(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
2007 年5 月10 日 (10.05.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/052615 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 401/04 (2006.01) *C07D 401/14* (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) *C07D 413/04* (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01) *C07D 413/14* (2006.01)
A61P 31/10 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/321678

(22) 国際出願日: 2006 年10 月30 日 (30.10.2006)

(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 2005-317680
2005 年10 月31 日 (31.10.2005) JP
60/731,267 2005 年10 月31 日 (31.10.2005) US
特願 2005-374395
2005 年12 月27 日 (27.12.2005) JP
60/753,391 2005 年12 月27 日 (27.12.2005) US

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ・アール・アンド・ディー・マネジメント株式会社 (Eisai R & D Management Co., Ltd.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川四丁目６番１０号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 田中 圭悟 (TANAKA, Keigo) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 井上 諭 (INOUE, Satoshi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 村井 則夫 (MURAI, Norio) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 松倉 正幸 (MATSUKURA, Masayuki) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 中本 和孝 (NAKAMOTO, Kazutaka) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 白鳥 修司 (SHIROTORI, Shuji) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 阿部 信也 (ABE, Shinya) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 稲葉 良幸, 外(INABA, Yoshiyuki et al.); 〒1066123 東京都港区六本木６－１０－１ 六本木ヒルズ森タワー２３階 ＴＭＩ総合法律事務所 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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

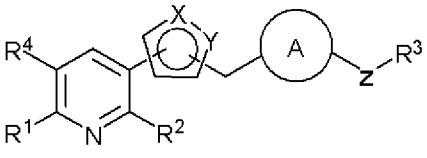
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) **Title:** PYRIDINE DERIVATIVE SUBSTITUTED BY HETEROCYCLE AND FUNGICIDE CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: ヘテロ環置換ピリジン誘導体およびそれらを含有する抗真菌剤



(I)

(57) **Abstract:** A fungicide which has excellent antifungal activity and is excellent in properties, safety, and metabolic stability. Also provided is a compound represented by the following formula (I) or a salt thereof: [Chemical formula 1] (I) [wherein R^1 means hydrogen, halogeno, amino, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoxy, or (C_{1-6} alkoxy)C_{1-6} alkyl; R^2 means hydrogen, C_{1-6} alkyl, amino, or di(C_{1-6} alkyl)amino; one of X and Y means nitrogen and the other means nitrogen or oxygen; ring A means a 5- or 6-membered heteroaryl ring or benzene ring each optionally having one or two halogen atoms or C_{1-6} alkyl groups; Z means a single bond, methylene, ethylene, oxygen, sulfur, $-CH_2O-$, $-OCH_2-$, $-NH-$, $-CH_2NH-$, $-NHCH_2-$, $-CH_2S-$, or $-SCH_2-$; R^3 means hydrogen, halogeno, or C_{1-6} alkyl, C_{3-8} cycloalkyl, C_{6-10} aryl, 5- or 6-membered heteroaryl, or 5- or 6-membered nonaromatic heterocyclic group each optionally having one or two substituents selected from the substituent group (α); and R^4 means hydrogen or halogeno].

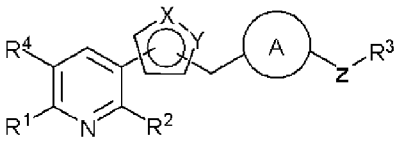
[続葉有]

WO 2007/052615 A1

(57) 要約:

本発明は、優れた抗真菌作用を有し、物性、安全性および代謝的安定性の面でも優れた抗真菌剤を提供する。本発明によれば、下式(I)で表される化合物またはその塩;

【化1】



(I)

[式中、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、C_{1-6}アルキル基、C_{1-6}アルコキシ基、またはC_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルキル基を意味し;R^2が、水素原子、C_{1-6}アルキル基、アミノ基、または$ジC_{1-6}$アルキルアミノ基を意味し;XおよびYの一方が、窒素原子を、他方が、窒素原子または酸素原子を意味し;環Aが、ハロゲン原子もしくはC_{1-6}アルキル基を1個もしくは2個有していてもよい、5もしくは6員のヘテロアリール環またはベンゼン環を意味し;Zが、単結合、メチレン基、エチレン基、酸素原子、硫黄原子、$-CH_2O-$、$-OCH_2-$、$-NH-$、$-CH_2NH-$、$-NHCH_2-$、$-CH_2S-$、または$-SCH_2-$を意味し;R^3が、水素原子、ハロゲン原子、または、それぞれ置換基群αから選ばれる置換基を1個もしくは2個有していてもよい、C_{1-6}アルキル基、C_{3-8}シクロアルキル基、C_{6-10}アリール基、5もしくは6員ヘテロアリール基、または5もしくは6員の非芳香族系ヘテロ環式基を意味し;R^4が、水素原子またはハロゲン原子を意味する。]を開示する。