルケニルオキシ基」、「C 2～6アルキニルオキシ基」、「C 1～6アルキルチオ基」、「C 1～6アルキルスルフィニル基」、または「C 1～6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C 1～6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C 1～6ハロアルコキシ基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3～6シクロアルキル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1～6アルキル基、C 1～6

アルコキシ基、ハロゲン基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリアル基；またはシアノ基が好ましい。

[0140] Gaにおける「C 3～6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。

Gaにおける「C 3～6シクロアルキルオキシ基」としては、シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基などを挙げることができる。

[0141] Gaにおける「C 6～10アリアル基」としては、フェニル基、ナフチル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げることができる。

Gaにおける「C 6～10アリアルオキシ基」としては、フェノキシ基、ナフトキシ基などを挙げることができる。

[0142] Gaにおける「C 6～10アリアルチオ基」としては、フェニルチオ基、ナフチルチオ基などを挙げることができる。

Gaにおける「C 6～10アリアルスルフィニル基」としては、フェニルスルフィニル基、ナフチルスルフィニル基などを挙げることができる。

Gaにおける「C 6～10アリアルスルホニル基」としては、フェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基などを挙げることができる。

[0143] Gaにおける「3～6員環のヘテロシクリル基」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。「3～6員環のヘテロシクリル基」としては、3～6員環の飽和ヘテロシクリル基、5～6員環のヘテロアリアル基、5～6員環の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。

[0144] 3～6員環の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、テトラヒドロフランニル基、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、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げるができる。

5～6員環のヘテロアリアル基としては、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の5員環のヘテロアリアル基；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の6員環のヘテロアリアル基を挙げるができる。

5～6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基としては、ピロリニル基、ジヒドロフランニル基、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などの5員環の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員環の部分不飽和ヘテロシクリル基を挙げるができる。

[0145] Gaにおける「3～6員環のヘテロシクリルオキシ基」は、3～6員環のヘテロシクリル基とオキシ基が結合した構造を有する。具体例としては、チアゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基などを挙げるができる。

[0146] Gaにおける「C3～6シクロアルキル基」、「C3～6シクロアルキルオキシ基」、「C6～10アリアル基」、「C6～10アリアルオキシ基」、「C6～10アリアルチオ基」、「C6～10アリアルスルフィニル基」、「C6～10アリアルスルホニル基」、「3～6員環のヘテロシクリル基」、または「3～6員環のヘテロシクリルオキシ基」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ン基；メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基などのC1～6アルキル基；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-ブチル基など

のC 1～6ハロアルキル基；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C 1～6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C 1～6ハロアルコキシ基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリール基；またはシアノ基が好ましい。

[0147] Gaにおける「R<sup>a1</sup>-CO-で表される基」中、R<sup>a1</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示す。

[0148] R<sup>a1</sup>における「C 1～6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ができる。

R<sup>a1</sup>における「C 2～6アルケニル基」としては、ビニル基、1-プロペニル基などを挙げるができる。

R<sup>a1</sup>における「C 2～6アルキニル基」としては、エチニル基、1-プロピニル基などを挙げるができる。

R<sup>a1</sup>における「C 1～6アルキル基」、「C 2～6アルケニル基」、または「C 2～6アルキニル基」上の置換基としては、フルオロ基、クロロ基、ブromo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；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、ナフチル基などのC6~10アリアル基；4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、ハロゲノ基、C1~6ハロアルキル基、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC6~10アリアル基；またはシアノ基が好ましい。

[0149] R<sup>a1</sup>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事ができる。

R<sup>a1</sup>における「C6~10アリアル基」としては、フェニル基、ナフチル基などを挙げる事ができる。

[0150] R<sup>a1</sup>における「5~6員環のヘテロシクリル基」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員環のヘテロシクリル基」としては、5~6員環の飽和ヘテロシクリル基、5~6員環のヘテロアリアル基、5~6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げる事ができる。

5~6員環の飽和ヘテロシクリル基としては、ピロリジニル基、テトラヒドロフランニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロ-2H-ピラニル基、ペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げる事ができる。

5~6員環のヘテロアリアル基としては、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の5員環のヘテロアリアル基；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の6員環のヘテロアリアル基を挙げることができる。

5～6員環の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、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などの5員環の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員環の部分不飽和ヘテロシクリル基を挙げることができる。

[0151]  $R^{a1}$ における「C3～6シクロアルキル基」、「C6～10アリアル基」、または「5～6員環のヘテロシクリル基」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；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；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*-ブチル基などのC1～6ハロアルキル基；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；フェニル基、ナフチル基などのC6～10アリアル基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC6～10アリアル基；またはシアノ基が好ましい。

[0152] 「 $R^{a1}-CO-$ で表される基」の具体例としては、ホルミル基、アセチル基などを挙げることができる。

[0153] Gaにおける「R<sup>b1</sup>-O-CO-で表される基」中、R<sup>b1</sup>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、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C6~10アリール基、または置換若しくは無置換の5~6員環のヘテロシクリル基を示す。

R<sup>b1</sup>における置換基の具体例は、R<sup>a1</sup>において例示したものと同一ものを挙げるができる。

[0154] 「R<sup>b1</sup>-O-CO-で表される基」の具体例としては、メトキシカルボニル基、エ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ができる。

[0155] Gaにおける「R<sup>c1</sup>R<sup>d1</sup>N-で表される基」中、R<sup>c1</sup>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、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C6~10アリール基、または置換若しくは無置換の5~6員環のヘテロシクリル基を示し、R<sup>d1</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC1~6アルキル基、または置換若しくは無置換のC6~10アリール基を示す。

R<sup>c1</sup>またはR<sup>d1</sup>における置換基の具体例は、R<sup>a1</sup>において例示したものと同一ものを挙げるができる。

ここで、R<sup>c1</sup>とR<sup>d1</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。形成できる二価の有機基としては、置換若しくは無置換のC2~5アルキレン基または置換若しくは無置換のC1~3アルキレンオキシC1~3アルキレン基を挙げるができる。

「C2~5アルキレン基」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を挙げるができる。

「C1~3アルキレンオキシC1~3アルキレン基」としては、ジメチレンオキシジメチレン基などを挙げるができる。

「C2~5アルキレン基」または「C1~3アルキレンオキシC1~3ア

ルキレン基」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；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*-ブチル基などのC 1～6アルキル基；またはクロロメチル基、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*-ブチル基などのC 1～6ハロアルキル基が好ましい。

[0156] 「 $R^{c1}R^{d1}N-$ で表される基」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基などを挙げることができる。

[0157]  $G_a$ における「 $R^{c1}R^{d1}N-CO-$ で表される基」中、 $R^{c1}$ および $R^{d1}$ は上記の「 $R^{c1}R^{d1}N-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「 $R^{c1}R^{d1}N-CO-$ で表される基」の具体例としては、カルバモイル基、*N,N*-ジメチルアミノカルボニル基、*N*-(*i*-プロピル)アミノカルボニル基、*N*-(*i*-プロピル)-*N*-メチルアミノカルボニル基などを挙げることができる。

[0158]  $G_a$ における「 $R^{a1}-CO-O-$ で表される基」中、 $R^{a1}$ は上記の「 $R^{a1}-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^{a1}-CO-O-$ で表される基」の具体例としては、アセチルオキシ基などを挙げることができる。

[0159]  $G_a$ における「 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基」中、 $R^{a1}$ は上記の「 $R^{a1}-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

$R^{e1}$ は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示す。

$R^{e1}$ における置換基の具体例は、 $R^{a1}$ において例示したものと同一ものを挙げることができる。

「 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基」の具体例としては、アセチルアミノ基などを挙げることができる。

[0160]  $G_a$ における「 $R^{b1}-O-CO-O-$ で表される基」中、 $R^{b1}$ は上記の「 $R^{b1}-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^{b1}-O-CO-O-$ で表される基」の具体例としては、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などを挙げることができる。

[0161] Gaにおける「 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-$ で表される基」中、 $R^{b1}$ は上記の「 $R^{b1}-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^{e1}$ は上記の「 $R^{b1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-$ で表される基」の具体例としては、メトキシカルボニルアミノ基などを挙げることができる。

[0162] Gaにおける「 $R^{c1}R^{d1}N-CO-O-$ で表される基」中、 $R^{c1}$ および $R^{d1}$ は上記の「 $R^{c1}R^{d1}N-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「 $R^{c1}R^{d1}N-CO-O-$ で表される基」の具体例としては、カルバモイルオキシ基、N, N-ジメチルアミノカルボニルオキシ基などを挙げることができる。

[0163] Gaにおける「 $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}-$ で表される基」中、 $R^{c1}$ および $R^{d1}$ は上記の「 $R^{c1}R^{d1}N-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。 $R^{e1}$ は上記の「 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}-$ で表される基」の具体例としては、カルバモイルアミノ基、N, N-ジメチルアミノカルボニルアミノ基などを挙げることができる。

[0164] Gaにおける「 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-$ で表される基」中、 $R^{b1}$ は上記の「 $R^{b1}-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^{e1}$ は上記の「 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-$ で表される基」の具体例としては、メタンスルホニルアミノ基などを挙げることができる。

[0165] Gaにおける「 $R^{c1}R^{d1}N-SO_2-$ で表される基」中、 $R^{c1}$ および $R^{d1}$

は上記の「 $R^{c1}R^{d1}N-$ で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「 $R^{c1}R^{d1}N-SO_2-$ で表される基」の具体例としては、N、N-ジメチルアミノスルホニル基などを挙げることができる。

[0166] Gaにおける「 $R^{a1}O-N=CR^{f1}-$ で表される基」中、 $R^{a1}$ は上記の「 $R^{a1}-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

$R^{f1}$ 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。

$R^{f1}$ における置換基の具体例は、 $R^a$ において例示したものと同一ものを挙げることができる。

「 $R^{a1}O-N=CR^{f1}-$ で表される基」の具体例としては、(ヒドロキシイミノ)メチル基、(エトキシイミノ)メチル基などを挙げることができる。

[0167] Gaにおける「 $R^{g1}R^{h1}C=N-O-$ で表される基」中、 $R^{g1}$ 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、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C6~10アリアル基、または置換若しくは無置換の5~6員環のヘテロシクリル基を示し、 $R^{h1}$ 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。

$R^{g1}$ または $R^{h1}$ における置換基の具体例は、 $R^{a1}$ において例示したものと同一ものを挙げることができる。

ここで、 $R^{g1}$ と $R^{h1}$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよい。

形成できる二価の有機基としては、置換若しくは無置換のC2~5アルキレン基または置換若しくは無置換のC1~3アルキレンオキシC1~3アルキレン基を挙げることができる。

「C2~5アルキレン基」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を挙げることができる。

「C1~3アルキレンオキシC1~3アルキレン基」としては、ジメチレ

ンオキシジメチレン基などを挙げるができる。

「C<sub>2</sub>~5アルキレン基」または「C<sub>1</sub>~3アルキレンオキシC<sub>1</sub>~3アルキレン基」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；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-ブチル基などのC<sub>1</sub>~6アルキル基；またはクロロメチル基、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-ブチル基などのC<sub>1</sub>~6ハロアルキル基が好ましい。

「R<sup>g1</sup>R<sup>h1</sup>C=N-O-で表される基」の具体例としては、(プロパン-2-イリデンアミノ)オキシ基などを挙げるができる。

[0168] Gaにおける「R<sup>a1</sup>-N=で表される二価の基」中、R<sup>a1</sup>は上記の「R<sup>a1</sup>-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>a1</sup>-N=で表される二価の基」の具体例としては、イミノ基(HN=)、メチルイミノ基などを挙げるができる。

[0169] Gaにおける「R<sup>a1</sup>O-N=で表される二価の基」中、R<sup>a1</sup>は上記の「R<sup>a1</sup>-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

「R<sup>a1</sup>O-N=で表される二価の基」の具体例としては、N-ヒドロキシイミノ基、N-メトキシイミノ基などを挙げるができる。

[0170] Gaにおける「R<sup>c1</sup>R<sup>d1</sup>N-N=で表される二価の基」中、R<sup>c1</sup>およびR<sup>d1</sup>は上記の「R<sup>c1</sup>R<sup>d1</sup>N-で表される基」におけるそれらと同様の意味を示す。

「R<sup>c1</sup>R<sup>d1</sup>N-N=で表される二価の基」の具体例としては、2, 2-ジメチルヒドラジニリデン基などを挙げるができる。

[0171] Gaにおける「R<sup>a1</sup>-CO-NR<sup>e1</sup>-N=で表される二価の基」中、R<sup>a1</sup>は上記の「R<sup>a1</sup>-CO-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

R<sup>e1</sup>は上記の「R<sup>a1</sup>-CO-NR<sup>e1</sup>-で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

[0172] Gaにおける「R<sup>b1</sup>-O-CO-NR<sup>e1</sup>-N=で表される二価の基」中、

$R^{b1}$ は上記の「 $R^{b1}-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^{e1}$ は上記の「 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

[0173]  $G_a$ における「 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-N=$ で表される二価の基」中、 $R^{b1}$ は上記の「 $R^{b1}-O-CO-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。 $R^{e1}$ は上記の「 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ で表される基」におけるそれと同様の意味を示す。

[0174] 置換基 ( $G_a$ ) が2以上ある場合に、そのうちの2つが一緒になって形成できる二価の有機基としては、置換若しくは無置換のC1~5アルキレン基、置換若しくは無置換のオキシC1~4アルキレン基、置換若しくは無置換のオキシC2~3アルキレンオキシ基、または置換若しくは無置換のC1~3アルキレンオキシC1~3アルキレン基を挙げることができる。

「C1~5アルキレン基」としては、メチレン基、ジメチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基などを挙げることができる。

「オキシC1~4アルキレン基」としては、オキシメチレン基、オキシジメチレン基などを挙げることができる。

「オキシC2~3アルキレンオキシ基」としては、オキシジメチレンオキシ基などを挙げることができる。

「C1~3アルキレンオキシC1~3アルキレン基」としては、ジメチレンオキシジメチレン基などを挙げることができる。

「C1~5アルキレン基」、「オキシC1~4アルキレン基」、「オキシC2~3アルキレンオキシ基」、「C1~3アルキレンオキシC1~3アルキレン基」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ン基；メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*s*-ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基などのC1~6アルキル基；またはクロロメチル基、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*-ブチル基などのC1~6ハロアルキル基が好ましい。

[0175] 本発明において、好ましいG aとしては、水酸基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリーールオキシ基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリルオキシ基、 $R^{a1}-CO-O-$ で表される基、オキソ基(O=)、または $R^{a1}O-N=$ で表される二価の基を挙げることができる。

この場合、好ましい置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリルオキシ基としては、テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル基を挙げることができる。

[0176] 本発明において、さらに好ましいG aとしては、水酸基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、 $R^{a1}-CO-O-$ で表される基、オキソ基(O=)、または $R^{a1}O-N=$ で表される二価の基を挙げることができる。

[0177] [B]

Bは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、または $-NR^{N3}-$ で表される基を示し、 $R^{N3}$ は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、ホルミル基、または置換若しくは無置換のC 1～6アルキルカルボニル基を示す。

[0178]  $R^{N3}$ における「C 1～6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。 $R^{N3}$ における「C 1～6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。

$R^{N3}$ における「C 1～6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、ブチリル基、*i*-プロピルカルボニル基などを挙げること



ができる。

[0179]  $R^{N3}$ における「C 1～6アルキル基」、および「C 1～6アルキルカルボニル」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C 1～6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C 1～6ハロアルコキシ基；(エチリデンアミノ)オキシ基、プロパン-2-イリデンアミノ)オキシ基などの(C 1～6アルキリデンアミノ)オキシ基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3～6シクロアルキル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリール基；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5員環のヘテロアリール基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール基；またはシアノ基が好ましい。

[0180]  $[R^7]$

$R^7$ は、水素原子、または置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基を示す

。

R<sup>7</sup>における「C 1～6 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。R<sup>7</sup>における「C 1～6 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。

R<sup>7</sup>における「C 1～6 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C 1～6 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C 1～6 ハロアルコキシ基；(エチリデンアミノ) オキシ基、プロパン-2-イリデンアミノ) オキシ基などの(C 1～6 アルキリデンアミノ) オキシ基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3～6 シクロアルキル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10 アリール基；4-メチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、またはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10 アリール基；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5員環のヘテロアリール基；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、またはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基

などの6員環のヘテロアリアル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリアル基；またはシアノ基が好ましい。

[0181] [Q]

Qは、置換若しくは無置換のC 6～10アリアル基、または置換若しくは無置換の5～10員環のヘテロシクリル基を示す。

[0182] Qにおける「C 6～10アリアル基」としては、フェニル基、ナフチル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げることができる。

[0183] Qにおける「5～10員環のヘテロシクリル基」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。単環および多環のいずれでもよい。

「5～10員環のヘテロシクリル基」としては、5～6員環の飽和ヘテロシクリル基、5～10員環のヘテロアリアル基、5～10員環の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。

[0184] 5～6員環の飽和ヘテロシクリル基としては、ピロリジニル基、テトラヒドロフランニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロ-2H-ピラニル基、ペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げることができる。

5～10員環のヘテロアリアル基としては、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の5員環のヘテロアリアル基；ピリジニル基、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の6員環のヘテロアリアル基；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などの9員ヘテロアリアル基；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の10員ヘテロアリアル基；を挙げることができる。

5～10員環の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、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などの5員環の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員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；インドリニル基、イソインドリニル基、2,3-ジヒドロベンゾフラニル基、1,3-ジヒドロベンゾフラニル基などの9員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル基などの10員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；を挙げることができる。

[0185] Qにおける「C6～10アリアル基」または「5～10員環のヘテロシクリル基」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；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；ビニル基などのC2～6アルケニル基；エチニル基などのC2～6アルキニル基；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*-ブチル基などのC1～6ハロアルキル基；メトキシメチル基などのC1～6アルコキシC1～6アルキル基；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；ヒドロキシエトキシ基などのヒドロキシC1～6アルコキシ基；メトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基などのC1～6アルコキシアルコキシ基；トリメチルシリルオキシエトキシ基、*t*-ブチルジメチルシリルオキシ

エトキシ基などのトリC 1～6アルキル置換シリルオキシC 1～6アルコキシ基；2-クロロ-n-プロポキシ基、2, 3-ジクロロプロトキシ基、トリフルオロメトキシ基などのC 1～6ハロアルコキシ基；C 3～6シクロアルキルC 1～6アルコキシ基；C 6～10アリアルC 1～6アルコキシ基；（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10アリアル）C 1～6アルコキシ基；5員環のヘテロアリアルC 1～6アルコキシ基；（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリアル）C 1～6アルコキシ基；6員環のヘテロアリアルC 1～6アルコキシ基；（C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、またはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリアル）C 1～6アルコキシ基；メチルチオ基、エチルチオ基などのC 1～6アルキルチオ基；メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基などのC 1～6アルキルスルフィニル基；メチルスルホニル基、エチルスルホニル基などのC 1～6アルキルスルホニル基；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C 1～6ハロアルキルチオ基；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C 1～6ハロアルキルスルフィニル基；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C 1～6ハロアルキルスルホニル基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基などのC 3～6シクロアルキル基；C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6ハロアルコキシ基、またはシアノ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 3～6シクロアルキル基；シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基などのC 3～6シクロアルケニル基；フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリアル基；4-メチルフェニル基、4-メトキ

シフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基などの、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、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC6~10アリール基；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の3~4員環の飽和ヘテロシクリル基；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、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された3~4員環の飽和ヘテロシクリル基；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、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、ジオキサニル基、ジオキサニル基などの5~6員環の飽和ヘテロシクリル基；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、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5~6員環の飽和ヘテロシクリル基；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5員環のヘテロアリール基；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、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5員環のヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；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、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環のヘテロアリール基；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などの5員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；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、またはC1~6ハロアルコキシ基のいずれ

か1以上の置換基で置換された5員環の部分飽和ヘテロシクリル基；ジヒドロピラニル基などの6員環の部分不飽和ヘテロシクリル基；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、またはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された6員環の部分飽和ヘテロシクリル基；

$R^{Q1}-CO-$ で表される基（式中、 $R^{Q1}$ は、水素原子；C1～6アルキル基；ハロゲノ基、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、若しくは5～6員環のヘテロアリアル基のいずれか1以上の置換基で置換されたC1～6アルキル基；（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以上の置換基で置換されたC6～10アリアル）C1～6アルキル基；（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以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリアル）C1～6アルキル基；C2～6アルケニル基；C2～6ハロアルケニル基；C2～6アルキニル基；C2～6ハロアルキニル基；C3～6シクロアルキル基；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、C1～6ハロアルコキシ基、若しくはシアノ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC3～6シクロアルキル基；C6～10アリアル基；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以上の置換基で置換されたC6～10アリアル基；5～6員環のヘテロアリアル基；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以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリアル基；を示す。以下の $R^{Q1}$ においても同じ。）；

カルボキシ基；

$R^{Q2}-O-CO-$ で表される基（式中、 $R^{Q2}$ は、C1～6アルキル基；ハロ

ゲノ基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 3～6 シクロアルキル基、フェニル基、若しくは5～6員環のヘテロアリアル基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 1～6 アルキル基；（C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10 アリアル）C 1～6 アルキル基；（C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリアル）C 1～6 アルキル基；C 2～6 アルケニル基；C 2～6 ハロアルケニル基；C 2～6 アルキニル基；C 2～6 ハロアルキニル基；C 3～6 シクロアルキル基；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 ハロアルコキシ基、若しくはシアノ基で置換されたC 3～6 シクロアルキル基；C 6～10 アリアル基；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換されたC 6～10 アリアル基；5～6員環のヘテロアリアル基；または；C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリアル基；を示す。以下のR<sup>Q2</sup>においても同じ。）；  
R<sup>Q1</sup>R<sup>Q1</sup>N-で表される基（式中のR<sup>Q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>Q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；  
R<sup>Q1</sup>R<sup>Q1</sup>N-CO-で表される基（式中のR<sup>Q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>Q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；  
R<sup>Q1</sup>-CO-O-で表される基；R<sup>Q1</sup>-CO-NR<sup>Q3</sup>-で表される基（式中、R<sup>Q3</sup>は、水素原子；C 1～6 アルキル基；ハロゲノ基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 3～6 シクロアルキル基、フェニル基



、若しくは5～6員環のヘテロアリアル基のいずれか1以上の置換基で置換されたC1～6アルキル基；（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以上の置換基で置換されたC6～10アリアル）C1～6アルキル基；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以上の置換基で置換された5～6員環のヘテロアリアル）C1～6アルキル基；を示す。以下のR<sup>Q3</sup>においても同じ。）；

R<sup>Q2</sup>-O-CO-O-で表される基；R<sup>Q2</sup>-O-CO-NR<sup>Q3</sup>-で表される基；R<sup>Q1</sup>R<sup>Q1</sup>N-CO-O-で表される基（式中のR<sup>Q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>Q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>Q1</sup>R<sup>Q1</sup>N-CO-NR<sup>Q3</sup>-で表される基（式中のR<sup>Q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>Q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；R<sup>Q2</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>Q3</sup>-で表される基；R<sup>Q1</sup>R<sup>Q1</sup>N-SO<sub>2</sub>-で表される基（式中のR<sup>Q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>Q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

R<sup>Q1</sup>-O-N=C(R<sup>Q4</sup>)-で表される基（式中、R<sup>Q4</sup>は、水素原子またはC1～6アルキル基を示す。）；(R<sup>Q1</sup>)<sub>2</sub>C=N-O-で表される基（式中のR<sup>Q1</sup>は同一でも異なってもよい。R<sup>Q1</sup>同士は一緒になって、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペンタメチレン基、またはジメチレンオキシジメチレン基を形成してもよい。）；

ペンタフルオロスルファニル基、トリメチルシリルエチニル基、ニトロ基、またはシアノ基が好ましい。

さらに、「5～10員環のヘテロシクリル基」上の置換基としては、オキ

ソ基も好ましい。

[0186] 〔塩〕

化合物（１）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。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；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；アンモニウム塩などを挙げることができる。

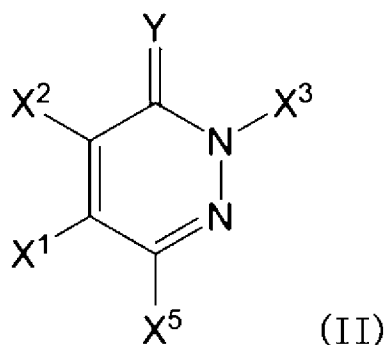
[0187] 〔製造方法〕

化合物（１）または化合物（１）の塩の製造方法は、限定されない。例えば、本発明の化合物（１）または化合物（１）の塩は、実施例などに記載したような公知の手法によって得ることができる。また、化合物（１）の塩は、化合物（１）から公知の手法によって得ることができる。

[0188] 〔製造中間体〕

本発明のピリダジノン化合物を調製する上で、下記の式（II）で表される化合物またはその塩が、製造中間体となりうる。

[0189] [化5]



[0190] 式（II）中、

Yは、酸素原子または硫黄原子を示し；

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置

換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルホニル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、 $R^1-CO-$ で表される基、カルボキシ基、 $R^2-O-CO-$ で表される基、 $R^3R^4N-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-$ で表される基、 $R^1-CO-O-$ で表される基、 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2-O-CO-O-$ で表される基、 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基、 $R^1O-N=CR^6-$ で表される基、 $R^3R^4N-N=CR^6-$ で表される基、または $R^1-N=CR^6-$ で表される基を示し；

$R^1$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^2$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

R<sup>3</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6 アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6 アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6 シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

R<sup>4</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基を示し、

ここで、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

R<sup>5</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基を示し、

R<sup>6</sup>は、ハロゲノ基、アミノ基、置換若しくは無置換のモノC 1～6 アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のジC 1～6 アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6 アルキルチオ基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し；

X<sup>3</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6 アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6 アルキニル基、R<sup>1</sup>-CO-で表される基、置換若しくは無置換のC 3～6 シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10 アリール基、置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基、R<sup>N1</sup>O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>N-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>N2</sup>-で表される基、またはR<sup>N1</sup>-C(=NR<sup>N1</sup>)-NR<sup>N2</sup>-で表される基

を示し、

$R^{N1}$ 、および  $R^{N2}$  は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖 C 1～6 アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖 C 2～6 アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖 C 2～6 アルキニル基、置換若しくは無置換の C 3～6 シクロアルキル基、置換若しくは無置換の C 6～10 アリール基、または置換若しくは無置換の 4～6 員環のヘテロシクリル基を示し、ここで、 $R^{N1}$  と  $R^{N1}$ 、または  $R^{N1}$  と  $R^{N2}$  は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく；

$X^5$  は、 $HO-A-$  で表される基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、またはハロゲノ基を示し、

A は、置換若しくは無置換の C 1～6 アルキレン基、置換若しくは無置換の C 2～6 アルケニレン基、置換若しくは無置換の C 2～6 アルキニレン基、置換若しくは無置換の C 3～6 シクロアルキレン基、またはカルボニル基を示す。

[0191] 式 (II) 中の、それぞれの記号は、式 (I) 中のそれらと同様の意味を示す。

$X^5$  における「C 1～6 アルコキシカルボニル基」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ができる。

$X^5$  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ができる。

式 (II) の化合物としては、 $X^2$  が、 $R^1O-N=CR^6-$  で表される基である化合物またはそれらの塩であることが好ましい。

[0192] [製造中間体の塩及び製造方法]

式 (II) で表される製造中間体の塩は、式 (I) で表される化合物の塩と同様のものを例示することができる。

また、式 (II) で表される製造中間体の製造方法は、限定されない。例えば

、実施例などに記載したような公知の手法によって得ることができる。また、製造中間体の塩は、化合物 (II) から公知の手法によって得ることができる。

[0193] [農園芸用殺菌剤]

本発明の農園芸用殺菌剤は、化合物 (I) およびその塩から選ばれる少なくともひとつを有効成分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化合物 (I) またはその塩の量は、殺菌効果を示す限りにおいて特に制限されない。

[0194] 本発明の農園芸用殺菌剤は、広範囲の種類の子実菌、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。

[0195] 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*

s 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 natrassii*)、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 allii*)、灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、白斑葉枯病 (*Botrytis squamosa*)、べと病 (*Peronospora destructor*)、白色疫病 (*Phytophthora porri*)、小菌核病 (*Ciborinia allii*)、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 allii*)、白絹病 (*Sclerotium rolfsii*) など

ネギ：軟腐病 (*Pectobacterium carotovorum*)、べと病 (*Peronospora destructor*)、葉枯病 (*Pleospora allii*)、黒腐菌核病 (*Sclerotium cepivoru*

m)、さび病 (*Puccinia allii*)、白斑葉枯病 (*Botrytis squamosa*)、白絹病 (*Sclerotium rolfsii*)、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 campestris* 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 cichorii*、*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 orontii*) 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 (*Phaeoisariopsis 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

[0196] 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 pomii*)、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 neca*



trix)、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 gloeosporioides*) 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 tri-dactyla*) 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* p.v. *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

[0197] 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 (*Pseudocercospora herpotrich*

oides)、葉枯病 (*Septoria tritici*)、心枯病 (*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 (*Pythiumgraminicola*)、白葉枯病 (*Xanthomonas oryzae*)、苗立枯細菌病 (*Burkholderia plantarii*)、褐条病 (*Acidovorax avenae*)、もみ枯細菌病 (*Burkholderia glumae*)、すじ葉枯病 (*Cercospora oryzae*)、稲こうじ病 (*Ustilaginoidea virens*)、褐色米 (*Alternaria alternata*、*Curvularia intermedia*)、腹黒米 (*Alternaria padwickii*)、紅変米 (*Epicoecum 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 parasitica*) 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 gossypii*)、白か

び病 (*Mycosphaerella areola*)、炭疽病 (*Glomerella gossypii*) 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

[0198] [殺線虫剤]

本発明のピリダジノン化合物は、植物の生育に影響する各種の線虫類の防除効果にも優れている。

本発明の殺線虫剤は、化合物(1)およびその塩から選ばれる少なくともひとつを有効成分として含有するものである。本発明の殺線虫剤に含まれる化合物(1)またはその塩の量は、線虫の防除効果を示す限りにおいて特に制限されない。

[0199] 本発明の殺線虫剤によって防除可能な各種の植物寄生性線虫類の具体例を以下に示す。(1) クキセンチュウ目 (*Tylenchida*)

(a) アングイナ科 (*Anguinidae*) の、例えば、アングイナ属種 (*Anguina* sp. p.) の、アングイナ・フネスタ (*Anguina funesta*)、コムギツブセンチュウ (*Anguina tritici*) ; ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.) の、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*)、キノコセンチュウ (*Ditylenchus myceliophagus*) ;

(b) アフェレンコイデス科 (*Aphelenchoididae*) の、例えば、アフェレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.) の、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、イチゴセンチュウ (*Aphelenchoides fragariae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*) ; ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.) の、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) ;

(c) ベロノライムス科 (*Belonolaimidae*) の、例えば、ベロノライムス属種 (*Belonolaimus* spp.) の、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) ; チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.) の、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・ズビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) ;

(d) クリコネマ科 (Criconematidae) の、例えば、クリコネマ・ムタビル (*Criconema mutabile*);

(e) ドリコドルス科 (Dolichodoridae) の、例えば、ドリコドルス・メディテラネウス (*Dolichodorus mediterraneus*) ;

(f) エクファドフォラ科 (Ecphyadophoridae) の、例えば、エクファドフォラ・テヌイシマ (*Ecphyadophora tenuissima*)

(g) ヘミシクリオフォラ科 (Hemicycliophoridae) の、例えば、ローフィア・チエネマニ (*Loofia thienemanni*) ;

(h) ヘテロデラ科 (Heteroderidae) の、例えば、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.) の、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ジャガイモシロシストセンチュウ (*Globodera pallida*)、タバコシストセンチュウ (*Globodera tabacum*) ; ヘテロデア属種 (*Heterodera* spp.) の、ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデア・フルシフェラ (*Heterodera cruciferae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*) ;

(i) ホプロライムス科 (Hoplolaimidae) の、例えば、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.) の、ナミラセンセンチュウ (*Helicotylenchus dihystra*)、ヘリコチレンクス・マルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*) ; ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus* spp.) の、ホプロライムス・コロンプス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*) ; その他の、ロチレンカス・ロブスタス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*) ;

(j) メロイドギネ科 (Meloidogynidae) の、例えば、メロイドギネ属種の (*Meloidogynespp.*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*)、コロンビアネコブセンチュウ (*Meloidogyne chitwoodi*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、テムズネ

コブセンチュウ (*Meloidogyne thamesi*) ;

(k) ノスティレンクス科 (*Nothotylenchidae*) の、例えば、イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*) ;

(l) パラティレンクス科 (*Paratylenchidae*) の、例えば、パラティレンクス属種 (*Paratylenchus spp.*) の、チャピンセンチュウ (*Paratylenchus curvatus*)、ヒメピンセンチュウ (*Paratylenchus elachistus*) ;

(m) プラティレンクス科 (*Pratylenchidae*) の、例えば、プラティレンクス属 (*Pratylenchus spp.*) 種の、プラティレンクスネグサレセンチュウ (*Pratylenchus brachyurus*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ピンセンチュウ (*Pratylenchus curvatus*)、キクネグサレセンチュウ (*Pratylenchus fallax*)、プラティレンクス・ゴードイ (*Pratylenchus goodeyi*)、プラティレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、プラティレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、クルミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus vulnus*)、モロコシネグサレセンチュウ (*Pratylenchus zae*) ; その他の、ニセネコブセンチュウ (*Nacobbus aberrans*)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、カンキツネモグリセンチュウ (*Radopholus citrophilus*)。

[0200] (2) ドリライムス目 (*Dorylaimida*)

(a) ロンギドルス科 (*Longidoridae*) の、例えば、ロンギドルス属種 (*Longidorus spp.*) の、ロンギドルス・エロンガテス (*Longidorus elongates*) ; キシフィネマ属種 (*Xiphinema*) の、アメリカオオハリセンチュウ (*Xiphinema americanum*)、キシフィネマ・ブレビコーレ (*Xiphinema brevicolle*)、ブドウオオハリセンチュウ (*Xiphinema index*)、キシフィネマ・ディバーシカウダツム (*Xiphinema diversicaudatum*)。

[0201] (3) トリプロンキダ目 (*Triplonchida*)

(a) トリコドルス科 (*Trichodoridae*) の、例えば、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、ヒメユミハリセンチュウ (*Paratrachod*



orus minor)。

[0202] 〔施用方法・混合剤〕

本発明の農園芸用殺菌剤または殺線虫剤は、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。

[0203] 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。殺線虫剤は、根、塊茎、塊根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。

[0204] 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。殺線虫剤は、種子処理、土壌施用などに使用することができる。

[0205] 本発明の農園芸用殺菌剤または殺線虫剤は、本発明のピリダジノン化合物以外の成分を含有してもよい。他の成分として、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、動物用飼料などを挙げることができる。このような他の成分を含有することによって、相乗効果を奏することがある。

すなわち、本発明の態様のひとつとしては、1つ以上のさらなる殺菌剤を含む農園芸用殺菌剤を挙げることができる。

[0206] 本発明の農園芸用殺菌剤または殺線虫剤と混用または併用することができる殺菌剤として、FRAC (Fungicide Resistance Action Committee) のHP (<https://www.frac.info/>) に記載される化合物、または農業上許容されるそれらの塩若しくは誘導体等を好ましいものとして挙げることができる。

具体的には以下の群から選択される化合物を例示することができる。

[0207] 殺菌剤：

[0208] (A) 核酸合成代謝に作用する剤：

A 1) RNAポリメラーゼI阻害剤

ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルM (benalaxyl-M)、フララキシル (furalaxyl)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルM (metalaxyl-M)、オキサジキシル (oxadixyl)、オフラセ (ofurace)。

A 2) アデノシンデアミナーゼ阻害剤

ブピリメート (bupirimate)、ジメチリモール (dimethirimol)、エチリモール (ethirimol)。

A 3) DNA/RNA生合成阻害剤

ヒメキサゾール (hymexazole)、オクチリノン (octhilinone)。

A 4) DNAトポイソメラーゼタイプII阻害剤

オキサリニック酸 (oxolinic acid)。

[0209] (B) 細胞骨格とモーター蛋白質に作用する剤：

B 1) ~ B 3)  $\beta$ -チューブリン重合阻害剤

ベノミル (benomyl)、カルベンダジム (carbendazim)、フベリダゾール (fuberidazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオファネート (thiophanate)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ゾキサミド (zoxamide)、エタボキサム (ethaboxam)、クロルフェナゾール (chlorfenazole)、デバカルブ (debacarb)、トリクラミド (trichlamide)、ザリラミド (zarilamid)。

B 4) 細胞分裂(作用点不明)阻害剤

ペンシクロン (pencycuron)。

B 5) スペクトリン様蛋白質の非局在化阻害剤

フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピモミド (fluopimomide)。

B 6) アクチン/ミオシン/フィンブリン機能阻害剤

フェナマクリル (phenamacril)、メトラフェノン (metrafenone)、ピリオフェノン (pyriofenone)。

[0210] (C) 呼吸に作用する剤：

C 1) 複合体 I : NADH酸化還元酵素阻害剤

ジフルメトリム (diflumetorim)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、フェナザキン (fenazaquin)。

C 2) 複合体 II : コハク酸脱水素酵素阻害剤

ベノダニル (benodanil)、フルトラニル (flutolanil)、メプロニル (mepronil)、イソフェタミド (isofetamid)、フルオピラム (fluopyram)、シクロブトリフルラム (cyclobutrifluram)、フェンフラム (fenfuram)、カルボキシシン (carboxin)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、チフルザミド (thifluzamide)、ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr)、ビキサフェン (bixafen)、フルインダピル (fluindapyr)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フラメトピル (furametpyr)、インピルフルキサム (inpyrfluxam)、イソピラザム (isopyrazam)、ペンフルフェン (penflufen)、ペンチオピラド (penthiopyrad)、セダキサン (sedaxane)、イソフルシプラム (isoflucypram)、ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)、ボスカリド (boscalid)、ピラジフルミド (pyraziflumid)、フルベネテラム (Flubeneteram)、フルメシクロックス (furmecyclox)。

C 3) 複合体 III : チトクローム bc1 (ユビキノール酸化酵素) Q<sub>o</sub>部位 (cyt b遺伝子) 阻害剤

アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クモキシストロビン (coumoxystrobin)、エノキサストロビン (enoxastrobin)、フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、マンデストロビン (mandestrobin)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、トリクロピリカルブ (tricyclopyricarb)、クレスキシムメチル (kresoxim-methyl)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、フェナミンストロビン (fenaminstrobin)、メトミノストロビン (metominostrobin)、オリサストロビン (orysastrobin)、ファモ

キサドン (famoxadone)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、フェン  
アミドン (fenamidone)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、メチルテトラプ  
ロール (metyltetraprole)。

C 4) 複合体III: チトクローム bc1 (ユビキノン還元酵素) Qi部位阻害剤  
シアゾファミド (cyazofamid)、アミスルブロム (amisulbrom)、フェンピ  
コキサミド (fenicoxamid)、フロリルピコキサミド (florylpicoxamid)、  
メタリルピコキサミド (metarylpicoxamid)。

C 5) 酸化的リン酸化の脱共役阻害剤

ビナパクリル (binapacryl)、ジノカップ (dinocap)、メプチルジノカップ  
(meptyldinocap)、フルアジナム (fluazinam)。

C 6) 酸化的リン酸化、ATP合成酵素の阻害剤

酢酸トリフェニルスズ (fentin acetate)、塩化トリフェニルスズ (fentin  
chloride)、水酸化トリフェニルスズ (fentin hydroxide)。

C 7) ATP輸送阻害剤

シルチオフアム (silthiofam)。

C 8) 複合体III: チトクローム bc1 (ユビキノン還元酵素) Qo部位、スチグ  
マテリン結合サブサイト 阻害剤

アメトクトラジン (ametoctradin)。

[0211] (D) アミノ酸および蛋白質合成に作用する剤:

D 1) メチオニン生合成(cgs遺伝子)阻害剤

シプロジニル (cyprodinil)、メパニピリム (mepanipyrim)、ピリメタニル  
(pyrimethanil)。

D 2) 蛋白質合成 (リボソーム 翻訳終了段階) 阻害剤

ブラストサイジンS (blasticidin-S)。

D 3)、D 4) 蛋白質合成 (リボソーム 翻訳開始段階) 阻害剤

カスガマイシン (kasugamycin)、カスガマイシン塩酸塩 (kasugamycin hydr  
ochloride)、ストレプトマイシン (streptomycin)。

D 5) 蛋白質合成 (リボソーム ポリペプチド伸長段階) 阻害剤

オキシテトラサイクリン (oxytetracycline) 。

[0212] (E) シグナル伝達に作用する剤：

E 1) シグナル伝達 (作用機構不明) 阻害剤

キノキシフェン (quinoxifen)、プロキナジド (proquinazid) 。

E 2) 浸透圧シグナル伝達におけるMAP/ヒスチジンキナーゼ (os-2、HOG1) 阻害剤

フェンピクロニル (fenpiclonil)、フルジオキシソニル (fludioxonil) 。

E 3) 浸透圧シグナル伝達におけるMAP/ヒスチジンキナーゼ (os-1、Daf1) 阻害剤

クロゾリネート (chlozolate)、ジメタクロン (dimethachlone)、イプロジオン (iprodone)、プロシミドン (procymidone)、ビクロゾリン (vinclozolin) 。

[0213] (F) 脂質生合成または輸送/細胞膜の構造または機能に作用する剤：

F 1) ジカルボキシイミド系殺菌剤

F 2) 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 (edifenphos)、イプロベンホス (iprobenfos)、ピラゾホス (pyrazophos)、イソプロチオラン (isoprothiolane) 。

F 3) 細胞の過酸化阻害剤

ビフェニル (biphenyl)、クロロネブ (chloroneb)、ジクロラン (dicloran)、キントゼン (quintozene)、テクナゼン (tecnazene)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、エトリジアゾール (etridiazole) 。

F 4) 細胞膜透過性、脂肪酸阻害剤

ヨードカルブ (iodocarb)、プロパモカルブ (propamocarb)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、プロチオカルブ (prothiocarb) 。

F 5) カルボン酸アミド系 (CAA) 殺菌剤

F 8) エルゴステロール結合阻害剤

ナタマイシン (natamycin) ；

F 9) 脂質恒常性および輸送／貯蔵阻害剤

オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin)、フルオキサピプロリン (fluoxapiprolin)。

[0214] (G) 細胞膜のステロール生合成阻害剤

G 1) ステロール生合成のC14位のデメチラーゼ (erg11/cyp51) 阻害剤

トリホリン (triforine)、ピリフェノックス (pyrifenoX)、ピリソキサゾール (pyrisoxazole)、フェナリモル (fenarimol)、ヌアリモール (nuarimol)、イマザリル (imazalil)、オキスポコナゾール (oxpoconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、プロクロラズ (prochloraz)、トリフルミゾール (triflumizole)、アザコナゾール (azaconazole)、ビテルタノール (bitertanol)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、シプロコナゾール (ciproconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、フェンブコナゾール (enbuconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルトリアホル (flutriafol)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イプコナゾール (ipconazole)、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole)、メトコナゾール (metconazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ペンコナゾール (penconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、シメコナゾール (simeconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリチコナゾール (triticonazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、フルオキシチオコナゾール (Fluoxytioconazole)、フルコナゾール (furconazole)、フルコナゾールーシス (furconazole-cis)、ジニコナゾールM (diniconazole-M)。

G 2) ステロール生合成における $\Delta 14$ 還元酵素及び $\Delta 8 \rightarrow \Delta 7$ -イソメラーゼ (erg24、erg2) 阻害剤

アルジモルフ (aldimorph)、ドデモルフ (dodemorph)、ドデモルフ酢酸塩 (dodemorph acetate)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、トリデモルフ (tridemorph)、フェンプロピジン (fenpropidin)、ピペラリン (piperalin)、スピロキサミン (spiroxamine)、ブチオベート (buthiobate)。

G 3) 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 (erg27) 阻害剤

フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)。

G 4) ステロール生合成系のスクワレンエポキシダーゼ (erg1) 阻害剤  
ピリブチカルブ (pyributicarb)、ナフチフィン (naftifine)、テルビナフィン (terbinafine)。

[0215] (H) 細胞壁生合成阻害剤：

H 4) キチン合成酵素阻害剤

ポリオキシシン (polyoxin)、ポリオクソリム (polyoxorim)。

H 5) セルロース合成酵素阻害剤

ジメトモルフ (dimethomorph)、フルモルフ (flumorph)、ピリモルフ (pyrimorph)、ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、バリフェナレート (valifenalate)、マンジプロパミド (mandipropamid)。

[0216] (I) 細胞壁のメラニン合成阻害剤：

I 1) メラニン生合成の還元酵素阻害剤

フサライド (fthalide)、ピロキロン (pyroquilon)、トリシクラゾール (tricyclazole)。

I 2) メラニン生合成の脱水酵素阻害剤

カルプロパミド (carpropamid)、ジクロシメット (diclocymet)、フェノキサニル (fenoxanil)。

I 3) メラニン生合成のポリケタイド合成酵素阻害剤

トルプロカルブ (tolprocarb)。

[0217] (P) 宿主植物の抵抗性誘導に作用する剤：

P01～P03) サリチル酸シグナル伝達に関連する剤  
アシベンゾラルSメチル (acibenzolar-S-methyl)、プロベナゾール (probenazole)、チアジニル (tiadinil)、イソチアニル (isotianil)。

P04) 多糖類エリシター  
ラミナリン (laminarin)。

P05) アントラキノンエリシター  
オオイタドリ抽出液 (extract from *Reynoutria sachalinensis*)。

P06) 微生物エリシター  
バチルス・マイコイデス分離株J (*Bacillus mycoides* isolate J)、サッカロミセス・セレビシア LAS117 株の細胞壁 (cell walls of *Saccharomyces cerevisiae* strain LAS117)。

P07) ホスホナート  
ホセチル (fosetyl-Al)、亜リン酸および亜リン酸カルシウム (Calcium phosphite)、亜リン酸アルミニウム (Aluminum phosphite)、亜リン酸ナトリウム (Sodium Phosphite、Disodium phosphonate) 等の塩 (phosphorous acid and salts)。

P08) サリチル酸シグナル伝達に関連する剤  
ジクロベンチアゾクス (dichlobentiazox)。

[0218] (U) 作用機構不明の剤：

シモキサニル (cymoxanil)、テクロフタラム (teclofthalam)、トリアゾキシド (triazoxide)、フルスルファミド (flusulfamide)、ジクロメジン (diclomezine)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、ドジン (dodine)、ドジン遊離塩基 (dodine free base)、フルチアニル (flutianil)、フェリムゾン (ferimzone)、テブフロキン (tebufloquin)、ピカルブトラゾクス (picarbutrazox)、バリダマイシン (validamycin)、ベトキサジン (bethoxazin)、シプロフラム (cyprofuram)、フルメトベル (flumetover)、ニトータルイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、プロパミジン (propamidine)、イプフルフェノキン (ipflufenquin)、ピリダクロメチル (pyridach



lometyl)、ピラプロポイン (pyrapropoyne)、アミノピリフェン (aminopyrifin)、イプフェントリフルコナゾール (ipfentrifluconazole)、キノフメリン (quinofumelin)、ジピメチトロン (dipymetitron)、クロインコナジド (chloroinconazide)、セボクチルアミン (seboctylamine)、フルメチルスルホリム (Flumetylsulforim)、フルフェノキサジアザム (Flufenoxadiazam)。

[0219] (M) 多作用点接触活性を有する剤：

銅 (種々の塩) (copper(different salts))、塩基性硫酸銅 (basic copper sulfate)、ボルドー液 (Bordeaux mixture)、水酸化銅 (copper hydroxide)、銅ナフタレート (copper naphthenate)、オキシ塩化銅 (copper oxychloride)、硫酸銅 (copper sulfate)、酸化銅 (cuprous oxide)、オキシ銅 (oxine-copper)、硫黄 (sulphur)、石灰硫黄合剤 (Lime sulfur)、アンバム (amobam)、ファーバム (ferbam)、マンゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チウラム (thiram)、チアゾール亜鉛 (zinc thiazole)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)、キャプタン (captan)、カプタホール (captafol)、ホルペット (folpet)、クロロタロニル (chlorothalonil)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、トリルフルアニド (tolylfluanid) ; グアザチン (guazatine)、グアザチン酢酸塩 (guazatine acetates)、イミノクタジン (iminocadine)、イミノクタジン酢酸塩 (iminocadine triacetate)、イミノクタジンアルベシル酸塩 (iminocadine trialbesilate)、アニラジン (anilazine)、ジチアノン (dithianon)、キノメチオナート (chinomethionat/quinomethionate)、フルオルイミド (fluoroimide)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、ダゾメット (dazomet)、クフラネブ (cufraneb)、マンカッパー (mancopper)、ポリカーバメート (polycarbamate)。

[0220] (BM) 複数の作用機構を有する生物農薬/生物由来の農薬：

a) 植物抽出物

ポリペプチド (レクチン) (Polypeptide(lectin))、フェノール化合物 (Ph

enols)、セスキテルペン化合物 (Sesquiterpenes)、トリテルペノイド化合物 (Triterpenoids)、クマリン化合物 (Coumarins)、テルペン系炭化水素化合物 (Terpene Hydrocarbons)、テルペンアルコール化合物 (Terpene alcohols)、テルペンフェノール化合物 (Terpene phenols)、ハウチワマメ苗木の子葉からの抽出物 (extract from the cotyledons of lupine plantlets)、Swinglea glutinosa からの抽出物 (extract from Swinglea glutinosa)、ゴセイカユプテ (ティーツリー) の抽出物 (extract from Melaleuca alternifolia (tea tree oil))、植物油類 (混合物) (plant oils (mixtures))、オイゲノール (eugenol)、ゲラニオール (geraniol)、チモール (thymol)、 $\alpha$ -ピネン (Alpha-pinene)、 $\alpha$ -テルピネン (Alpha-terpinene)、 $\alpha$ -テルピネオール (Alpha-terpinol)、 $\alpha$ -テルピノレン (Alpha-terpinoline)、 $\gamma$ -テルピネン (Gamma-terpinene)、d-リモネン (d-Limonene)、オレンジオイル (Orange Oil)、リナロール (Linalool)、メントール (Menthol)、ウルソール酸 (ursolic acid)、オレアノール酸 (Oleanolic Acid)、ニームオイル (neem oil)。

b) 微生物 (微生物株又はその抽出物や代謝物)

トリコデルマ・アトロビリデ I-1237株 (Trichoderma atroviride strain I-1237)、トリコデルマ・アトロビリデ LU132株 (Trichoderma atroviride strain LU132)、トリコデルマ・アトロビリデ SC1株 (Trichoderma atroviride strain SC1)、トリコデルマ・アトロビリデ SKT-1株 (Trichoderma atroviride strain SKT-1)、トリコデルマ・アトロビリデ 77B株 (Trichoderma atroviride strain 77B) ;

トリコデルマ・アスペレルム T34 株 (Trichoderma asperellum strain T34)、トリコデルマ・アスペレルム kd株 (Trichoderma asperellum strain kd)

;

トリコデルマ・ハルチアナム T-22 株 (Trichoderma harzianum strain T-22) ;

トリコデルマ・ビレンス G-41株 (Trichoderma virens strain G-41) など

の、トリコデルマ属菌 (*Trichoderma* spp.)。

グリオクラディウム・カテナラタム J1446 株 (*Gliocladium catenulatum* strain J1446) などの、グリオクラディウム属菌 (*Gliocladium* spp.)。

クロノスタキス・ロゼア CR-7 株 (*Clonostachys rosea* strain CR-7) などのクロノスタキス属菌 (*Clonostachys* spp.)。

コニオチリウム・ミニタンス CON/M/91-08 株 (*Coniothyrium minitans* strain CON/M/91-08) などのコニオチリウム属菌 (*Coniothyrium* spp.)。

タラロマイセス・フラバス SAY-Y-94-01 株 (*Talaromyces flavus* strain SAY-Y-94-01) ; などのタラロマイセス 属菌 (*Talaromyces* spp.)。

サッカロマイセス・セレビスエ LAS02 株 (*Saccharomyces cerevisiae* strain LAS02) などのサッカロマイセス属菌 (*Saccharomyces* spp.)。

バチルス・アミロリクエファシエンズ QST713 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain QST713)、バチルス・アミロリクエファシエンズ FZB24 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain FZB24)、バチルス・アミロリクエファシエンズ MBI600 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain MBI600)、バチルス・アミロリクエファシエンズ D747 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain D747)、バチルス・アミロリクエファシエンズ F727 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain F727)、バチルス・アミロリクエファシエンズ AT-332 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain AT-332) ;

バチルス・ズブチリス AFS032321 株 (*Bacillus subtilis* strain AFS032321)、バチルス・ズブチリス Y1336 株 (*Bacillus subtilis* strain Y1336)、バチルス・ズブチリス HAI-0404 株 (*Bacillus subtilis* strain HAI-0404) ; バチルス・シンプレクス (*Bacillus simplex*) などのバチルス属菌 (*Bacillus* spp.)。

パエニバシルス属菌 (*Paenibacillus* spp.)。

バークホルデリア属菌 (*Burkholderia* spp.)。

フザリウム属菌 (*Fusarium* spp.)。

シュードモナス・クロロファフィス AFS 009 株 (*Pseudomonas chlororaph*

is strain AFS009)、シュードモナス フルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*)、シュードモナス・ロデシアHAI-0804株 (*Pseudomonas rhodesiae* HAI-0804) などのシュードモナス属菌 (*Pseudomonas* spp.)。

ストレプトミセス・グリセオビリデス K61 株 (*Streptomyces griseovirides* strain K61)、ストレプトミセス・リディクス WYEC 108株 (*Streptomyces lydicus* strain WYEC108) などのストレプトミセス属菌 (*Streptomyces* spp.)。

アグロバクテリウム・ラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) などのアグロバクテリウム属菌 (*Agrobacterium* spp.)。

非病原性エルビニア・カロトボーラ (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*) などのエルビニア属菌 (*Erwinia* spp.)。

バリオボラックス・パラドクス (*Variovorax paradoxus*) などのバリオボラックス属菌 (*Variovorax* spp.)。

ラクトバチルス・プランタラム (*Lactobacillus plantarum*) などのラクトバチルス属菌 (*Lactobacillus* spp.)。

c) その他の剤

酵母若しくはそのエキス、 $\beta$ -グルカン、キチン若しくはキトサンまたはこれらの断片、 $\beta$ -アミノ酪酸、2, 6-ジクロロイソニコチン酸、サリチル酸若しくはその誘導体、藻類抽出物、藻類エキス (加水分解物)、ジャスミン花エキス、アルギン酸ナトリウム、オリゴ糖、トレハロース、多糖、脂質、リポ多糖、脂肪酸、糖脂質、糖タンパク、糖ペプチド、植物および/または病原微生物に由来のタンパク質若しくはペプチド、およびエルゴステロールなどの、エリシター (elicitor) となり得る物質。

[0221] (N) 未分類の剤

鉱物油 (mineral oils)、有機油 (organic oils)、無機塩類 (inorganic salts)、天然物起源 (material of biological origin)、炭酸水素カリウム (Potassium bicarbonate)、炭酸水素ナトリウム (Sodium hydrogen carbonate)、炭酸カルシウム (Calcium carbonate)、水酸化カルシウム (Calcium

hydroxide)、ヨウ化カリウム (Potassium iodide)、ホスホン酸カリウム (Potassium phosphonates)、キトサン塩酸塩 (Chitosan hydrochloride)、尿素 (Urea)。

[0222] 本発明の農園芸用殺菌剤または殺線虫剤と混用または併用することができる殺虫・殺ダニ剤として、IRAC (Insecticide Resistance Action Committee) のHP (<https://irac-online.org/>) に記載される化合物、または農業上許容されるそれらの塩、若しくは誘導體等を好ましいものとして挙げるができる。

具体的には以下の群から選択される化合物を例示することができる。

[0223] 殺虫剤・殺ダニ剤：

(1 A) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤 (カーバメート系) :  
アラニカルブ (Alanycarb)、アルジカルブ (Aldicarb)、ベンダイオカルブ (Bendiocarb)、ベンフラカルブ (Benfuracarb)、ブトカルボキシム (Buto carboxim)、ブトキシカルボキシム (Butoxycarboxim)、カルバリル (Carb aryl)、カルボフラン (Carbofuran)、カルボスルファン (Carbosulfan)、エチオフエンカルブ (Ethiofencarb)、フェノブカルブ (Fenobucarb)、ホルメタネート (Formetanate)、フラチオカルブ (Furathiocarb)、イソプロカルブ (Isoproc carb)、メチオカルブ (Methiocarb)、メソミル (Methomyl)、メトルカルブ (Metolcarb)、オキサミル (Oxamyl)、ピリミカーブ (Pirimicarb)、プロポキスル (Propoxur)、チオジカルブ (Thiodicarb)、チオファノックス (Thiofanox)、トリアザメート (Triazamate)、トリメタカルブ (Trimethacarb)、XMC、キシリルカルブ (Xyllylcarb)、アルドキシカルブ (Aldoxycarb)、アリキシカルブ (Allyxycarb)、アミノカルブ (Aminocarb)、ブフェンカルブ (Bufencarb)、クロエトカルブ (Cloethocarb)、フェノチオカルブ (Fenothiocarb)、プロメカルブ (Promecarb)。

[0224] (1 B) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤 (有機リン系) :  
アセフェート (Acephate)、アザメチホス (Azamethiphos)、アジンホスエチル (Azinphos-ethyl)、アジンホスメチル (Azinphosmethyl)、カズサホ

ス (Cadusafos)、クロレトキシホス (Chlorethoxyfos)、クオルフェンビンホス (Chlorfenvinphos)、クオルメホス (Chlormephos)、クオルピリホス (Chlorpyrifos)、クオルピリホスメチル (Chlorpyrifos-methyl)、クマホス (Coumaphos)、シアノホス (Cyanophos)、ジメトン-S-メチル (Demeton-S-methyl)、ダイアジノン (Diazinon)、ジクローボス (Dichlorvos/ DDVP)、ジクロトホス (Dicrotophos)、ジメトエート (Dimethoate)、ジメチルビンホス (Dimethylvinphos)、ジスルホトン (Disulfoton)、E P N、エチオン (Ethion)、エトプロホス (Ethoprophos)、ファンフル (Famphur)、フェナミホス (Fenamiphos)、フェニトロチオン (Fenitrothion)、フェンチオン (Fenthion)、ホスチアゼート (Fosthiazate)、ヘプテノホス (Heptenophos)、イミシアホス (Imicyafos)、イソフェンホス (Isofenphos)、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 (Isopropyl O-(methoxyaminothio-phosphoryl) salicylate)、イソキサチオン (Isoxathion)、馬拉チオン (Malathion)、メカルバム (Mecarbam)、メタミドホス (Methamidophos)、メチダチオン (Methidathion)、メビンホス (Mevinphos)、モノクロトホス (Monocrotophos)、ナレド (Naled)、オメトエート (Omethoate)、オキシジメトンメチル (Oxydemeton-methyl)、パラチオン (Parathion)、パラチオンメチル (Parathion-methyl)、フェントエート (Phenthoate)、ホレート (Phorate)、ホサロン (Phosalone)、ホスメット (Phosmet)、ホスファミドン (Phosphamidon)、ホキシム (Phoxim)、ピリミホスメチル (Pirimiphos-methyl)、プロフェノホス (Profenofos)、プロペタムホス (Propetamphos)、プロチオホス (Prothiofos)、ピラクロホス (Pyraclofos)、ピリダフェンチオン (Pyridaphenthion)、キナルホス (Quinalphos)、スルホテップ (Sulfotep)、テブピリムホス (Tebupirimfos)、テムホス (Temephos)、テルブホス (Terbufos)、テトラクロルビンホス (Tetrachlorvinphos)、チオメトン (Thiometon)、トリアゾホス (Triazophos)、トリクロルホン (Trichlorfon)、バミドチオン (Vamidothion)、ブromoホス-エチル (Bromophos-e)、シアノフェンホス (Cyanofenphos)、

デメトン-S-メチルスルホン (Demeton-S-methylsulfone)、ジアリホス (Dialifos)、ジクロフェンチオン (Dichlofenthion)、ジオキサベンゾホス (Dioxabenzofos)、エトリムホス (Etrimfos)、フェンスルホチオン (Fensulfothion)、ホノホス (Fonofos)、ホルモチオン (Formothion)、ヨードフェンホス (iodofenphos)、イサゾホス (Isazofos)、イソカルボホス (Isocarbofos)、メタクリホス (Methacrifos)、ホスホカルブ (Phosphocarb)、ピリミホス-エチル (Pirimiphos-e)、プロパホス (Propaphos)、プロトエート (Prothoate)、スルプロホス (Sulprofos)。

[0225] (2) GABA作動性塩化物イオン(塩素イオン)チャンネルブロッカー：

クロルデン (Chlordane)、エンドスルファン (Endosulfan)、エチプロール (Ethiprole)、フィプロニル (Fipronil)、アセトプロール (Acetoprole)、カンフェクロル (Camphechlor)、ジエノクロル (Dienochlor)、ヘプタクロル (Heptachlor)、ピラフルプロール (Pyrafluprole)、ピリプロール (Pyrriprole)、フルフィプロール (Flufiprole)。

[0226] (3A) ナトリウムチャンネルモジュレーター (ピレスロイド系)：

アクリナトリン (Acrinathrin)、アレスリン (Allethrin)、d-シス-トランス-アレスリン (d-cis-trans Allethrin)、d-トランス-アレスリン (d-trans Allethrin)、ピフェントリン (Bifenthrin)、バイオアレスリン (Bioallethrin)、バイオアレスリン-S-シクロペンテニル-異性体 (Bioallethrin S-cyclopentenyl-isomer)、ピオレスメトリン (Bioresmethrin)、シクロプロトリン (Cycloprothrin)、シフルトリン (Cyfluthrin)、 $\beta$ -シフルトリン (beta-Cyfluthrin)、シハロトリン (Cyhalothrin)、 $\lambda$ -シハロトリン (lambda-Cyhalothrin)、 $\gamma$ -シハロトリン (gamma-Cyhalothrin)、シペルメトリン (Cypermethrin)、 $\alpha$ -シペルメトリン (alpha-Cypermethrin)、 $\beta$ -シペルメトリン (beta-Cypermethrin)、 $\theta$ -シペルメトリン (theta-Cypermethrin)、 $\zeta$ -シペルメトリン (zeta-Cypermethrin)、シフェノトリン[(1R)-トランス異性体] (Cyphenothrin [(1R)-trans-isomers])、デルタメトリン (Deltamethrin)、エンペントリン[(EZ)-(1R)-異性体] (Empenthrin[(EZ)-(1R)-isomers])

omers] )、エスフェンバレレート (Esfenvalerate)、エトフェンプロックス (Etofenprox)、フェンプロパトリン (Fenpropathrin)、フェンバレレート (Fenvalerate)、フルシトリネート (Flucythrinate)、フルメトリン (Flumethrin)、 $\tau$ -フルバリネート ( $\tau$ -Fluvalinate)、ハルフェンプロックス (Halfenprox)、イミプロトリン (Imiprothrin)、カデスリン (Kadethrin)、ペルメトリン (Permethrin)、フェノトリン[(1R)-トランス異性体] (Phenothrin [(1R)-trans-isomer])、プラレトリン (Prallethrin)、ピレトリン (Pyrethrins)、レスメトリン (Resmethrin)、シラフルオフエン (Silafluofen)、テフルトリン (Tefluthrin)、テトラメスリン (Tetramethrin)、テトラメスリン[(1R)-異性体] (Tetramethrin[(1R)-isomers])、トラロメトリン (Tralomethrin)、トランスフルトリン (Transfluthrin)、 $\kappa$ -ビフェントリン (kappa-Bifenthrin)、ビオペルメトリン (Biopermethrin)、クロロプラレスリン (Chloroprallethrin)、ジメフルトリン (Dimefluthrin)、フェンフルトリン (Fenfluthrin)、フェンピリトリン (Fenpirithrin)、フルフェンプロックス (Flufenprox)、ヘプタフルスリン (Heptafluthrin)、メペルフルスリン (Meperfluthrin)、 $\epsilon$ -メトフルトリン (epsilon-Metofluthrin)、モンフルオロトリン (Momfluorothrin)、 $\epsilon$ -モンフルオロトリン (epsilon-Momfluorothrin)、トランス-ペルメトリン (trans-Permethrin)、プロフルトリン (Profluthrin)、プロトリフェンブト (Protrifenbutate)、 $\kappa$ -テフルトリン (kappa-Tefluthrin)、テラレトリン (Terallethrin)、テトラメチルフルスリン (Tetramethylfluthrin)、ビオエタノメトリン (Bioethanomethrin)。

[0227] (3B) ナトリウムチャンネルモジュレーター (DDT類) :

DDT、メトキシクロル (Methoxychlor)。

[0228] (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 (Acetamiprid)、クロチアニジン (Clothianidin)、ジノテフラン (Dinotefuran)、イミダクロプリド (Imidacloprid)、ニテンピラム (Nitenpyram)、チアクロプリド (Thiacloprid)、チアメトキサム (Thiamethoxam)



thoxam)、ニコチン (Nicotine)、スルホキサフロル (Sulfoxaflor)、フルピラジフロロン (Flupyradifurone)、トリフルメゾピリム (Triflumezopyrim)、ニチアジン (Nithiazine)、ジクロロメゾチアズ (Dicloromezotiaz)、フルピリミン (Flupyrimin)。

[0229] (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 (Spinetoram)、スピノサド (Spinosad)。

[0230] (6) グルタミン酸作動性塩化物イオン(塩素イオン)チャンネル(GluCl)アロステリックモジュレーター:

アバメクチン (Abamectin)、エマメクチン (Emamectin)、エマメクチン安息香酸塩 (Emamectin-benzoate)、レピメクチン (Lepimectin)、ミルベメクチン (Milbemectin)、ドラメクチン (Doramectin)、エプリノメクチン (Eprinomectin)、イベルメクチン (Ivermectin)、モキシデクチン (Moxidectin)、セラメクチン (Selamectin)。

[0231] (7) 幼若ホルモン類似剤:

ヒドロプレン (Hydroprene)、キノプレン (Kinoprene)、メトプレン (Methoprene)、フェノキシカルブ (Fenoxycarb)、ピリプロキシフェン (Pyriproxifen)、ジオフェノラン (Diofenolan)、エポフェノナン (Epofenonane)、トリプレン (Triprene)。

[0232] (8) その他の非特異的(マルチサイト)阻害剤:

臭化メチル (Methyl bromide) 等のハロゲン化アルキル類 (alkyl halides)、クロルピクリン (Chloropicrin)、弗化アルミニウムナトリウム (Sodium aluminum fluoride)、フッ化スルフリル (Sulfuryl fluoride)、ホウ砂 (Borax)、ホウ酸 (Boric acid)、オクタホウ酸二ナトリウム塩 (Disodium octaborate)、ホウ酸ナトリウム塩 (Sodium borate)、メタホウ酸ナトリウム塩 (Sodium metaborate)、吐酒石 (Tartar emetic)、ダゾメット (Dazomet)、メタム (Metam)、メタムカリウム塩 (Metam Sodium)、メタムナトリウム塩 (Metam Potassium)。

[0233] (9) 弦音器官TRPVチャネルモジュレーター：

ピメトロジン (Pymetrozine)、ピリフルキナゾン (Pyriproxyquinazone)、アフィドピロペン (Afidopyropen)。

[0234] (10) ダニ類成長阻害剤：

クロフェンテジン (Clofentezine)、ジフロビダジン (Diflovidazin)、ヘキシチアゾクス (Hexythiazox)、エトキサゾール (Etoxazole)。

[0235] (11) 微生物由来昆虫中腸内膜破壊剤：

B. t. subsp. israelensis、B. t. subsp. aizawai、B. t. subsp. kurstaki、B. t. subsp. tenebrionis、B. t. 作物に含まれるタンパク質 (B. t. crop proteins)、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1、Bacillus sphaericus。

注) 「B. t.」はバチルス・チューリングエンシス (Bacillus thuringiensis) であり、「B. t. 作物に含まれるタンパク質」とは、B. t. (バチルス・チューリングエンシス) の生産する毒素たんぱく質 (Cry1Ab等) の遺伝子を組み込んだ作物内において生産されたタンパク質である。

[0236] (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 (Diafenthiuron)、アゾシクロチン (Azocyclotin)、シヘキサチン (Cyhexatin)、酸化フェンブタズ (Fenbutatin-oxide)、プロパルギット (Propargite)、テトラジホン (Tetradifon)。

[0237] (13) プロトン勾配を攪乱する酸化的リン酸化脱共役剤：

クロルフェナピル (Chlorfenapyr)、DNOC (4,6-dinitro-o-cresol)、スルフルラミド (Sulfluramid)、ビナパクリル (Binapacryl)、ジノブトン (Dinobuton)、ジノカップ (Dinocap)。

[0238] (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 (Bensultap)、カルタップ塩酸塩 (Cartap hydrochloride)、チオシクラム (Thiocyclam)、チオスルタップーナトリウム塩 (Thiosultap-sodium)。

[0239] (15) キチン生合成阻害剤、タイプ0：

ビストリフルロン (Bistrifluron)、クロルフルアズロン (Chlorfluazuron)、ジフルベンズロン (Diflubenzuron)、フルシクロクスロン (Flucycloxuron)、フルフェノクスロン (Flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (Hexaflumuron)、ルフエヌロン (Lufenuron)、ノバルロン (Novaluron)、ノビフルムロン (Noviflumuron)、テフルベンズロン (Teflubenzuron)、トリフルムロン (Triflumuron)、フルアズロン (Fluazuron)。

[0240] (16) キチン生合成阻害剤、タイプ1:

ブプロフェジン (Buprofezin)。

[0241] (17) 脱皮阻害剤:

シロマジン (Cyromazine)。

[0242] (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 (Chromafenozide)、ハロフェノジド (Halofenozid)、メトキシフェノジド (Methoxyfenozide)、テブフェノジド (Tebufenozide)。

[0243] (19) オクトパミン受容体アゴニスト:

アミトラズ (Amitraz)、クロルジメホルム (Chlordimeform)。

[0244] (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 (Hydramethylnon)、アセキノシル (Acequinocyl)、フルアクリピリム (Fluacrypyrim)、ビフェナゼート (Bifenazate)。

[0245] (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 (Fenazaquin)、フェンピロキシメート (Fenpyroximate)、ピリダベン (Pyridaben)、ピリミジフェン (Pyrimidifen)、テブフェンピラド (Tebufenpyrad)、トルフェンピラド (Tolfenpyrad)、ロテノン (Rotenone)。

[0246] (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 (Indoxacarb)、メタフルミゾン (Metaflumizone)。

[0247] (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 (Spirodiclofen)、スピロメシフェン (Spiromesifen)、スピロテトラマト (Spirotetramat)、スピロピジオン (Spiropidion)。

[0248] (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 (Al-phosphide)、リン化カルシウム (Ca-phosphide)、リン化亜鉛 (Zn-phosphide)、ホスフィン (Phosphine)、シアン化カルシウム (Ca-cyanide)、シアン化ナトリウム (Na-cyanide)、シアン化カリウム (K-cyanide)。

[0249] (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 (Cyenopyrafen)、シフルメトフェン (Cyflumetofen)、ピフルブミド (Pyflubumide)。

[0250] (26) 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 (Chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール (Cyantraniliprole)、シクラニリプロール (Cyclaniliprole)、フルベンジアミド (Flubendiamide)、シハロジアミド (Cyhalodiamide)、テトラクロラントラニリプロール (Tetrachlorantraniliprole)、テトラニリプロール (Tetraniliprole)。

[0251] (27) 弦音器官モジュレーター 標的部位未特定：

フロニカミド (Flonicamid)。

[0252] (28) GABA作動性塩化物イオン(塩素イオン)チャンネルアロステリックモジュレーター：

ブロフラニリド (Broflanilide)、フルキサメタミド (Fluxametamide)、イソシクロセラム (Isocycloseram)、アフォキシラネル (Afoxolaner)、フルララネル (Fluralaner)、ロチラネル (Lotilaner)、サロラネル (Sarolaner)。

[0253] (29) 作用機構不明 (UN) の剤：

アザジラクチン (Azadirachtin)、ベンゾキシメート (Benzoximate)、ブロモプロピレート (Bromopropylate)、キノメチオナート (Chinomethionat/Quinomethionate)、ジコホル (Dicofol)、石灰硫黄合剤 (Lime sulfur)、マンコゼブ (Mancozeb)、ピリダリル (Pyridalyl)、硫黄 (Sulfur)。

[0254] (30) その他の殺虫剤、殺ダニ剤：

アシノナピル (Acynonapyr)、アミドフルメット (Amidoflumet)、ベンゾメート (Benzomate)、ベンズピリモキサソ (Benzpyrimoxan)、クロルベンジレート (Chlorobenzilate)、ジシクラニル (Dicyclanil)、フェノキサクリム (Fenoxacrim)、フェントリファニル (Fentrifanil)、フロメトキン (Flometoquin)、フルベンジミン (Flubenzimine)、フルフェンジン (Flufenzine)、フルヘキサホン (Fluhexafon)、フルオピラム (Fluopyram)、メタフルミゾン (Metaflumizone)、メトキサジアゾン (Metoxadiazone)、オキサゾスルフィル (Oxazosulfyl)、テトラスル (Tetrasul)、トリアラセン (Triarathene)、チクロピラゾフロル (Tyclopyrazoflor)。

[0255] また、植物成長調整剤も混合することができる。混合することができる植物成長調整剤として、具体的には以下の群から選択される化合物を例示することができる。

アブシジン酸 (abscisic acid)、カイネチン (kinetin)、ベンジルアミノプリン (Benzylaminopurine)、1,3-ジフェニルウレア (1,3-diphenyl urea)、ホルクロルフェニユロン (forchlorfenuron)、チジアズロン (thidiazuron)、クロルフェヌロン (chlorfenuron)、ジヒドロゼアチン (dihydrozeatin)、ジベレリンA (gibberellin A)、ジベレリンA4 (gibberellin A4)、ジベレリンA7 (gibberellin A7)、ジベレリンA3 (gibberellin A3)、1-メチルシクロプロパン (1-methylcyclopropane)、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) (N-acetyl aminoethoxyvinyl glycine (aviglycine))、アミノオキシ酢酸 (aminooxyacetate)、硝酸銀 (silver nitrate)、塩化コバルト (cobalt chloride)、IAA、4-CPA、クロプロップ (cloprop)、2,4-D、MCPB、インドール-3-酪酸 (indole-3-butyrate)、ジクロロプロップ (dichlorprop)、フェノチオール (phenothiol)、1-ナフチルアセトアミド (1-naphthyl acetamide)、エチクロゼート (ethychlozate)、クロキシホナック (cloxyfonac)、マレイン酸ヒドラジド (maleic acid hydrazide)、2,3,5-トリヨード安息香酸 (2,3,5-triiodobenzoic acid)、サリチル酸 (salicylic acid)

、サリチル酸メチル (methyl salicylate)、(-)-ジャスモン酸 ((-)-jasmonic acid)、ジャスモン酸メチル (methyl jasmonate)、(+)-ストリゴール ((+)-strigol)、(+)-デオキシストリゴール ((+)-deoxystrigol)、(+)-オロバンコール ((+)-orobanchol)、(+)-ソルゴラクトン ((+)-sorgolactone)、4-オキソ-4-(2-フェニルエチル)アミノ酪酸 (4-oxo-4-(2-phenylethyl)aminobutyric acid)、エテホン (ethephon)、クロルメコート (chloromequat)、メピコートクロリド (mepiquat chloride)、ベンジルアデニン (benzyladenine)、5-アミノレブリン酸 (5-amino levulinic acid)、ダミノジッド (daminozide)。

[0256] また、駆虫剤も混合することができる。混合することができる駆虫剤として、具体的には以下の群から選択される化合物を例示することができる。

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。

[0257] [製剤処方]

本発明の農園芸用殺菌剤または殺線虫剤は、本発明のピリダジノン化合物

のほか、他の有効成分や農園芸学的に許容される製剤化のための補助成分（たとえば、無機担体、有機担体、界面活性剤、溶媒など）を添加することができる。

本発明の農園芸用殺菌剤または殺線虫剤は、剤形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、錠剤などの剤形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。

以下に、製剤実施例を若干示す。なお、以下に示す製剤処方単なる例示であり、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実施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「重量部」を意味する。

[0258] (製剤例 1 : 水和剤)

本発明のピリダジノン化合物 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 部を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分 40% の水和剤を得る。

(製剤例 2 : 乳剤)

本発明のピリダジノン化合物 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% の乳剤を得る。

(製剤例 3 : 粒剤)

本発明のピリダジノン化合物 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、微細に粉碎し、その後、粒子直径 0.5 ~ 1.0 mm に造粒して有効成分 5% の粒剤を得る。

(製剤例 4 : 粒剤)

本発明のピリダジノン化合物 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、粉碎した。これに水を加えてよく練り合せ、その後、造粒

し、乾燥させて、有効成分5%の粒剤を得る。

(製剤例5：懸濁剤)

本発明のピリダジノン化合物10部、ポリオキシエチレンアルキルア릴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碎し、有効成分10%の懸濁剤を得る。

(製剤例6：顆粒水和剤)

本発明のピリダジノン化合物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部を均一に混合して微細に粉碎後、適量の水を加えてから練り込んで粘土状にする。粘土状物を造粒し、次いで乾燥させて有効成分40%の顆粒水和剤を得る。

[0259]〔医療用・動物用（獣医療用）抗真菌剤〕

本発明のピリダジノン化合物は、人または動物に感染する有害な病原菌、特に真菌を防除対象とした予防薬、治療薬として用いることができる。

本発明の医療用・動物用抗真菌剤は、化合物(1)およびその塩から選ばれる少なくともひとつを有効成分として含有するものである。本発明の医療用抗真菌剤に含まれる化合物(1)またはその塩の量は、抗真菌効果を示す限りにおいて特に制限されない。

[0260] 本明細書における「動物」とは、愛玩動物や家畜・家禽、動物園や水族館等で飼育される展示動物、捕獲した野生動物、さらには研究・実験動物等の脊椎動物 ( V e r t e b r a t a ) を意味する。

[0261] 例えば、以下の動物が挙げられるが、動物の具体例はこれらのみ限定されるものではない。

ヒツジ、ヤギ、ブタ、ウマ、ウシ、スイギュウ、ロバ、ラバ、ラクダ、ラマ、アルパカ、イノシシ、トナカイ、シカ、ミンク、ゾウ、クマ、カンガルー、キツネ、イヌ、ネコ、リス、ウサギ、マウス、ラット、モルモット、ハ



ムスター、サル、フェレット等の哺乳類。

ハト、インコ、オウム、ブンチョウ、ジュウシマツ、カナリア、ニワトリ、アヒル、シチメンチョウ、カモ、キジ、クジャク、ダチョウ、ハクチョウ、スズメ、ウズラ、フクロウ、ワシ、タカ、ウミウなどの鳥類。

カメレオン、イグアナ、トカゲ、ヘビ、カメ、ワニ、ヤモリなどの爬虫類。

カエル、イモリなどの両生類。

コイ、キングヨ、メダカ、熱帯魚、ブリ・ハマチ、タイ、カンパチ、サケ、サバ、スズキ、クエ、マグロ、アジ、ヒラメ、フグなどの魚類。

[0262] 本発明の医療用・動物用抗真菌剤の適用が可能な病原菌として、真菌（カビ）の例を以下に示す。なお、具体例はこれらのみ限定されるものではない。

例えば、*absidia corymbifera*などのAbsidia属；*Acremonium*属；*Alternaria alternata*などのAlternaria属；*Aspergillus flavus*、*Aspergillus fumigatus*、*Aspergillus nidulans*、*Aspergillus niger*、*Aspergillus parasiticus*、*Aspergillus terreus*などのAspergillus属；*Bipolaris*属；*Blastomyces dermatitidis* などのBlastomyces属；*Blumeria graminis* などのBlumeria属；*Candida albicans*、*Candida glabrata*、*Candida krusei*、*Candida parapsilosis*、*Candida tropicalis* などのCandida属；*Cladosporium cladosporoides*、*Cladosporium herbarium* などのCladosporium属；*Coccidioides immitis*、*Coccidioides posadasii* などのCoccidioides属；*Colletotrichium trifolii* などのColletotrichium属；*Cryptococcus neoformans* などのCryptococcus属；*Curvularia lunata* などのCurvularia属；*Encephalitozoon cuniculi* などのEncephalitozoon属；*Epicoccum nigrum* などのEpicoccum属；*Epidermophyton floccosum* などのEpidermophyton属；*Exophiala*属；*Exserohilum rostratum* などのExserohilum属；*Fusarium graminearum*、*Fusarium solani*、*Fusarium sporotrichoides* などのFusarium属；*Fonsecaea monophora* などのFonsecaea属；*Histoplasma capsulatum* などのHistoplasma属；*Leptosphaeria*

nodorumなどのLeptosphaeria属； Malassezia globosa などのMalassezia属； Microsporium canis などのMicrosporium属；Mycosphaerella graminicolaなどのMycosphaerella属；Neurospora属；Paecilomyces lilanicus、Paecilomyces varioti などのPaecilomyces属；PenicilliumchrysogenumなどのPenicillium属； Phytophthora capsici、Phytophthora infestansなどのPhytophthora属；Plasmopara viticola などのPlasmopara属；Pneumocystis jiroveciiなどのPneumocystis属；Pyricularia oryzaeなどのPyricularia属；Pythium ultimumなどのPythium属；Puccinia coronata、Puccinia graminis などのPuccinia属；Rhizoctonia solaniなどのRhizoctonia属；Rhizomucor属；Fusarium apiospermum、Scedosporium prolificansなどのScedosporium属；Scopulariopsis brevicaulisなどのScopulariopsis属；Sporothrix schenckii などのSporothrix 属； Talaromyces marneffeiiなどのTalaromyces属、Trichophyton mentagrophytes、Trichophyton interdigitale、Trichophyton rubrum、Trichophyton tonsurans、Trichophyton verrucosumなどのTrichophyton属；Trichosporon asahii、Trichosporon beigeliiなどのTrichosporon属；Ustilago属など。

これらの中、本発明の抗真菌剤は、Aspergillus属、Trichophyton属またはCandida属に対して好適であり、Aspergillus fumigatusまたはTrichophyton tonsuransに対して特に好適である。

[0263] 本発明の医療用・動物用抗真菌剤の適用が可能な感染症として、真菌症の例を以下に示す。なお、具体例はこれらのみ限定されるものではない。

[0264] 本発明の医療用・動物用抗真菌剤は、全身性真菌感染症、表在性真菌感染症などのいずれにも適用できる。真菌感染症の具体例としては、肺アスペルギルス症、全身性アスペルギルス症（骨髄受容者またはAIDS患者などの免疫抑制患者において発症しやすい）などのアスペルギルス（Aspergillus）症、全身性カンジダ症などのカンジダ（Candida）症、クリプトコッカス（Cryptococcus）髄膜炎、鼻脳型ムコール症（rhinocerebral mucormycosis）、肺ムコール症、ブラストミセス症、ヒストプラズマ症、コクシジオイデス症（cocci

diomycosis)、パラコクシジオイデス症 (paracoccidiomycosis)、口ボ真菌症、角膜真菌症、スポロトリウム症、クロモブラストミコーシス、クロモミコーシス、フェオフィホ真菌症、接合菌症、クリプトコッカス症、播種性スポロトリウム症、白癬 (ring worm)、頭部白癬 (しらくも)、体部白癬 (たむし)、股部白癬 (いんきん)、足白癬 (水虫)、爪白癬 (爪水虫)、皮膚、口、または膣のカンジダ症、マラセチア症、慢性粘膜皮膚カンジダ症、ニューモシスチス肺炎、マルネフェイ型ペニシリウム症等が挙げられる。

また、本発明の抗真菌剤は、真菌によって引き起こされるアレルギー疾患、例えば、アレルギー性気管支肺喘息 (allergic bronchopulmonary asthma) (ABPA) ; 喘息、鼻副鼻腔炎、または副鼻腔炎等にも適用可能である。

[0265] 本発明の医療用・動物用抗真菌剤は、薬学的に許容される添加剤を含むことができる。添加剤は、公知の医療用薬剤において、使用されているものであれば特に制限されない。これらは、当然ながら、無菌であり、発熱性がない。また、添加剤は、抗真菌剤の剤型や投与方法などに応じて、適宜、選択することができる。

[0266] 本発明の医療用・動物用抗真菌剤が採り得る剤型は、特に限定されず、例えば、錠剤、粉剤、粒剤、顆粒剤、カプセル剤、トローチ (飴)、ペレットなどの固体剤 ; シロップ、乳濁剤、懸濁剤、溶液、滴下 (Pour-on) 剤、点下 (Spot-on) 剤、などの液体剤 ; 軟膏剤、ゲルなどの半固体調製物など ; エアロゾル、蒸気などの気体剤 ; ナノ粒子製剤などを挙げることができる。

本発明の医療用抗真菌剤の投与は、公知の方法で行うことができる。投与方法としては、例えば、皮下、静脈内、筋肉内、胸骨内 (intrasternally) 等への注入 (注射) ; 肛門、膣などへの挿入、皮膚表面への塗布や散布、滴下などの経皮投与 ; 口から服用などの経口投与 ; 吸気などによる経鼻投与などを挙げることができる。

[0267] 経口投与用の固体剤の場合、本発明の医療用・動物用抗真菌剤に使用できる添加剤としては、シクロデキストリンまたは修飾シクロデキストリン等の溶解補助剤 ; ラクトース、デキストロース、サッカロース、セルロース、コ

ーンスターチまたはジャガイモデンプン等の希釈剤；シリカ、タルク、ステアリン酸、ステアリン酸マグネシウムもしくはステアリン酸カルシウム、ポリエチレングリコール等の滑沢剤；デンプン、アラビアゴム (arabic gums)、ゼラチン、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロースまたはポリビニルピロリドン等の結合剤；デンプン、アルギン酸、アルギン酸塩またはグリコール酸デンプンナトリウム等の脱凝集剤 (disaggregating agents)；発泡性混合物 (effervescent mixtures)；色素；甘味剤；レシチン、ポリソルベート、ラウリル硫酸 (laurylsulphates) 等の湿潤剤；または一般に医薬製剤に用いられる非毒性で薬理的に不活性な物質等を挙げることができる。これら添加剤は、混合、造粒、打錠、糖衣、またはフィルムコーティング等の公知の方法により本発明の医療用抗真菌剤に含有させることができる。

[0268] 経口投与用の液体剤の場合、本発明の医療用・動物用抗真菌剤に使用できる添加剤としては、シクロデキストリンまたは修飾シクロデキストリン等の溶解補助剤、サッカロースを、グリセリン、マンニトール、ソルビトール、天然ガム、寒天、アルギン酸ナトリウム、ペクチン、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、またはポリビニルアルコール等を挙げることができる。

[0269] 筋肉内注射用の液体剤の場合、本発明の医療用・動物用抗真菌剤に使用できる添加剤としては、滅菌水、オリーブ油、オレイン酸エチル、プロピレングリコール等のグリコール類、シクロデキストリン、修飾シクロデキストリン等の溶解補助剤等を挙げることができる。さらに必要に応じて適切な量のリドカイン塩酸塩を含ませることもできる。

[0270] 静脈注射用の液体剤の場合、本発明の医療用・動物用抗真菌剤に使用できる添加剤としては、滅菌水等の担体；シクロデキストリン、修飾シクロデキストリン等の溶解補助剤等を挙げることができる。これらは滅菌した等張生理食塩水溶液の形態で含ませることもできる。

[0271] 本発明の医療用・動物用抗真菌剤に含有する化合物 (I) またはその塩の量は、抗真菌剤の重量に対して、好ましくは 85 重量%以下、より好ましく

は50重量%以下である。

本発明の医療用・動物用抗真菌剤の用量は、投与方法、感染した真菌の種類、患者の年齢、体重、症状等に応じて適宜選択することができる。例えば、成人に対しては、経口または非経口（注射、点滴等）的投与の場合、1日に1または数回、0.1～100mg/kg-体重にて投与することができる。

また、本発明の医療用・動物用抗真菌剤は、ピリダジノン化合物以外の他の薬剤と組み合わせで使用することができる。

[0272] 以下に合成実施例を示し、本発明をより具体的に説明する。ただし、本発明は以下の合成実施例によって何ら制限されるものではない。

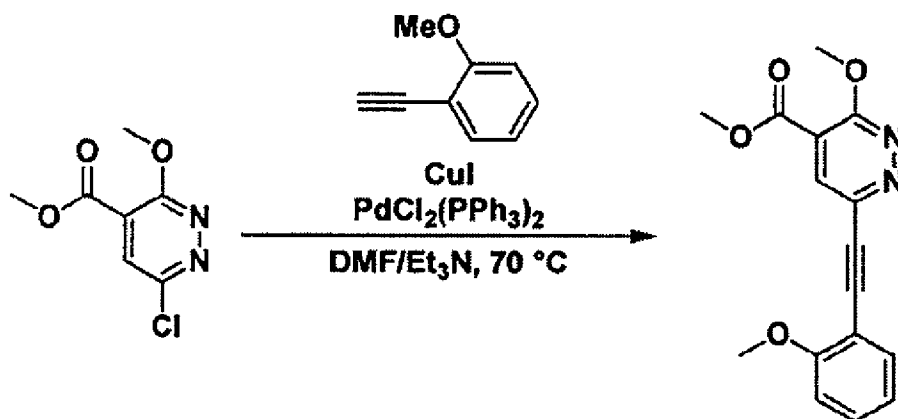
〔実施例1〕

(E)-2-(5-(1-(イソプロポキシイミノ)エチル)-3-(2-メトキシフェネチル)-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル)-N-イソプロピルプロパンアミド [(E)-2-(5-(1-(isopropoxyimino)ethyl)-3-(2-methoxyphenethyl)-6-oxopyridazin-1(6H)-yl)-N-isopropylpropanamide] の合成

(工程1)

メチル 3-メトキシ-6-((2-メトキシフェニル)エチニル)ピリダジン-4-カルボキシラート [methyl 3-methoxy-6-((2-methoxyphenyl)ethynyl)pyridazine-4-carboxylate] の合成

[0273] [化6]



[0274] メチル 6 - クロロ - 3 - メトキシピリダジン - 4 - カルボキシラート ( 2.65 g ) をジメチルホルムアミド ( 90 ml ) 、トリメチルアミン ( 150 ml ) へ溶解させた。これに、1 - エチニル - 2 - メトキシベンゼン ( 1.90 g ) 、ヨウ化銅 ( I ) ( 0.42 g ) 、ビス ( トリフェニルホスフィン ) パラジウム ( II ) ジクロリド ( 1.34 g ) を加え、反応容器を窒素で置換した後、70℃で1時間攪拌した。

反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過した。ろ液を減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ ( 展開溶媒 : n-ヘキサン / 酢酸エチル ) で精製することによって目的物 1.47 g ( 収率 38% ) を得た。

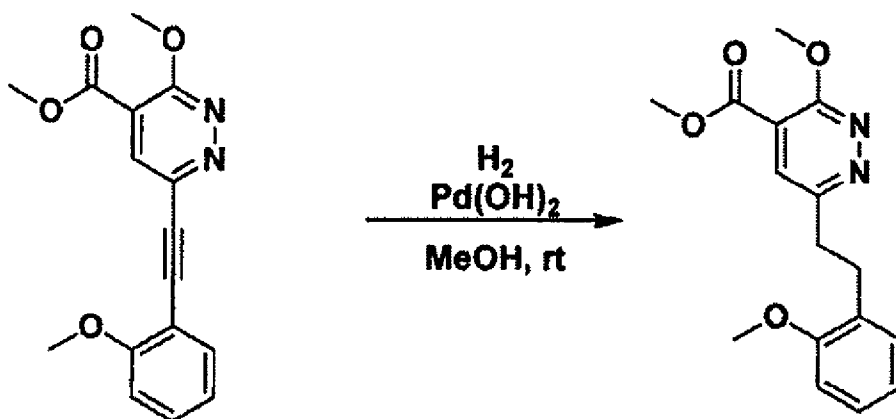
得られた目的物の<sup>1</sup>H-NMRを以下に示す。

<sup>1</sup>H-NMR ( 400 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) δ : 7.96 ( 1H, s ), 7.57 ( 1H, q ), 7.38-7.36 ( 1H, m ), 6.99-6.92 ( 2H, m ), 4.28 ( 3H, s ), 3.96 ( 3H, s ), 3.93 ( 3H, s ).

[0275] ( 工程 2 )

メチル 3 - メトキシ - 6 - ( 2 - メトキシフェネチル ) ピリダジン - 4 - カルボキシラート [ methyl 3-methoxy-6-(2-methoxyphenethyl)pyridazine-4-carboxylate ] の合成

[0276] [化7]



[0277] メチル 3 - メトキシ - 6 - ( ( 2 - メトキシフェニル ) エチニル ) ピリダジン - 4 - カルボキシラート ( 1.60 g ) をメタノール ( 54 ml ) へ

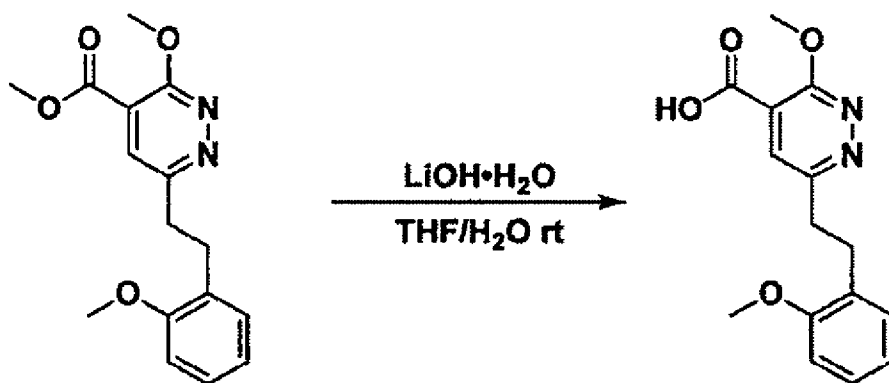
溶解させ、水酸化パラジウム（0.16 g）を加えた。反応容器を水素で置換した後、室温で終夜攪拌した。

反応液をセライトろ過し、ろ液を減圧濃縮し、得られた残渣（1.59 g）をそのまま次工程に用いた。

[0278]（工程3）

3-メトキシ-6-(2-メトキシフェネチル)ピリダジン-4-カルボン酸 [3-methoxy-6-(2-methoxyphenethyl)pyridazine-4-carboxylic acid] の合成

[0279] [化8]



[0280] メチル 3-メトキシ-6-(2-メトキシフェネチル)ピリダジン-4-カルボキシレート（1.59 g）をテトラヒドロフラン（9 ml）、水（7 ml）へ溶解させ、水酸化リチウム一水和物（0.34 g）を加えた。これを室温で1時間攪拌した後、反応液に水と酢酸エチルを加え、抽出した。

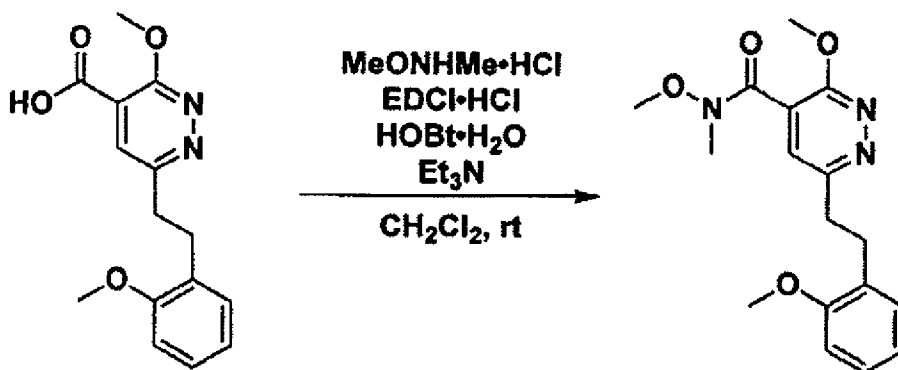
得られた水層に氷冷下、1 N塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過した。ろ液を減圧濃縮し、得られた残渣（1.24 g）をそのまま次工程に用いた。

[0281]（工程4）

N, 3-ジメトキシ-6-(2-メトキシフェネチル)-N-メチルピリダジン-4-カルボキシアミド [N,3-dimethoxy-6-(2-methoxyphenethyl)-N-methylpyridazine-4-carboxamide] の合成

[0282]

[化9]



[0283] 3-メトキシ-6-(2-メトキシフェネチル)ピリダジン-4-カルボン酸 (1.24 g) を塩化メチレン (20 ml) へ溶解させた。これに N, O-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (0.50 g)、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 (2.06 g)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物 (0.07 g)、トリエチルアミン (1.8 ml) を加え、室温で終夜攪拌した。

反応液に水を注ぎ、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過した。ろ液を減圧濃縮し、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) で精製することによって目的物 1.15 g (収率 65%, 三工程) を得た。

得られた目的物の<sup>1</sup>H-NMRを以下に示す。

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.21-7.16 (1H, m), 7.11-7.09 (2H, m), 6.86-6.83 (2H, m), 4.16 (3H, s), 3.82 (3H, s), 3.46 (3H, s), 3.35 (3H, s), 3.22-3.05 (4H, m).

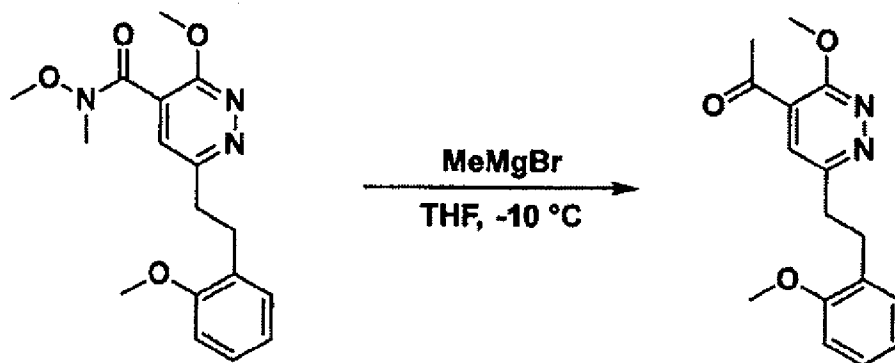
[0284] (工程 5)

1-(3-メトキシ-6-(2-メトキシフェネチル)ピリダジン-4-イル)エタン-1-オン [1-(3-methoxy-6-(2-methoxyphenethyl)-pyridazine-4-yl)ethan-1-one] の合成

[0285]



[化10]



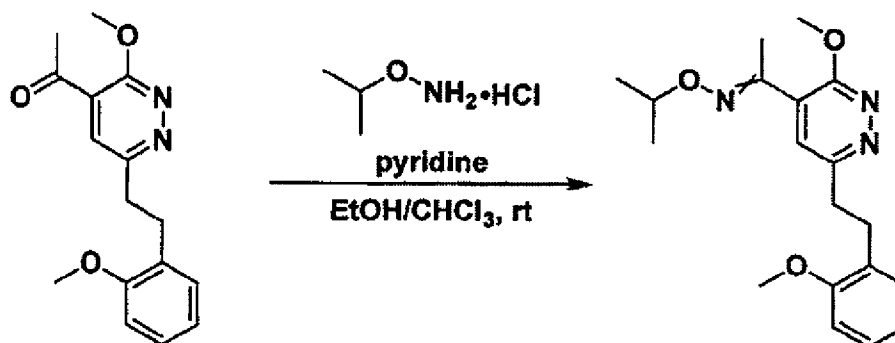
[0286] N, 3 - ジメトキシ - 6 - ( 2 - メトキシフェネチル ) - N - メチルピリダジン - 4 - カルボキシアミド ( 0. 25 g ) を無水テトラヒドロフラン ( 2. 5 ml ) へ溶解させ、反応溶液を窒素置換した後、 $-10^{\circ}\text{C}$  に冷却した。これに 1. 0 M メチルマグネシウムブロマイドテトラヒドロフラン溶液 ( 1. 1 ml ) を加え、 $-10^{\circ}\text{C}$  で 1 時間攪拌した。

反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過した。ろ液を減圧濃縮し、得られた残渣 ( 0. 19 g ) をそのまま次工程に用いた。

[0287] ( 工程 6 )

1 - ( 3 - メトキシ - 6 - ( 2 - メトキシフェネチル ) ピリダジン - 4 - イル ) エタン - 1 - オン O - イソプロピルオキシム [ 1 - ( 3 - methoxy - 6 - ( 2 - methoxyphenethyl ) - pyridazine - 4 - yl ) ethan - 1 - one O - isopropyl oxime ] の合成

[0288] [化11]



[0289] 1 - ( 3 - メトキシ - 6 - ( 2 - メトキシフェネチル ) ピリダジン - 4 -

イル) エタン-1-オン (0.19 g) をエタノール (4.5 ml)、クロロホルム (4.5 ml) に溶解させた。これに0-イソプロピルヒドロキシルアミン塩酸塩 (0.10 g)、ピリジン (0.07 ml) を加え、室温で終夜攪拌した。

反応液を減圧濃縮し、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) で精製することによって目的物 0.25 g (収率 96%, 二工程) を得た。

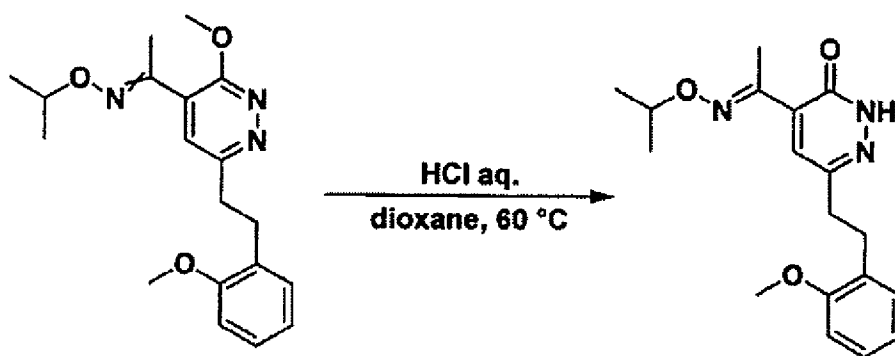
得られた目的物の<sup>1</sup>H-NMRを以下に示す。

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.21-6.94 (m, 3H), 6.89-6.84 (m, 2H), 4.48-4.29 (1H, m), 4.15-4.09 (3H, m), 3.82 (3H, s), 3.19-3.04 (4H, m), 2.15-2.09 (3H, m), 1.31-1.13 (6H, m).

[0290] (工程7)

(E)-4-(1-(イソプロポキシイミノ)エチル)-6-(2-メトキシフェネチル)ピリダジン-3(2H)-オン [(E)-4-(1-(isopropoxyimino)ethyl)-6-(2-methoxyphenethyl)-pyridazin-3(2H)-one] の合成

[0291] [化12]



[0292] 1-(3-メトキシ-6-(2-メトキシフェネチル)ピリダジン-4-イル)エタン-1-オン 0-イソプロピルオキシム (0.12 g) をジオキサン (7 ml) に溶解させた。これに12N塩酸 (0.18 ml) を加え、60°Cで終夜攪拌した。

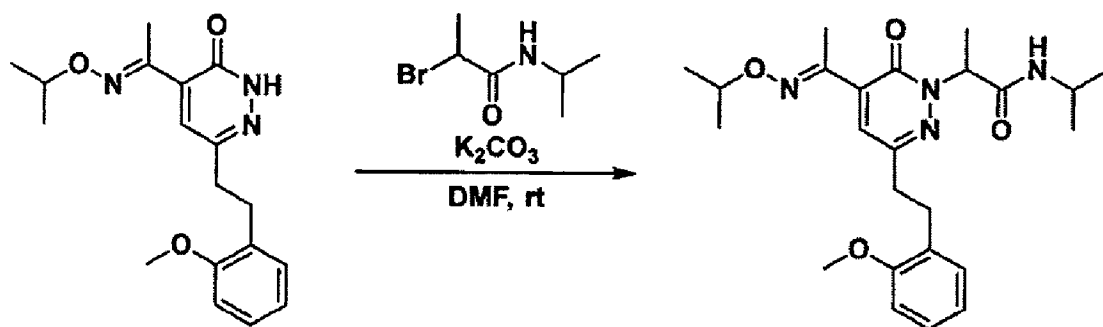
反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、

ろ過した。ろ液を減圧濃縮し、得られた残渣（0.12 g）をそのまま次工程に用いた。

[0293] (工程8)

(E)-2-(5-(1-(イソプロポキシイミノ)エチル)-3-(2-メトキシフェネチル)-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル)-N-イソプロピルプロパンアミド [(E)-2-(5-(1-(isopropoxyimino)ethyl)-3-(2-methoxyphenethyl)-6-oxopyridazin-1(6H)-yl)-N-isopropylpropanamide] の合成

[0294] [化13]



[0295] (E)-4-(1-(イソプロポキシイミノ)エチル)-6-(2-メトキシフェネチル)ピリダジン-3(2H)-オン (0.12 g) をN,N-ジメチルホルムアミド (3 ml) に溶解させた。これに2-ブロモ-N-イソプロピルプロパンアミド (0.08 g)、炭酸カリウム (0.10 g) を加え、室温で終夜撹拌した。

反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過した。ろ液を減圧濃縮し、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) で精製することによって目的物 0.15 g (収率 97%, 二工程) を得た。

得られた目的物の<sup>1</sup>H-NMRを以下に示す。

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.21-7.19 (1H, m), 7.16 (1H, s), 7.10 (1H, q), 6.88-6.83 (2H, m), 6.13 (1H, d), 5.53 (1H, q), 4.48-4.38 (1H, m)

, 4.07-3.98 (1H, m), 3.80 (3H, s), 3.00-2.88 (4H, m), 2.19 (3H, s), 1.56 (3H, d), 1.29 (6H, d), 1.10 (6H, q).

[0296] [実施例2]

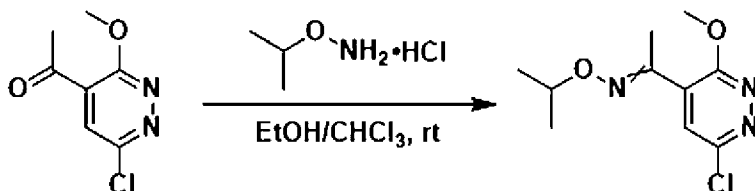
(S,E)-N-(1-(5-(1-(イソプロポキシイミノ)エチル)-3-((2-メトキシベンジル)オキシ)-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル)-3-メチルブタン-2-イル)イソブチルアミド [(S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxyimino)ethyl)-3-((2-methoxybenzyl)oxy)-6-oxopyridazin-1(6H)-yl)-3-methylbutan-2-yl)isobutyramide]

の合成

(工程1)

1-(6-クロロ-3-メトキシピリダジン-4-イル)エタン-1-オン O-イソプロピルオキシム [1-(6-chloro-3-methoxypyridazine-4-yl)ethan-1-one O-isopropyl oxime] の合成

[0297] [化14]



[0298] 1-(6-クロロ-3-メトキシピリダジン-4-イル)エタン-1-オン (1.21 g) をエタノール (30 ml)、クロロホルム (30 ml) に溶解させた。これにO-イソプロピルヒドロキシルアミン塩酸塩 (0.87 g) を加え、室温で終夜攪拌した。

反応液を減圧濃縮し、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) で精製することによって目的物 0.88 g (収率 56%) を得た。

得られた目的物の<sup>1</sup>H-NMRを以下に示す。

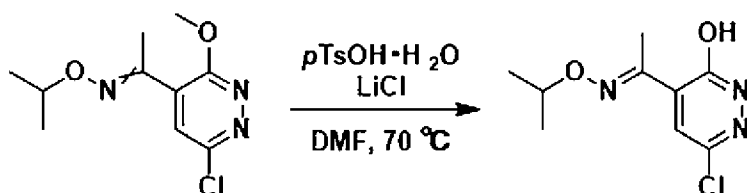
<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.44-7.21 (1H, m), 4.50-4.29 (1H, m), 4.19-4.13 (3H, m), 2.20-2.14 (3H, m), 1.36-1.15 (6H, m).

[0299] (工程2)

(E)-1-(6-クロロ-3-ヒドロキシピリダジン-4-イル)エタン-1-オン

O-イソプロピルオキシム [(E)-1-(6-chloro-3-hydroxypyridazin-4-yl)ethan-1-one O-isopropyl oxime] の合成

[0300] [化15]



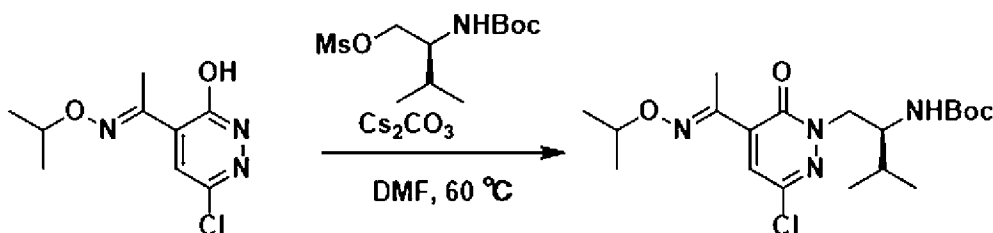
[0301] 1-(6-クロロ-3-メトキシピリダジン-4-イル)エタン-1-オン O-イソプロピルオキシム (0.45 g) を N,N-ジメチルホルムアミド (8 ml) に溶解させた。これにパラトルエンスルホン酸一水和物 (1.76 g)、塩化リチウム (0.39 g) を加え、オイルバス中、70°C で 2 時間攪拌した。

その後、室温まで冷却した後、水と飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた後、ろ過をした。ろ液を減圧濃縮し、得られた粗生成物をそのまま次工程に使用した。

[0302] (工程 3)

Tert-ブチル (S,E)-(1-(3-クロロ-5-(1-イソプロポキシイミノ)エチル)-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル)-3-メチルブタン-2-イル)カーバメート [tert-butyl (S,E)-(1-(3-chloro-5-(1-(isopropoxyimino)ethyl)-6-oxopyridazin-1(6H)-yl)-3-methylbutan-2-yl)carbamate] の合成

[0303] [化16]

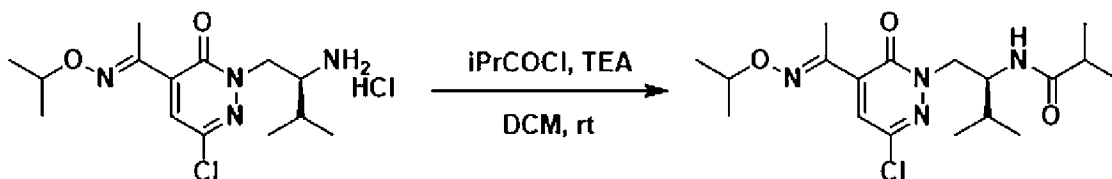


[0304] 工程 2 で得た粗生成物を N,N-ジメチルホルムアミド (8 ml) に溶解させた。これに (S)-2-((tert-ブトキシカルボニル)アミノ)-3-メチルブチルメタ



-(3-chloro-5-(1-(isopropoxyimino)ethyl)-6-oxopyridazin-1(6H)-yl)-3-methylbutan-2-yl)isobutyramide] の合成

[0309] [化18]



[0310] 工程4で得られた粗生成物をジクロロメタン（3 ml）に溶解させた。氷冷下、トリエチルアミン（0.25 g）、イソブチリルクロリド（0.10 g）を順次加え、室温下で30分間攪拌した。

氷冷下、反応液に飽和重曹水を加えた後、ジクロロメタンで抽出した。得られたジクロロメタン層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過をした。得られたろ液を減圧濃縮し、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）で精製することによって目的物0.18 g（収率75%、二工程）を得た。

得られた目的物の<sup>1</sup>H-NMRを以下に示す。

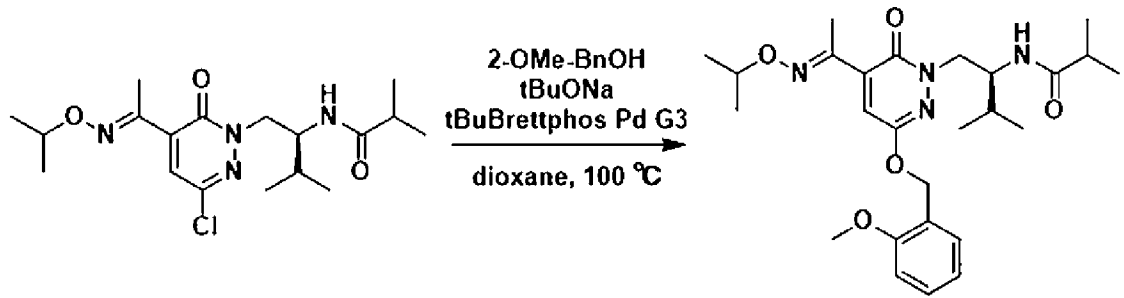
<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.30 (1H, s), 5.78 (1H, d), 4.49-4.38 (1H, m), 4.36-4.27 (2H, m), 4.15-4.01 (1H, m), 2.33-2.22 (1H, m), 2.20 (3H, s), 1.98-1.84 (1H, m), 1.32-1.24 (6H, m), 1.09 (3H, d), 1.04 (3H, d), 1.01 (6H, dd).

[0311] (工程6)

(S,E)-N-(1-(5-(1-(イソプロポキシイミノ)エチル)-3-((2-メトキシベンジル)オキシ)-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル)-3-メチルブタン-2-イル)イソブチルアミド [(S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxyimino)ethyl)-3-((2-methoxybenzyl)oxy)-6-oxopyridazin-1(6H)-yl)-3-methylbutan-2-yl)isobutyramide] の合成

[0312]

[化19]



[0313] (S,E)-N-(1-(3-クロロ-5-(1-(イソプロポキシイミノ)エチル)-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル)-3-メチルブタン-2-イル)イソブチルアミド (0.050 g) を1,4-ジオキサン (2 ml) に溶解させた。ここに、2-メトキシベンジルアルコール (0.040 g)、t-ブトキシナトリウム (0.015 g)、[(2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3,6-ジメトキシ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)-2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]パラジウム(II)メタンスルホン酸 (0.003 g) を加えた後、反応容器内を窒素雰囲気下に置換した。その後オイルバス中、100 °Cで1時間攪拌した。

反応溶液に水と飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた後、ろ過をした。得られたろ液を減圧濃縮し、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) で精製することによって目的物0.016 g (収率25%) を得た。

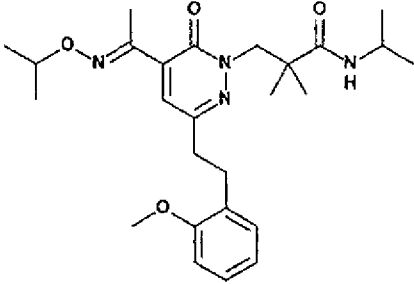
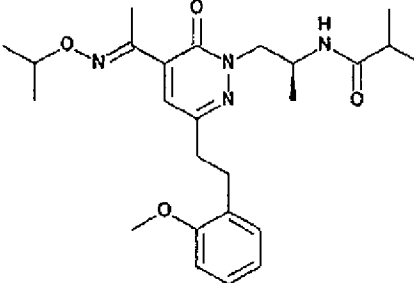
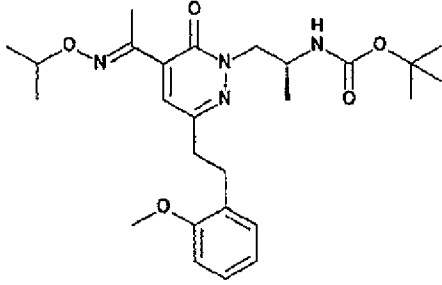
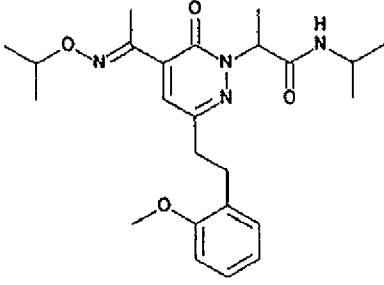
得られた目的物の<sup>1</sup>H-NMRを以下に示す。

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.42 (1H, dd), 7.36 (1H, dt), 7.08 (1H, s), 7.00 (1H, dt), 6.93 (1H, d), 6.21 (1H, d), 5.27 (2H, q), 4.62 (1H, dd), 4.45-4.27 (2H, m), 3.89 (3H, s), 3.79 (1H, dd), 2.33-2.22 (1H, m), 2.19 (3H, s), 1.99-1.88 (1H, m), 1.27 (6H, dd), 1.09 (3H, d), 1.03 (3H, d), 1.01 (6H, d).

[0314] 前記の実施例と同様の方法で製造した本発明のピリダジノン化合物の一部を表1に示す。表中には、各化合物の物性として融点(°C)または物性を併せて示す。



[0315] [表1]

化合物番号	構造式	物性または 融点(°C)
B-1		VISCOUS OIL
B-2		97-102
B-3		VISCOUS OIL
B-4		VISCOUS OIL

[0316] 表中の化合物の一部については、液体クロマトグラフィー質量分析法(LC

MS)における保持時間を示す。

[0317] [表2]

化合物番号	Retention time
B-1	1.78
B-3	2.01
B-4	1.73

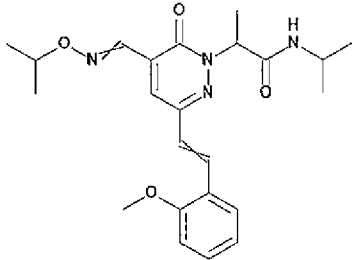
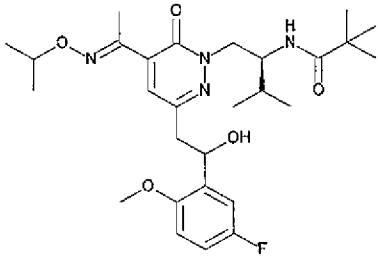
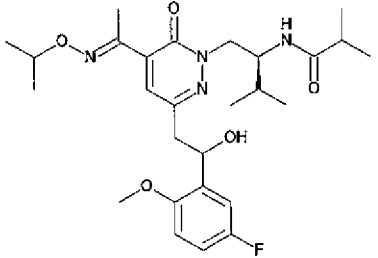
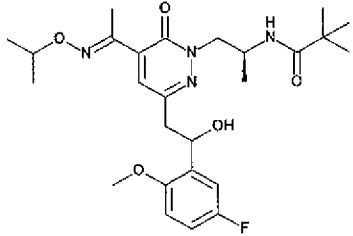
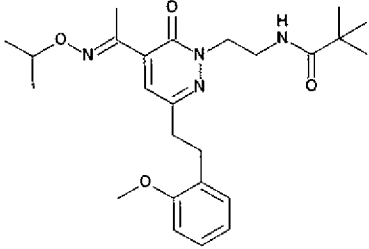
[0318] 分析条件は以下に示す。

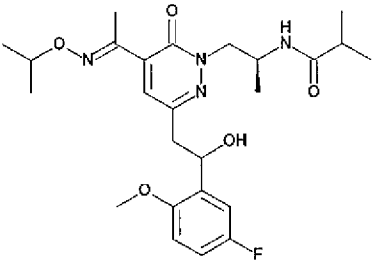
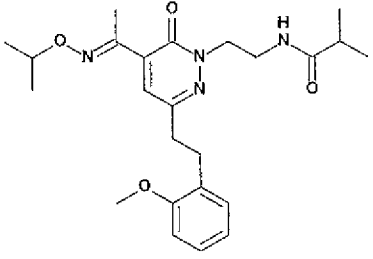
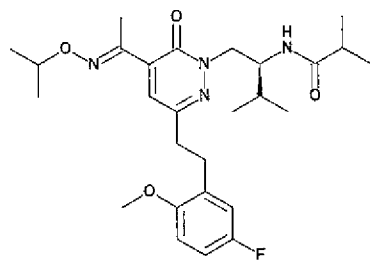
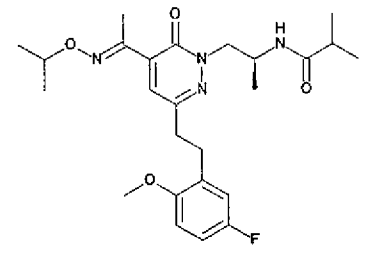
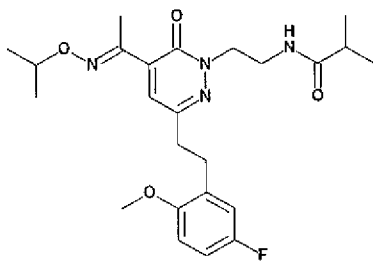
Waters CORTECS UPLC C18カラム (ウォーターズ社製、 $2.1 \times 50$ mm、 $1.6 \mu\text{m}$ ) を、温度  $40^\circ\text{C}$  および流量  $0.6 \text{ mL/分}$ 、 $2 \mu\text{L}$  注入、移動相(A)  $0.1\%$  ギ酸を含む水、移動相(B) アセトニトリルで使用し、保持時間を分単位 (分間) で表した。(I) 泳動は ACQUITY UPLC H-Class (ウォーターズ社製) にて ACQUITY UPLC フォトダイオードアレイ (PDA)  $\lambda$  検出器 (ウォーターズ社製) 及び ACQUITY QDa 検出器 (正及び負イオンエレクトロスプレーモードで、UV PDA 検出、ウォーターズ社製) で行い、移動相(B) の濃度を、 $1.5$  分の直線勾配で  $30$  質量% から  $95$  質量% に上げ、(II)  $0.5$  分間  $95$  質量% で維持し、(III) 直ちに  $30$  質量% (B) に下げ、(IV)  $0.50$  分間  $30$  質量% で維持した。

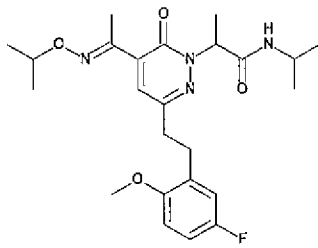
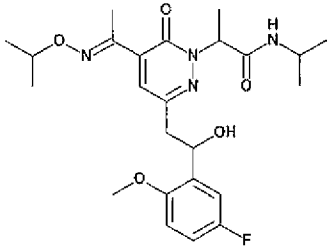
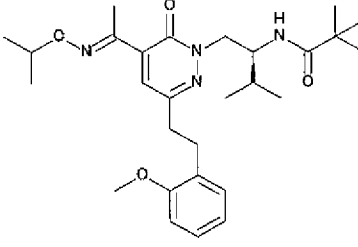
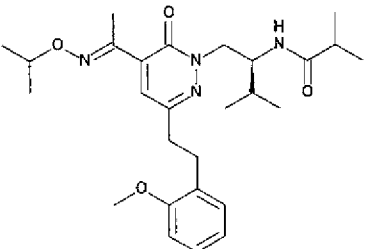
[0319] 前記の実施例と同様の方法で製造した本発明のピリダジノン化合物の一部を表3に示す。表中には、各化合物の物性として融点 ( $^\circ\text{C}$ ) または物性を併せて示す。いくつかの化合物については、異性体混合物であることも示した。

[0320]



<p>B-9</p>		<p>174-181 (E/Z mixture)</p>
<p>B-10</p>		<p>VISCOUS OIL (Diastereomer mixture)</p>
<p>B-11</p>		<p>VISCOUS OIL (Diastereomer mixture)</p>
<p>B-12</p>		<p>VISCOUS OIL (Diastereomer mixture)</p>
<p>B-13</p>		<p>VISCOUS OIL</p>

B-14		VISCIOUS OIL (Diastereomer mixture)
B-15		VISCIOUS OIL
B-16		107-112
B-17		86-88
B-18		VISCIOUS OIL

B-19		VISCOUS OIL
B-20		VISCOUS OIL (Diastereomer mixture)
B-21		VISCOUS OIL
B-22		92-95

[0321] 表中の化合物の一部については、液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間を示す。

液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)の分析条件は以下に示す。

Waters CORTECS UPLC C18カラム (ウォーターズ社製、 $2.1 \times 50$  mm、 $1.6 \mu\text{m}$ ) を、温度  $40^\circ\text{C}$  および流量  $0.6$  mL/分、 $2 \mu\text{L}$  注入、移動相(A)  $0.1\%$  ギ酸を含む水、移動相(B)アセトニトリルで使用し、保持時間を分単位(分間)で表した。

(I)泳動はACQUITY UPLC H-Class (ウォータース社製)にてACQUITY UPLCフォトダイオードアレイ (PDA) eλ検出器 (ウォータース社製) 及びACQUITY QDa 検出器(正及び負イオンエレクトロスプレーモードで、UV PDA検出、ウォータース社製)で行い、以下に示すMethod (A)またはMethod (B)の方法を用いた。

Method (A) :

移動相(B)の濃度を30質量%で0.15分維持し、その後1.35分の直線勾配で30質量%から95質量%に上げ、(II)0.5分間95質量%で維持し、(III)直ちに30質量%(B)に下げ、(IV)0.50分間30質量%で維持した。

Method (B) :

移動相(B)の濃度を30質量%で0.15分維持し、その後0.85分の直線勾配で30質量%から95質量%に上げ、(II)1.0分間95質量%で維持し、(III)直ちに30質量%(B)に下げ、(IV)0.50分間30質量%で維持した。

[0322] [表4]

化合物番号	Retention time	Method
B-5	1.89, 1.90	Method(A)
B-6	1.98	Method(A)
B-8	1.46	Method(A)
B-10	1.84	Method(A)
B-11	1.72	Method(A)
B-12	1.76	Method(B)
B-13	1.86	Method(B)
B-14	1.66	Method(B)
B-15	1.49	Method(B)
B-18	1.73	Method(B)
B-19	1.8	Method(B)
B-20	1.63	Method(A)
B-21	2.07	Method(A)

[0323] 前記の実施例と同様の方法で製造した本発明のピリダジノン化合物の一部を表5に示す。表中には、各化合物の物性として融点(°C)または物性を併

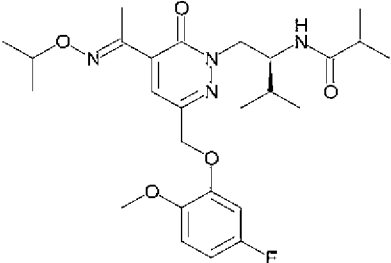
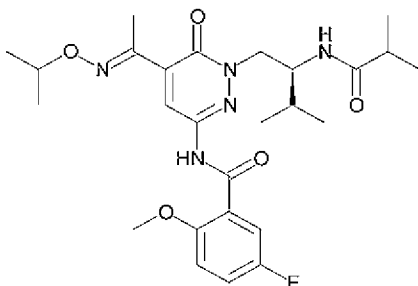
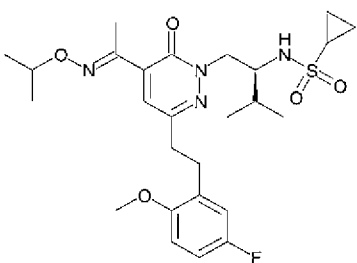
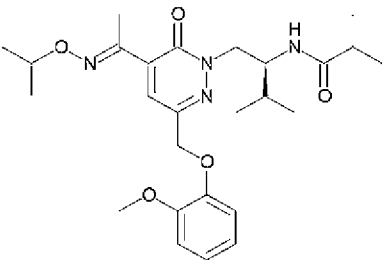
せて示す。いくつかの化合物については、異性体混合物であることも示した

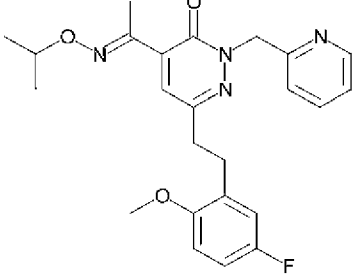
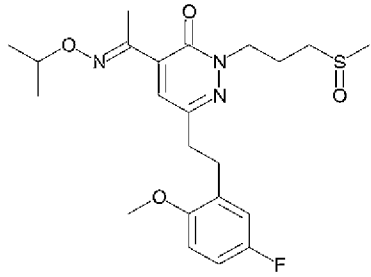
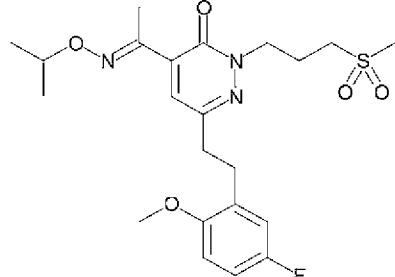
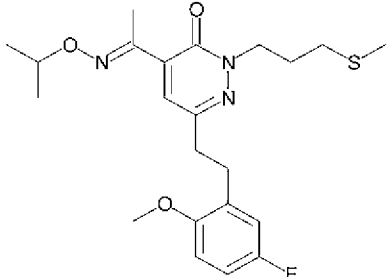
。

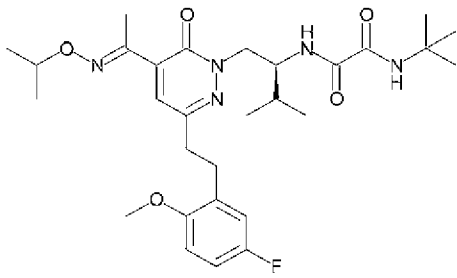
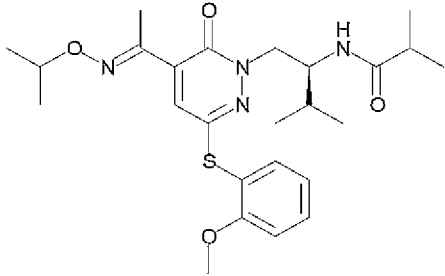
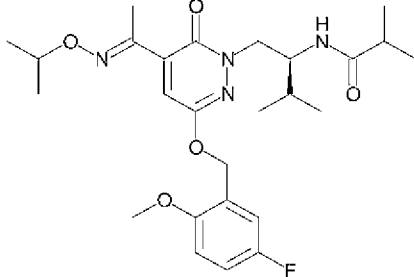
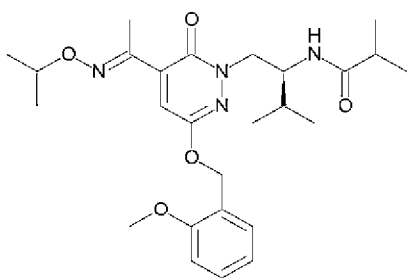
[0324]

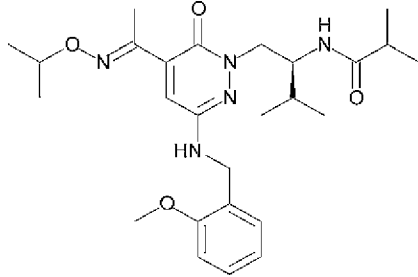
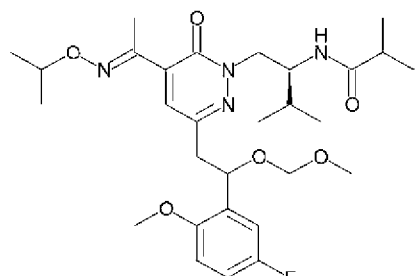
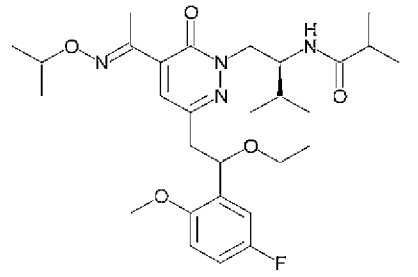
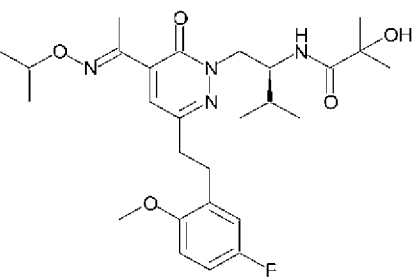


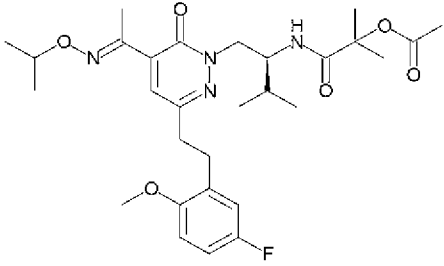
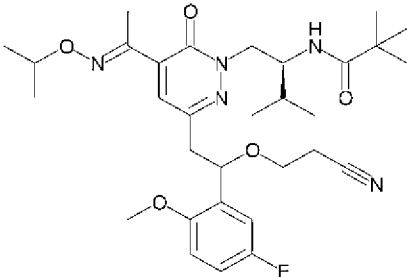
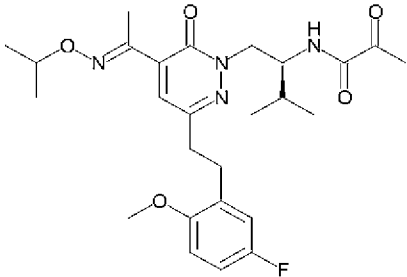
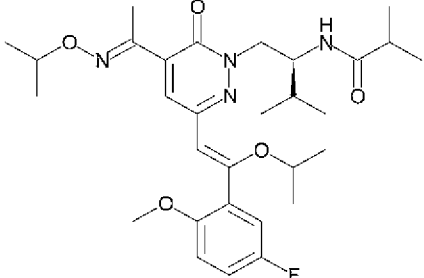
[表5]

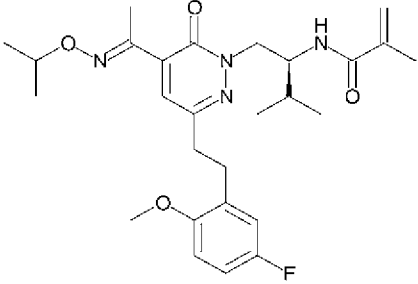
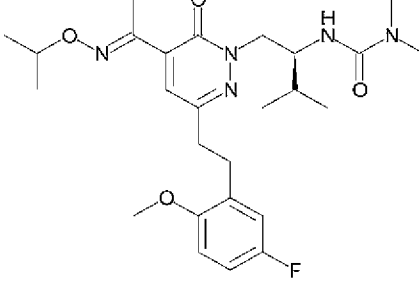
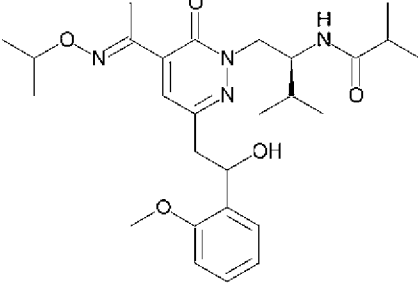
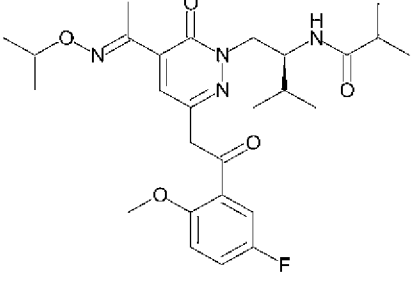
化合物番号	構造式	物性または融点 (°C)
B-23		AMORPHOUS
B-24		69-72
B-25		VISCIOUS OIL
B-26		VISCIOUS OIL

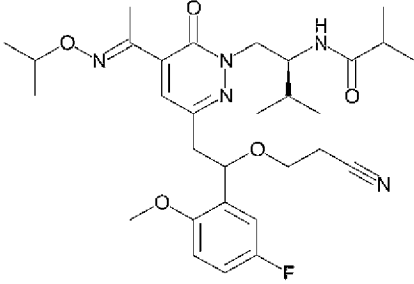
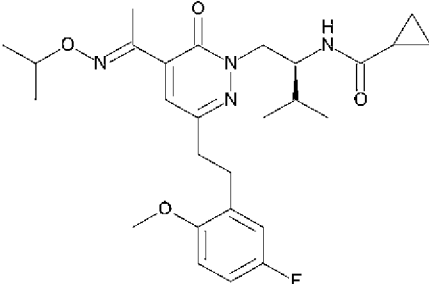
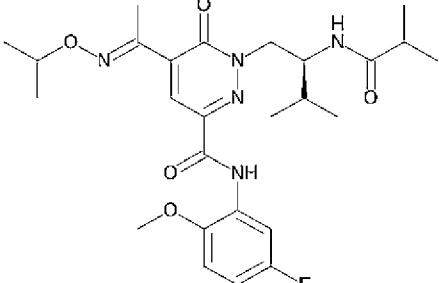
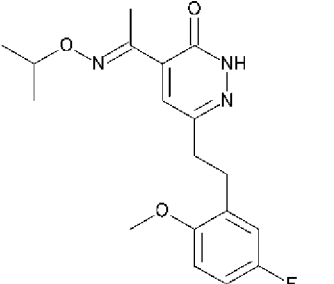
B-27		VISCOUS OIL
B-28		VISCOUS OIL
B-29		VISCOUS OIL
B-30		VISCOUS OIL

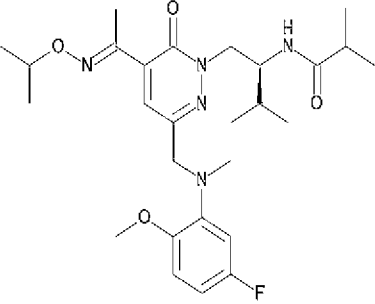
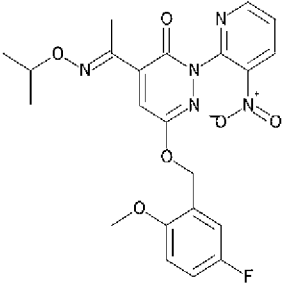
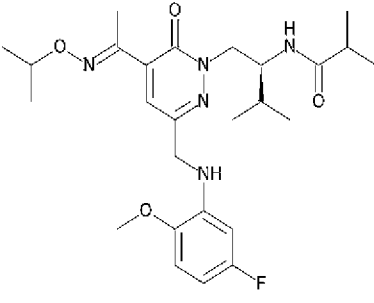
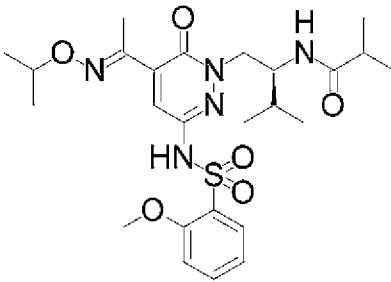
B-31	 <p>Chemical structure of B-31: A pyrimidinone core substituted with a tert-butyl oxime ether, a methyl group, and a (1S,2S)-2-amino-1-methylpropan-1-yl group. The 4-position of the pyrimidinone ring is linked via a methylene group to a 3-fluoro-4-methoxyphenyl ring.</p>	103-105
B-32	 <p>Chemical structure of B-32: A pyrimidinone core substituted with a tert-butyl oxime ether, a methyl group, and a (1S,2S)-2-amino-1-methylpropan-1-yl group. The 4-position of the pyrimidinone ring is linked via a methylene group to a 3-methoxyphenyl ring.</p>	106-108
B-33	 <p>Chemical structure of B-33: A pyrimidinone core substituted with a tert-butyl oxime ether, a methyl group, and a (1S,2S)-2-amino-1-methylpropan-1-yl group. The 4-position of the pyrimidinone ring is linked via a methylene ether group to a 3-fluoro-4-methoxyphenyl ring.</p>	VISCIOUS OIL
B-34	 <p>Chemical structure of B-34: A pyrimidinone core substituted with a tert-butyl oxime ether, a methyl group, and a (1S,2S)-2-amino-1-methylpropan-1-yl group. The 4-position of the pyrimidinone ring is linked via a methylene ether group to a 3-methoxyphenyl ring.</p>	VISCIOUS OIL

B-35		VISCIOUS OIL
B-36		VISCIOUS OIL (Diastereomer mixture)
B-37		VISCIOUS OIL (Diastereomer mixture)
B-38		VISCIOUS OIL

B-39		VISCOUS OIL
B-40		VISCOUS OIL (Diastereomer mixture)
B-41		VISCOUS OIL
B-42		VISCOUS OIL

B-43		VISCOUS OIL
B-44		VISCOUS OIL
B-45		VISCOUS OIL (Diastereomer mixture)
B-46		VISCOUS OIL

B-47		VISCOUS OIL (Diastereomer mixture)
B-48		122-125
B-49		218-220
B-50		112-116

B-51		VISCOUS OIL
B-52		139-142
B-53		VISCOUS OIL
B-54		-

[0325] 表中の化合物の一部については、液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間を表6に示す。

液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)の分析条件は先に挙げたMethod (A)に、加え以下に示すMethod (C)も用いた。



## Method (C) :

HPLCシステムとしてWaters Alliance e2695セパレーションモジュール、シングル四重極MS検出器 (LC/MS)としてSQ Detector 2(大気圧化学イオン化モードで、PDA検出、ウォーターズ社製)、HPLC/UHPLC検出器として2998 PDA Photodiode Array Detector (ウォーターズ社製)をそれぞれ使い、カラムとしてXBridgeBEH C18 (ウォーターズ社製、2.1×50mm、2.5μm)をセットし、温度40℃に設定した。移動相(A)として0.1%ギ酸を含む水、移動相(B)としてアセトニトリルを用い、移動相(A)と移動相(B)とを下記濃度にて流量0.4mL/分でカラムに通し、試料注入量6μLにて、試料の保持時間(分)を計測した。

なお、移動相(B)のカラム入口濃度は、30質量%で試料注入時から0.3分間維持し、次いで1.7分間かけて30質量%から95質量%に定速度で上げ、95質量%で1.5分間維持し、その後30質量%に一気に下げ、30質量%で2.5分間維持した。

[0326]

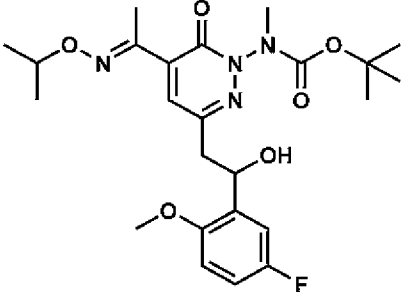
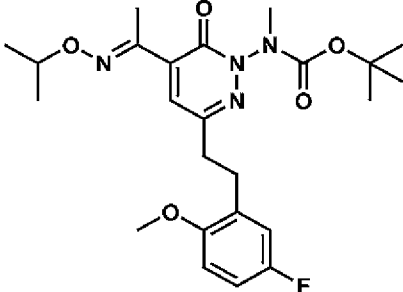
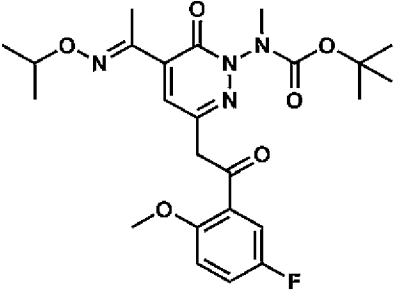
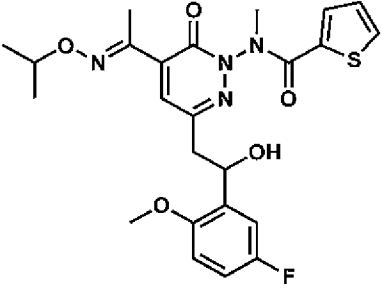
[表6]

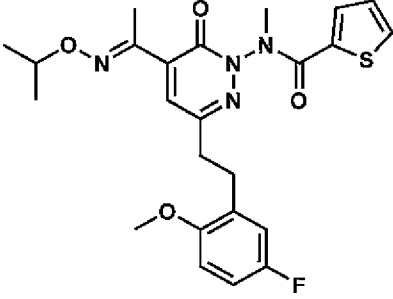
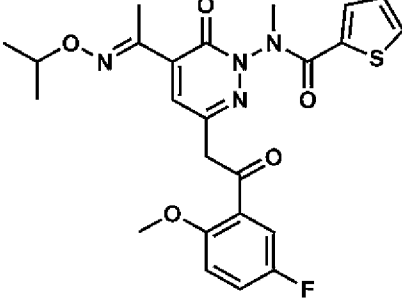
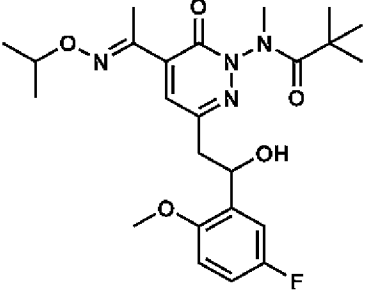
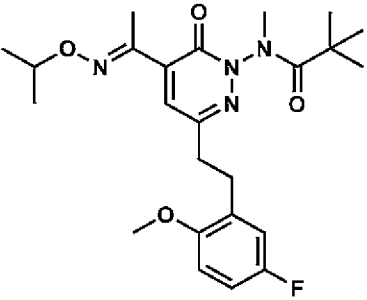
化合物番号	Retention time	Method
B-23	1.78	Method(A)
B-25	1.9	Method(A)
B-26	1.74	Method(A)
B-27	4.12	Method(C)
B-28	3.75	Method(C)
B-29	3.99	Method(C)
B-30	4.57	Method(C)
B-33	1.89	Method(A)
B-34	1.89	Method(A)
B-35	1.73	Method(A)
B-36	1.71,1.73	Method(A)
B-37	2.01	Method(A)
B-38	1.77	Method(A)
B-39	1.95	Method(A)
B-40	4.18,4.38	Method(C)
B-41	1.92	Method(A)
B-42	2.07	Method(A)
B-43	1.92	Method(A)
B-44	1.82	Method(A)
B-45	1.66,1.68	Method(A)
B-46	1.73	Method(A)
B-47	1.76,1.78	Method(A)
B-51	1.94	Method(A)
B-53	1.83	Method(A)
B-54	1.56	Method(A)

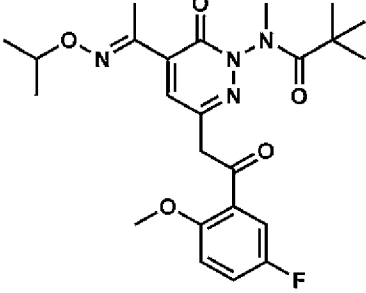
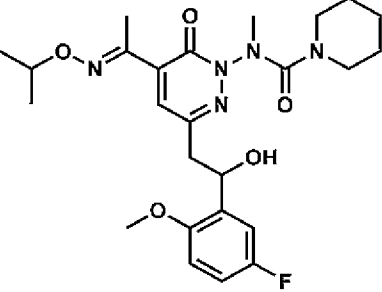
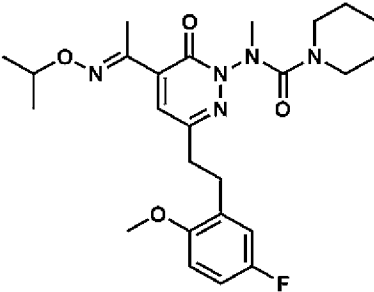
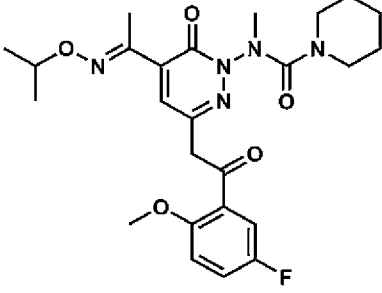
[0327] 前記の実施例と同様の方法で製造した本発明のピリダジノン化合物の一部を表7に示す。表中のいくつかの化合物については、その物性を併せて示す。いくつかの化合物については、異性体混合物であることも示した。

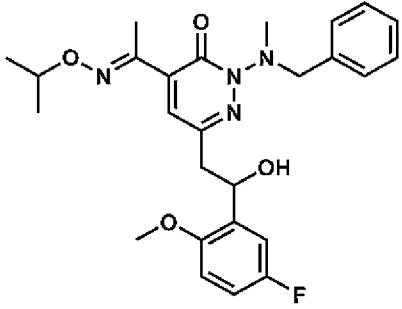
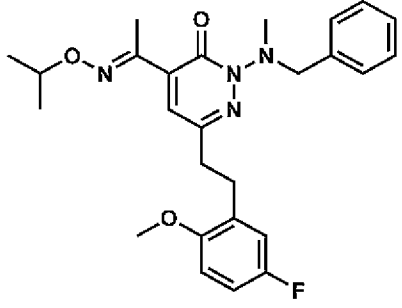
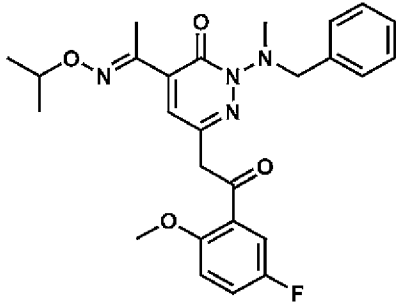
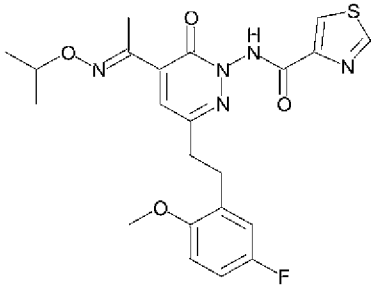
[0328]

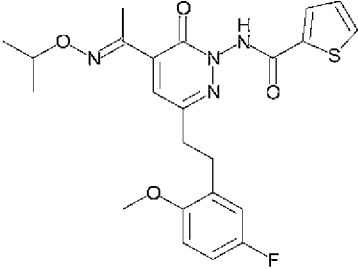
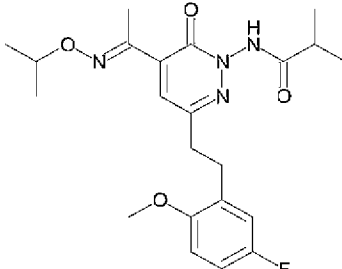
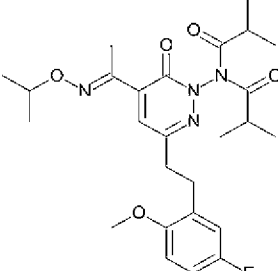
[表7]

化合物番号	構造式	物性または 融点 (°C)
C-1		-
C-2		-
C-3		-
C-4		-

C-5		—
C-6		—
C-7		—
C-8		—

C-9		—
C-10		—
C-11		—
C-12		—

C-13	 <chem>CC(C)OC=C1C(=O)N(CCN1Cc2cc(F)cc(OC)c2)C=C1Cc3cc(F)cc(OC)c3O</chem>	—
C-14	 <chem>CC(C)OC=C1C(=O)N(CCN1Cc2cc(F)cc(OC)c2)C=C1Cc3cc(F)cc(OC)c3</chem>	—
C-15	 <chem>CC(C)OC=C1C(=O)N(CCN1Cc2cc(F)cc(OC)c2)C=C1Cc3cc(F)cc(OC)c3C(=O)O</chem>	—
C-16	 <chem>CC(C)OC=C1C(=O)N(CCN1Cc2cc(F)cc(OC)c2)C=C1Cc3cc(F)cc(OC)c3C(=O)Nc4ccsn4</chem>	VISCIOUS OIL

C-17		VISCOUS OIL
C-18		VISCOUS OIL (E/Z mixture)
C-19		AMORPHOUS (E/Z mixture)

[0329] 表中の化合物の一部については、液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間を表8に示す。

液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)の分析条件は先に挙げたMethod (A)を用いた。

[0330] [表8]

化合物番号	Retention time	Method
C-16	1.65	Method(A)
C-17	1.72	Method(A)
C-18	1.61,1.65	Method(A)
C-19	2.16	Method(A)

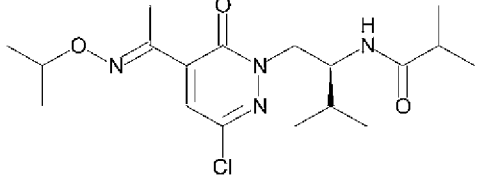
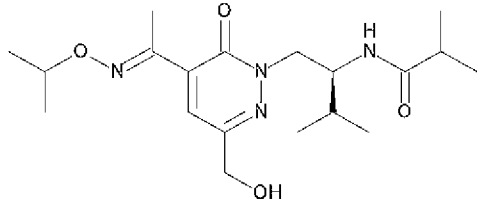
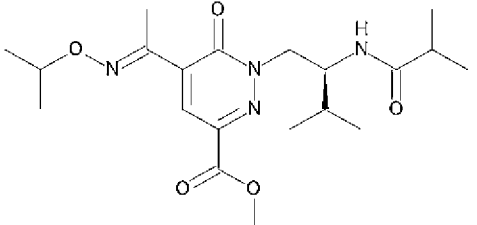
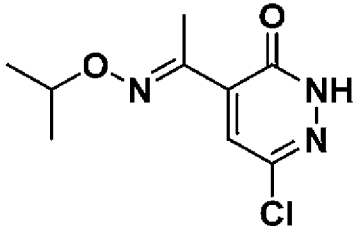
[0331] また、本発明のピリダジノン化合物を調製する上で、製造中間体となりう

る化合物の一部を表 9 に示す。表中には、各化合物の物性として融点 (°C) を併せて示す。

[0332]



[表9]

化合物番号	構造式	物性または融点 (°C)
D-1		109-110
D-2		122-123
D-3		134-140
D-4		

[0333] [生物試験]

本発明のピリダジノン化合物が、農園芸用殺菌剤の有効成分として有用であることを以下の試験例で示す。

(試験用乳剤の調製)

本発明のピリダジノン化合物 5 重量部、N，N-ジメチルホルムアミド 93.5 重量部、およびポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート (TWEEN (登録商標) 20) 1.5 重量部を混合し、溶解させて、有効成分 5% の乳剤(1)を得た。

[0334] 防除価は、下記の式により計算した。

[0335] [数 1]

$$\text{防除価 (\%)} = 100 - \{ \text{処理区における病斑面積率} / \text{無処理区における病斑面積率} \} \times 100$$

[0336] (試験例 1) リンゴ黒星病防除試験

乳剤(1)にピリダジノン化合物の濃度が 125 ppm になるように水を加え、溶解させて薬剤溶液を得た。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、前記薬剤溶液を散布した。風乾後、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、薬剤溶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℃ の温室に静置した。

接種から 2 週間経過した日にリンゴ幼苗の葉を目視観察して、病斑面積率を求め、防除価を算出した。

B-1、B-2、B-3、B-4、B-5、B-6、B-7、B-8、B-10、B-11、B-12、B-13、B-14、B-15、B-16、B-17、B-18、B-19、B-20、B-21、B-22、B-23、B-24、B-25、B-26、B-27、B-28、B-29、B-30、B-31、B-33、B-34、B-36、B-37、B-38、B-39、B-40、B-41、B-42、B-43、B-44、B-45、B-46、B-47、B-48、B-49、C-16、C-17、C-18、および C-19 の化合物の化合物について、リンゴ黒星病防除試験を行った。いずれの化合物も 75% 以上の防除価を示した。

[0337] (試験例 2) キュウリ灰色かび病防除試験

乳剤(1)にピリダジノン化合物の濃度が 125 ppm になるように水を

加え、溶解させて薬剤溶液を得た。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、前記薬剤溶液を散布した。風乾後、キュウリ灰色かび病菌（*Botrytis cinerea*）の分生孢子懸濁液を滴下接種した（処理区）。対照として、薬剤溶液を散布しなかったキュウリ幼苗に上記と同じ方法で滴下接種した（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、病斑面積率を求め、防除価を算出した。

B-2、B-4、B-5、B-10、B-11、B-17、B-33、B-36、B-37、B-39、B-40、B-47、C-16、およびC-17の化合物について、キュウリ灰色かび病防除試験を行った。75%以上の防除価を示した。

#### [0338]（試験例3）コムギうどんこ病防除試験

乳剤（1）にピリダジノン化合物の濃度が125ppmになるように水を加え、溶解させて薬剤溶液を得た。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）に前記薬剤溶液を散布した。風乾後、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、薬剤溶液を散布しなかったコムギ幼苗に上記と同じ方法で接種した（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、防除価を算出した。

B-5、B-6、B-8、B-9、B-10、B-11、B-12、B-13、B-14、B-15、B-16、B-17、B-18、B-19、B-20、B-21、B-22、B-23、B-24、B-25、B-26、B-27、B-28、B-33、B-34、B-36、B-37、B-38、B-39、B-40、B-41、B-42、B-43、B-44、B-45、B-46、B-47、B-48、C-17、およびD-3の化合物について、コムギうどんこ病防除試験を行った。いずれの化合物も75%以上の防除価を示した。

#### [0339]（試験例4）コムギ赤さび病防除試験

乳剤（1）にピリダジノン化合物の濃度が125ppmになるように水を加え、溶解させて薬剤溶液を得た。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)に前記薬剤溶液を散布した。風乾後、薬剤溶液を散布し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(処理区)。対照として、薬剤溶液を散布しなかったコムギ幼苗に上記と同様にして接種した(無処理区)。それらを20℃の温室に静置した。

接種から12日間経過した日にコムギ苗の葉を目視観察して、病斑面積率を求め、防除価を算出した。

B-4、B-5、B-36、B-37、B-40、およびB-47の化合物について、コムギ赤さび病防除試験を行った。この化合物は75%以上の防除価を示した。

#### [0340] 〔抗菌試験〕

(試験例) *Fusarium graminearum* に対する抗菌試験  
グルコースを添加した Minimal SD Base 培地に *Fusarium graminearum* の胞子を添加して分散させ、さらにジメチルスルホキシドに溶解したピリダジノン化合物を25ppmとなるように添加混合し、これらを96穴マイクロプレート上に分注し、暗所、25℃で3日間培養した。培養後、マイクロプレートリーダーで波長405nmにおける濁度を測定し、無処理の場合と比較して *Fusarium graminearum* の生育阻害率(%)を求めた。

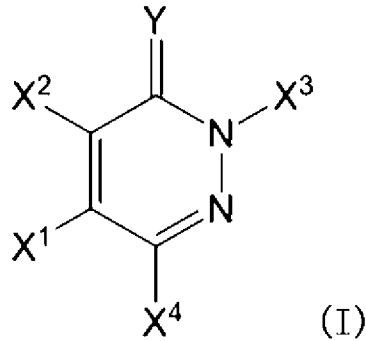
その結果、下記の化合物が50%以上の優れた生育阻害率を示した。

化合物番号：B-1、B-2、B-3、B-4、B-5、B-6、B-7、B-8、B-9、B-10、B-11、B-12、B-13、B-14、B-15、B-16、B-17、B-18、B-19、B-20、B-21、B-22、B-24、B-25、B-26、B-27、B-28、B-29、B-30、B-33、B-34、B-36、B-37、B-38、B-39、B-40、B-41、B-43、B-44、B-45、B-46、B-47、B-50、B-53、C-16、C-17、C-18、C-19。

## 請求の範囲

[請求項1] 式(1)で表される化合物またはその塩。

[化1]



[式(1)中、

Yは、酸素原子または硫黄原子を示し；

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルホニル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、R<sup>1</sup>-CO-で表される基、カルボキシ基、R<sup>2</sup>-O-CO-で表される基、R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-で表される基、R<sup>3</sup>R<sup>4</sup>N-CO-で

表される基、 $R^1-CO-O-$ で表される基、 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2-O-CO-O-$ で表される基、 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基、 $R^1O-N=CR^6-$ で表される基、 $R^3R^4N-N=CR^6-$ で表される基、または $R^1-N=CR^6-$ で表される基を示し；

$R^1$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^2$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^3$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^4$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示し、

ここで、 $R^3$ と $R^4$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

$R^5$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～

6アルキル基、または置換若しくは無置換のC6～10アリール基を示し、

R<sup>6</sup>は、ハロゲン基、アミノ基、置換若しくは無置換のモノC1～6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のジC1～6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のC1～6アルキル基、置換もしくは無置換の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、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し；

X<sup>3</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C1～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C2～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C2～6アルキニル基、R<sup>1</sup>-CO-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C6～10アリール基、置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基、R<sup>N1</sup>O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-O-で表される基、R<sup>N1</sup>-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-O-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N2</sup>N-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-CO-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-O-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CO-CO-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>R<sup>N1</sup>N-CS-NR<sup>N2</sup>-で表される基、R<sup>N1</sup>SO<sub>2</sub>-NR<sup>N2</sup>-で表される基、またはR<sup>N1</sup>-C(=NR<sup>N1</sup>)-NR<sup>N2</sup>-で表される基を示し、

R<sup>N1</sup>、およびR<sup>N2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C1～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C2～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖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C6～10アリール基、または置換若しくは無置換の4～6員環

のヘテロシクリル基を示し、ここで、 $R^{N1}$ と $R^{N1}$ 、または $R^{N1}$ と $R^{N2}$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく；

$X^4$ は、 $Q-A-$ で表される基、 $Q-A-B-$ で表される基、 $Q-B-A-$ で表される基、 $Q-SO_2-NR^{N3}-$ で表される基、 $Q-C(R^7)=N-$ で表される基、 $Q-NR^{N3}-SO_2-$ で表される基、 $Q-N=C(R^7)-$ で表される基、または $Q-B-$ で表される基を示し、

$A$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換の $C1\sim6$ アルキレン基、置換若しくは無置換の $C2\sim6$ アルケニレン基、置換若しくは無置換の $C2\sim6$ アルキニレン基、置換若しくは無置換の $C3\sim6$ シクロアルキレン基、またはカルボニル基を示し、

$B$ は、それぞれ独立に、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、または $-NR^{N3}-$ で表される基を示し、 $R^{N3}$ は、水素原子、置換若しくは無置換の $C1\sim6$ アルキル基、ホルミル基、または置換若しくは無置換の $C1\sim6$ アルキルカルボニル基を示し、

$R^7$ は、水素原子、または置換若しくは無置換の $C1\sim6$ アルキル基を示し、

$Q$ は、置換若しくは無置換の $C6\sim10$ アリール基、または置換若しくは無置換の $5\sim10$ 員環のヘテロシクリル基を示す。]

[請求項2]  $X^2$ が、 $R^1O-N=C R^6-$ で表される基である、請求項1に記載の化合物またはそれらの塩。

[請求項3] 請求項1または2に記載の化合物、およびそれら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4] 種子処理用である、請求項3に記載の農園芸用殺菌剤。

[請求項5] 請求項1または2に記載の化合物、およびそれら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殺線虫剤。

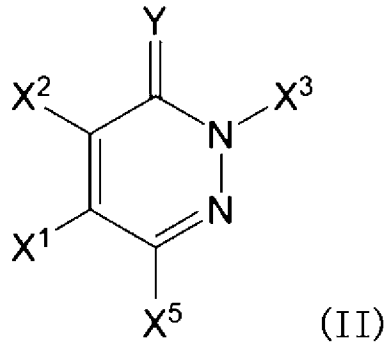
[請求項6] 請求項1または2に記載の化合物、およびそれらの塩からなる群か



ら選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する医療用・動物用抗真菌剤。

[請求項7] 式 (II) で表される化合物またはその塩。

[化2]



[式 (II) 中、

Yは、酸素原子または硫黄原子を示し；

X<sup>1</sup>およびX<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、水酸基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニルオキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルスルホニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキルオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールオキシ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールチオ基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルフィニル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリールスルホニル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基、置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、R<sup>1</sup>-CO-で表される基、カルボキシ基、R<sup>2</sup>-O-C

O-で表される基、 $R^3R^4N-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-$ で表される基、 $R^1-CO-O-$ で表される基、 $R^1-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2-O-CO-O-$ で表される基、 $R^2-O-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-O-$ で表される基、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ で表される基、 $R^2SO_2-NR^5-$ で表される基、 $R^3R^4N-SO_2-$ で表される基、 $R^1O-N=CR^6-$ で表される基、 $R^3R^4N-N=CR^6-$ で表される基、または $R^1-N=CR^6-$ で表される基を示し；

$R^1$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^2$ は、それぞれ独立に、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^3$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し、

$R^4$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示し、

ここで、 $R^3$ と $R^4$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく、

$R^5$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 6～10アリール基を示し、

$R^6$ は、ハロゲン基、アミノ基、置換若しくは無置換のモノC 1～6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のジC 1～6アルキルアミノ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換もしくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルチオ基、または置換若しくは無置換の5～6員環のヘテロシクリル基を示し；

$X^3$ は、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C 1～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルキニル基、 $R^1-CO-$ で表される基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 6～10アリール基、置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基、 $R^{N1}O-$ で表される基、 $R^{N1}-CO-O-$ で表される基、 $R^{N1}-O-CO-O-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CO-O-$ で表される基、 $R^{N1}-CS-O-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CS-O-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N2}N-$ で表される基、 $R^{N1}-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}-CO-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}-O-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CO-CO-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}-CS-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}R^{N1}N-CS-NR^{N2}-$ で表される基、 $R^{N1}SO_2-NR^{N2}-$ で表される基、または $R^{N1}-C(=NR^{N1})-NR^{N2}-$ で表される基を示し、

$R^{N1}$ 、および $R^{N2}$ は、それぞれ独立に、水素原子、置換若しくは無置換の直鎖C 1～6アルキル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルケニル基、置換若しくは無置換の直鎖C 2～6アルキニル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置

換のC 6～10アリール基、または置換若しくは無置換の4～6員環のヘテロシクリル基を示し、ここで、 $R^{N1}$ と $R^{N1}$ 、または $R^{N1}$ と $R^{N2}$ は、一緒になって二価の有機基を形成してもよく；

$X^5$ は、 $HO-A-$ で表される基、C 1～6アルコキシカルボニル基、またはハロゲノ基を示し、

Aは、置換若しくは無置換のC 1～6アルキレン基、置換若しくは無置換のC 2～6アルケニレン基、置換若しくは無置換のC 2～6アルキニレン基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキレン基、またはカルボニル基を示す。]

[請求項8]

$X^2$ が、 $R^1O-N=C R^6-$ で表される基である、請求項7に記載の化合物またはそれらの塩。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2022/024872

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
<p><b>C07D 237/14</b>(2006.01)i; <b>A01N 43/58</b>(2006.01)i; <b>A01N 47/12</b>(2006.01)i; <b>A01P 3/00</b>(2006.01)i; <b>A01P 5/00</b>(2006.01)i; <b>A61K 31/50</b>(2006.01)i; <b>A61P 31/10</b>(2006.01)i; <b>C07D 237/16</b>(2006.01)i; <b>C07D 237/22</b>(2006.01)i; <b>C07D 237/24</b>(2006.01)i; <b>C07D 401/04</b>(2006.01)i; <b>C07D 409/12</b>(2006.01)i; <b>C07D 417/12</b>(2006.01)i</p> <p>FI: C07D237/14 CSP; A01N43/58 B; A01N47/12 102; A01P3/00; A01P5/00; A61K31/50; A61P31/10; C07D237/16; C07D237/22; C07D237/24 CSP; C07D401/04; C07D409/12; C07D417/12</p> <p>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC</p>		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
C07D237/14; A01N43/58; A01N47/12; A01P3/00; A01P5/00; A61K31/50; A61P31/10; C07D237/16; C07D237/22; C07D237/24; C07D401/04; C07D409/12; C07D417/12		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
<p>Published examined utility model applications of Japan 1922-1996</p> <p>Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2022</p> <p>Registered utility model specifications of Japan 1996-2022</p> <p>Published registered utility model applications of Japan 1994-2022</p>		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)		
JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII); CAplus/REGISTRY (STN)		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Youji Huaxue. 2005, 25(4), 445-448 p. 446, scheme 1, p. 448, table 1	1, 3, 4
A		2, 5, 6-8
X	Nippon Nogei Kagaku Kaishi. 1983, 57(5), 445-52 p. 447, table I, p. 448, table II, p. 449, table III, p. 450, table IV	1, 3, 4
A		2, 5, 6-8
X	JP 47-19035 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS, INC.) 19 September 1972 (1972-09-19) page 3, table 1	1, 3, 4
A		2, 5, 6-8
X	JP 48-10234 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS, INC.) 08 February 1973 (1973-02-08) page 3, table 1	1, 3, 4
A		2, 5, 6-8
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
<p>* Special categories of cited documents:</p> <p>“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date</p> <p>“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)</p> <p>“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“&amp;” document member of the same patent family</p>		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
30 August 2022		13 September 2022
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.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2022/024872

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 8-291147 A (ROHM & HAAS CO.) 05 November 1996 (1996-11-05) tables 1-4 with Y of non-single bond	1, 3, 4
A		2, 5, 6-8
X	JP 8-225540 A (ROHM & HAAS CO.) 03 September 1996 (1996-09-03) table 1, examples 7-19, etc.	1, 3, 4
A		2, 5, 6-8
X	JP 2012-526123 A (DOW AGROSCIENCES LLC) 25 October 2012 (2012-10-25) particularly, compounds 404, 405	1, 5
A		2-4, 6-8
X	International Journal of Pharma and Bio Sciences. 2019, 10(1), 127-140, DOI 10.22376/ijpbs.2019.10.1.p127-140 p. 129, compounds 2a-2k	1, 6
A		2-5, 7-8
X	Journal of Heterocyclic Chemistry. 2007, 44(6), 1333-1337, DOI 10.1002/jhet.5570440615 p. 1335, table 1, compounds 10a, 10b, 13a, 13c	1, 6
A		2-5, 7-8
X	Journal of Medicinal Chemistry. 1995, 38(14), 2628-48, DOI 10.1021/jm00014a016 p. 2635, compounds 20h, 22h	1, 6
A		2-5, 7-8
X	Liebigs Annalen der Chemie. 1990, (3), 293-6, DOI 10.1002/jlac.199019900153 p. 294, compound 10	7-8
A		1-6
X	Database Registry [online]. Retrieved from STN, 14 July 2004, RN 709638-59-5. Ethyl 4-amino-1,6-dihydro-5-[(hydroxyamino)iminomethyl]-1-(4-methoxyphenyl) -6-oxo-3-pyridazinecarboxylate. particularly, Ca index name	7-8
A		1-6

**Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

Document 1: Youji Huaxue. 2005, 25 (4), pp. 445-448, page 446, scheme 1, page 448, table 1

Document 2: Nippon Nogei Kagaku Kaishi. 1983, 57 (5), pp. 445-52, page 447, table I, page 448, table II, page 449, table III, page 450, table IV

Document 3: JP 47-19035 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS, INC.) 19 September 1972 (1972-09-19), page 3, table 1

Document 4: JP 48-10234 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS, INC.) 08 February 1973 (1973-02-08), page 3, table 1

Document 5: JP 8-291147 A (ROHM AND HAAS CO.) 05 November 1996 (1996-11-05), compounds in tables 1-4, wherein Y is not a single bond

Document 6: JP 8-225540 A (ROHM AND HAAS CO.) 03 September 1996 (1996-09-03), table 1, example 7-19, etc.

Document 7: JP 2012-526123 A (DOW AGROSCIENCES LLC.) 25 October 2012 (2012-10-25), compounds 404, 405

Document 8: International Journal of Pharma and Bio Sciences. 2019, 10 (1), pp. 127-140, DOI 10.22376/ijpbs.2019.10.1.p127-140, page 129, compounds 2a-2k

Document 9: Journal of Heterocyclic Chemistry. 2007, 44 (6), pp. 1333-1337, DOI 10.1002/jhet.5570440615, page 1335, table 1, compounds 10a, 10b, 13a, 13c

Document 10: Journal of Medicinal Chemistry. 1995, 38 (14), pp. 2628-48, DOI 10.1021/jm00014a016, page 2635, compounds 20h, 22h

Document 11: Liebigs Annalen der Chemie. 1990, (3), pp. 293-6, DOI 10.1002/jlac.199019900153, page 294, compound 10

Document 12: Database Registry [ONLINE]. Retrieved from STN, 14 July 2004, RN 709638-59-5. Ethyl 4-amino-1,6-dihydro-5-[(hydroxyamino)iminomethyl]-1-(4-methoxyphenyl)-6-oxo-3-pyridazinecarboxylate

**(Invention 1) Claims 1-6**

Claims 1-6 have the technical feature of a "compound represented by formula (I) or a salt thereof", and thus are classified as invention 1. Note that, said technical feature does not make a contribution over the prior art in light of the disclosures in documents 1-10, and thus cannot be considered to be a special technical feature.

**(Invention 2) Claims 7-8**

Claims 7-8 pertain to a "compound represented by formula (II) or a salt thereof", and claims 7-8 and claim 1 classified as invention 1 share the technical feature of a pyridazinone derivative having a substituent in the X5 moiety of formula (II) (X4 moiety in formula (I)). However, said technical feature does not make a contribution over the prior art in light of the disclosures in documents 1-12, etc., and thus cannot be said to be a special technical feature. In addition, there are no other same or corresponding special technical features among these inventions.

Furthermore, claims 7-8 are not dependent on claim 1. Moreover, claims 7-8 are not substantially identical to or similarly closely related to any of the claims classified as invention 1.

Accordingly, claims 7-8 cannot be classified as invention 1, and are classified as invention 2.

**Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)**

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

- Remark on Protest**
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
  - The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
  - No protest accompanied the payment of additional search fees.



**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
**Information on patent family members**

International application No.

**PCT/JP2022/024872**

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
JP 47-19035 A	19 September 1972	(Family: none)	
JP 48-10234 A	08 February 1973	(Family: none)	
JP 8-291147 A	05 November 1996	US 5635494 A tables 1-4 EP 738716 A2 CN 1143637 A KR 10-1996-0037663 A	
JP 8-225540 A	03 September 1996	US 5763440 A table 1 US 5935961 A US 5958925 A EP 711759 A1 CN 1128758 A KR 10-1996-0016715 A	
JP 2012-526123 A	25 October 2012	US 2010/0292253 A1 particularly, compounds 404, 405 US 2013/0072382 A1 US 2013/0089622 A1 US 2014/0348947 A1 US 2015/0045218 A1 WO 2010/129497 A1 EP 2427191 A1 EP 2604267 A1 EP 2604268 A1 EP 2614825 A1 EP 2614826 A1 CN 102458403 A KR 10-2012-0034636 A	

<p>A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））</p> <p>C07D 237/14(2006.01)i; A01N 43/58(2006.01)i; A01N 47/12(2006.01)i; A01P 3/00(2006.01)i; A01P 5/00(2006.01)i; A61K 31/50(2006.01)i; A61P 31/10(2006.01)i; C07D 237/16(2006.01)i; C07D 237/22(2006.01)i; C07D 237/24(2006.01)i; C07D 401/04(2006.01)i; C07D 409/12(2006.01)i; C07D 417/12(2006.01)i</p> <p>FI: C07D237/14 CSP; A01N43/58 B; A01N47/12 102; A01P3/00; A01P5/00; A61K31/50; A61P31/10; C07D237/16; C07D237/22; C07D237/24 CSP; C07D401/04; C07D409/12; C07D417/12</p>																													
<p>B. 調査を行った分野</p> <p>調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））</p> <p>C07D237/14; A01N43/58; A01N47/12; A01P3/00; A01P5/00; A61K31/50; A61P31/10; C07D237/16; C07D237/22; C07D237/24; C07D401/04; C07D409/12; C07D417/12</p> <p>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</p> <table border="0"> <tr> <td>日本国実用新案公報</td> <td>1922 - 1996年</td> </tr> <tr> <td>日本国公開実用新案公報</td> <td>1971 - 2022年</td> </tr> <tr> <td>日本国実用新案登録公報</td> <td>1996 - 2022年</td> </tr> <tr> <td>日本国登録実用新案公報</td> <td>1994 - 2022年</td> </tr> </table> <p>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）</p> <p>JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII); CAplus/REGISTRY (STN)</p>			日本国実用新案公報	1922 - 1996年	日本国公開実用新案公報	1971 - 2022年	日本国実用新案登録公報	1996 - 2022年	日本国登録実用新案公報	1994 - 2022年																			
日本国実用新案公報	1922 - 1996年																												
日本国公開実用新案公報	1971 - 2022年																												
日本国実用新案登録公報	1996 - 2022年																												
日本国登録実用新案公報	1994 - 2022年																												
<p>C. 関連すると認められる文献</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>引用文献の カテゴリー*</th> <th>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</th> <th>関連する 請求項の番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>X</td> <td>Youji Huaxue, 2005, 25(4), 445-448 第446頁スキーム1、第448頁表1</td> <td>1, 3, 4</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td></td> <td>2, 5, 6-8</td> </tr> <tr> <td>X</td> <td>Nippon Nogei Kagaku Kaishi, 1983, 57(5), 445-52 第447頁表I、第448頁表II、第449頁表III、第450頁表IV</td> <td>1, 3, 4</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td></td> <td>2, 5, 6-8</td> </tr> <tr> <td>X</td> <td>JP 47-19035 A (三井東圧化学株式会社) 19.09.1972 (1972-09-19) 第3頁表1</td> <td>1, 3, 4</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td></td> <td>2, 5, 6-8</td> </tr> <tr> <td>X</td> <td>JP 48-10234 A (三井東圧化学株式会社) 08.02.1973 (1973-02-08) 第3頁表1</td> <td>1, 3, 4</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td></td> <td>2, 5, 6-8</td> </tr> </tbody> </table> <p><input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input checked="" type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。</p> <p>* 引用文献のカテゴリー</p> <p>“A” 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの</p> <p>“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</p> <p>“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）</p> <p>“O” 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“&amp;” 同一パテントファミリー文献</p>			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	Youji Huaxue, 2005, 25(4), 445-448 第446頁スキーム1、第448頁表1	1, 3, 4	A		2, 5, 6-8	X	Nippon Nogei Kagaku Kaishi, 1983, 57(5), 445-52 第447頁表I、第448頁表II、第449頁表III、第450頁表IV	1, 3, 4	A		2, 5, 6-8	X	JP 47-19035 A (三井東圧化学株式会社) 19.09.1972 (1972-09-19) 第3頁表1	1, 3, 4	A		2, 5, 6-8	X	JP 48-10234 A (三井東圧化学株式会社) 08.02.1973 (1973-02-08) 第3頁表1	1, 3, 4	A		2, 5, 6-8
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	Youji Huaxue, 2005, 25(4), 445-448 第446頁スキーム1、第448頁表1	1, 3, 4																											
A		2, 5, 6-8																											
X	Nippon Nogei Kagaku Kaishi, 1983, 57(5), 445-52 第447頁表I、第448頁表II、第449頁表III、第450頁表IV	1, 3, 4																											
A		2, 5, 6-8																											
X	JP 47-19035 A (三井東圧化学株式会社) 19.09.1972 (1972-09-19) 第3頁表1	1, 3, 4																											
A		2, 5, 6-8																											
X	JP 48-10234 A (三井東圧化学株式会社) 08.02.1973 (1973-02-08) 第3頁表1	1, 3, 4																											
A		2, 5, 6-8																											
<p>国際調査を完了した日</p> <p>30.08.2022</p>	<p>国際調査報告の発送日</p> <p>13.09.2022</p>																												
<p>名称及びあて先</p> <p>日本国特許庁(ISA/JP)</p> <p>〒100-8915</p> <p>日本国</p> <p>東京都千代田区霞が関三丁目4番3号</p>	<p>権限のある職員（特許庁審査官）</p> <p>安藤 倫世 4P 9837</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3492</p>																												

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 A	JP 8-291147 A (ローム アンド ハース カンパニー) 05.11.1996 (1996-11-05) 表1-4のうちYが単結合でないもの	1, 3, 4 2, 5, 6-8
X A	JP 8-225540 A (ローム アンド ハース カンパニー) 03.09.1996 (1996-09-03) 表1実施例7-19等	1, 3, 4 2, 5, 6-8
X A	JP 2012-526123 A (ダウ アグロサイエンシイズ エルエルシー) 25.10.2012 (2012-10-25) 特に、化合物404, 405	1, 5 2-4, 6-8
X A	International Journal of Pharma and Bio Sciences, 2019, 10(1), 127-140, DOI 10.22376/ijpbs.2019.10.1.p127-140 第129頁化合物2a~2k	1, 6 2-5, 7-8
X A	Journal of Heterocyclic Chemistry, 2007, 44(6), 1333-1337, DOI 10.1002/jhet.5570440615 第1335頁表1化合物10a, 10b, 13a, 13c	1, 6 2-5, 7-8
X A	Journal of Medicinal Chemistry, 1995, 38(14), 2628-48, DOI 10.1021/jm00014a016 第2635頁化合物20h, 22h	1, 6 2-5, 7-8
X A	Liebigs Annalen der Chemie, 1990, (3), 293-6, DOI 10.1002/jlac.199019900153 第294頁化合物10	7-8 1-6
X A	DATABASE REGISTRY [ONLINE] Retrieved from STN, 2004.07.14, RN 709638-59-5, Ethyl 4-amino-1,6-dihydro-5-[(hydroxyamino)iminomethyl]-1-(4-methoxyphenyl)-6-oxo-3-pyridazinecarboxylate 特に、CA INDEX NAME	7-8 1-6

## 第III欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

- 文献1 : Youji Huaxue, 2005, 25(4), 445-448  
第446頁スキーム1、第448頁表1
- 文献2 : Nippon Nogei Kagaku Kaishi, 1983, 57(5), 445-52  
第447頁表I、第448頁表I I、第449頁表I I I、第450頁表I V
- 文献3 : JP 47-19035 A (三井東圧化学株式会社) 19.09.1972(1972-09-19)  
第3頁表1
- 文献4 : JP 48-10234 A (三井東圧化学株式会社) 08.02.1973(1973-02-08)  
第3頁表1
- 文献5 : JP 8-291147 A (ローム アンド ハース カンパニー) 05.11.1996(1996-11-05)  
表1-4のうちYが単結合でないもの
- 文献6 : JP 8-225540 A (ローム アンド ハース カンパニー) 03.09.1996(1996-09-03)  
表1実施例7-19等
- 文献7 : JP 2012-526123 A (ダウ アグロサイエンシイズ エルエルシー) 25.10.2012(2012-10-25)  
化合物404, 405
- 文献8 : International Journal of Pharma and Bio Sciences, 2019, 10(1), 127-140,  
DOI 10.22376/ijpbs.2019.10.1.p127-140  
第129頁化合物2a-2k
- 文献9 : Journal of Heterocyclic Chemistry, 2007, 44(6), 1333-1337,  
DOI 10.1002/jhet.5570440615  
第1335頁表1化合物10a, 10b, 13a, 13c
- 文献10 : Journal of Medicinal Chemistry, 1995, 38(14), 2628-48,  
DOI 10.1021/jm00014a016  
第2635頁化合物20h, 22h
- 文献11 : Liebigs Annalen der Chemie, 1990, (3), 293-6,  
DOI 10.1002/jlac.199019900153  
第294頁化合物10
- 文献12 : DATABASE REGISTRY [ONLINE] Retrieved from STN, 2004.07.14, RN 709638-59-5,  
Ethyl 4-amino-1,6-dihydro-5-[(hydroxyamino)iminomethyl]-1-(4-methoxyphenyl)  
-6-oxo-3-pyridazinecarboxylate

（発明1）請求項1-6

請求項1-6は、「式(I)で表される化合物またはその塩」であるという技術的特徴を有している  
ので、発明1に区分する。なお、当該技術的特徴は、文献1-10の上記開示内容に照らして、先行技  
術に対する貢献をもたらすものではないから、当該技術的特徴は、特別な技術的特徴であるとはいえない。

（発明2）請求項7-8

請求項7-8は、「式(II)で表される化合物またはその塩」であり、発明1に区分された請求項  
1と、式(II)のX5部分(式(I)のX4部分)に置換基を有するピリダジノン誘導体であるとい  
う、共通の技術的特徴を有している。しかしながら、当該技術的特徴は、文献1-12等の上記開示内  
容に照らして、先行技術に対する貢献をもたらすものではないから、当該技術的特徴は、特別な技術的  
特徴であるとはいえない。また、これらの発明の間には、他に同一の又は対応する特別な技術的特徴は  
存在しない。

さらに、請求項7-8は、請求項1の従属請求項ではない。また、請求項7-8は、発明1に区分さ  
れたいずれの請求項に対しても実質同一又はそれに準ずる関係にはない。

したがって、請求項7-8は発明1に区分できず、発明2に区分する。

## 第III欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

1.  出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求項について作成した。
2.  追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求項について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3.  出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求項のみについて作成した。
4.  出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求項について作成した。

追加調査手数料の異議の  
申立てに関する注意

- 追加調査手数料及び、該当する場合には、異議申立手数料の納付と共に、出願人から異議申立てがあった。
- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあったが、異議申立手数料が納付命令書に示した期間内に支払われなかった。
- 追加調査手数料の納付はあったが、異議申立てはなかった。

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/JP2022/024872

引用文献	公表日	パテントファミリー文献	公表日
JP 47-19035 A	19.09.1972	(ファミリーなし)	
JP 48-10234 A	08.02.1973	(ファミリーなし)	
JP 8-291147 A	05.11.1996	US 5635494 A 表 1 - 4 EP 738716 A2 CN 1143637 A KR 10-1996-0037663 A	
JP 8-225540 A	03.09.1996	US 5763440 A 表 1 US 5935961 A US 5958925 A EP 711759 A1 CN 1128758 A KR 10-1996-0016715 A	
JP 2012-526123 A	25.10.2012	US 2010/0292253 A1 特に、化合物 4 O 4, 4 O 5 US 2013/0072382 A1 US 2013/0089622 A1 US 2014/0348947 A1 US 2015/0045218 A1 WO 2010/129497 A1 EP 2427191 A1 EP 2604267 A1 EP 2604268 A1 EP 2614825 A1 EP 2614826 A1 CN 102458403 A KR 10-2012-0034636 A	