



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20130324 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA  
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:  
**C07D 487/04** (2006.01)  
**A61P 33/00** (2006.01)  
**A01N 43/90** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.05.2013.  
**A61K 31/4985** (2006.01)

(21) Broj predmeta: P20130324T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 10.04.2013.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/JP2008052475  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 07.02.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08711309.8  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 07.02.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2008099902  
Datum međunarodne objave: 21.08.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2118113 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 18.11.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2118113 B1  
Datum objave europskog patenta: 30.01.2013.

(31) Broj prve prijave: 2007034371

(32) Datum podnošenja prve prijave: 15.02.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: JP

(73) Nositelj patenta:

ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD., 3-15, Edobori 1-chome, Nishi-ku,  
Osaka-shi, 550-0002 Osaka, JP  
Takahiro Haga, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-1  
Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga, JP  
Hirohiko Kimura, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-1  
Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga , JP  
Masayuki Morita, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-1  
Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga, JP  
Tsuyoshi Ueda, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-1  
Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga , JP  
Toshihiko Ueki, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-1  
Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga , JP  
Kazuhisa Kiriyma, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-  
1 Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga, JP  
Kotaro Yoshida, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-1  
Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga, JP  
Taku Hamamoto, c/o Ishihara Sangyo Kaisha Ltd. Chuo Kenkyusho 3-1  
Nishi-shibukawa 2-chome, 525-0025 Kusatsu-shi Shiga, JP

(74) Zastupnik:

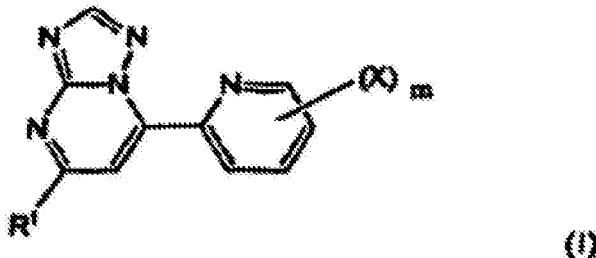
PETOŠEVIĆ d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

PIRIDIL-TRIAZOLOPIRIMIDIN DERIVAT ILI NJEGOVE SOLI, PESTICID KOJI GA SADRŽAVA I  
NJEGOV PROIZVODNI POSTUPAK

## PATENTNI ZAHTJEVI

1. Piridil-triazolopirimidin derivat predstavljen formulom (I) ili njegove soli,



5 **naznačen time**, da je R<sup>1</sup> alkil koji može biti supstituiran sa A, cikloalkil koji može biti supstituiran sa A, alkenil koji može biti supstituiran sa A, alkinil koji može biti supstituiran sa A, halogen, cijano, aril, heterociklička skupina, OR<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup>, NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>;

10 R<sup>2</sup> je vodik, alkil, alkenil, alkinil, haloalkil ili aril;

R<sup>3</sup> je alkil;

R<sup>4</sup> je vodik ili alkil;

R<sup>5</sup> je vodik ili alkil;

A je halogen, OR<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup>, NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, cijano, cikloalkil, aril ili heterociklička skupina;

X je alkil, alkenil, alkinil, halogen, haloalkil, cijano ili nitro;

15 m je cijeli broj 1-4, i

n je cijeli broj 0-2.

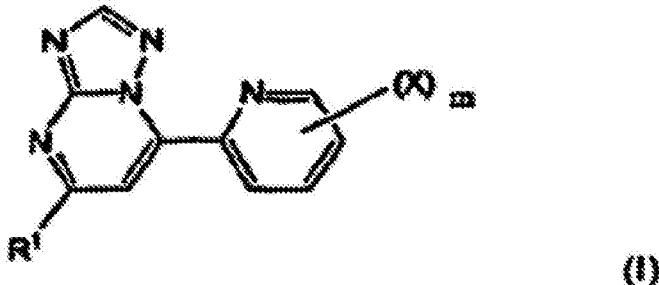
2. Piridil-triazolopirimidin derivat ili njegova sol prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da je R<sup>1</sup> alkil, haloalkil, cikloalkil, alkenil, alkinil, cijano, aril, heterociklička skupina, OR<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup>, NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>.

3. Piridil-triazolopirimidin derivat ili njegova sol prema zahtjevu 2, **naznačen time**, da je R<sup>1</sup> alkil, haloalkil, cikloalkil ili alkenil.

4. Piridil-triazolopirimidin derivat ili njegova sol prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da je R<sup>1</sup> alkil, haloalkil, alkinil, cijano, aril, heterociklička skupina, OR<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup> ili NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>.

5. Insekticid ili miticid koji sadržava piridil-triazolopirimidin derivat ili njegovu sol kao što je definirano u zahtjevu 1, **naznačen time**, da je takav spoj aktivni sastojak.

- 25 6. Postupak za proizvodnju piridil-triazolopirimidin derivata predstavljen formulom (I) ili njegove soli,



**naznačen time**, da je R<sup>1</sup> alkil koji može biti supstituiran sa A, cikloalkil koji može biti supstituiran sa A, alkenil koji može biti supstituiran sa A, alkinil koji može biti supstituiran sa A, halogen, cijano, aril, heterociklička skupina, OR<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup>, NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>;

30 R<sup>2</sup> je vodik, alkil, alkenil, alkinil, haloalkil ili aril;

R<sup>3</sup> je alkil;

R<sup>4</sup> je vodik ili alkil;

R<sup>5</sup> je vodik ili alkil;

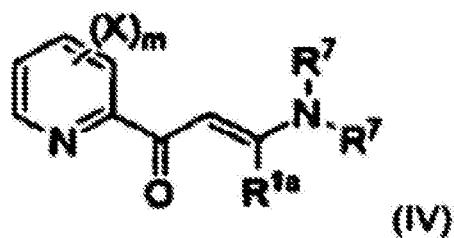
A je halogen, OR<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup>, NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, cijano, cikloalkil, aril, ili heterociklička skupina;

35 X je alkil, alkenil, alkinil, halogen, haloalkil, cijano, ili nitro;

m je cijeli broj 1-4, i

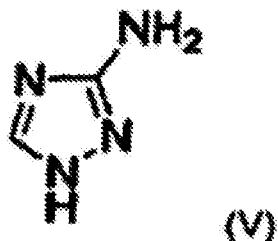
n je cijeli broj od 0 do 2, koji uključuje

(1) kondenziranje a, p-nezasićenog derivata ketona predstavljenog formulom (IV):

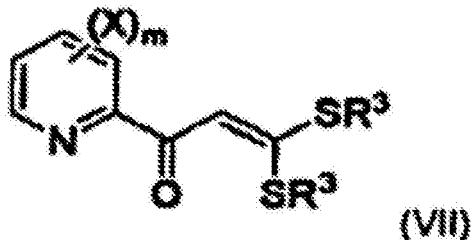


pri čemu su X i m kao što je definirano gore,

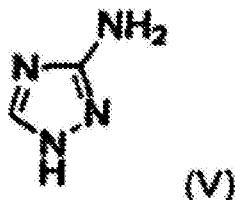
R<sup>1a</sup> je alkil koji može biti supstituiran sa A, cikloalkil koji može biti supstituiran sa A, alkenil koji može biti supstituiran sa A, alkinil koji može biti supstituiran sa A, arilom ili heterocikličkom skupinom, a R<sup>7</sup> je alkil, i spoj predstavljen formulom (V):



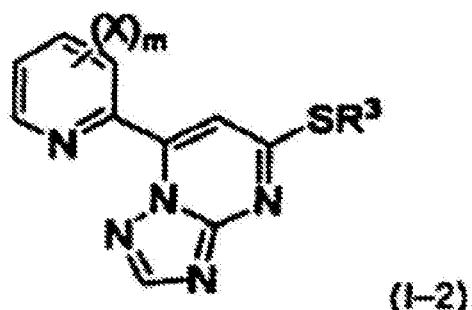
(2) kondenziranje  $\alpha,\beta$ -nezasićenog derivata ketona predstavljenog formulom (VII):



pri čemu su R<sup>3</sup>, X i m kao što je definirano gore, a spoj sa gore navedenom formulom (V);

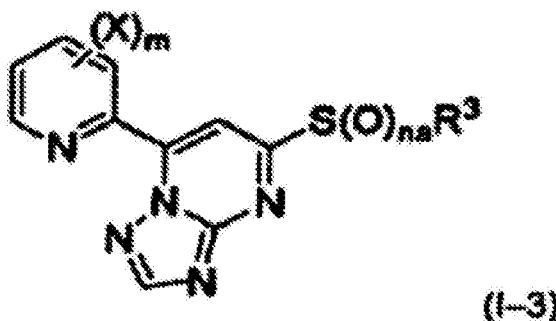


(3) oksidiranje spoja prikazan formulom (I-2):

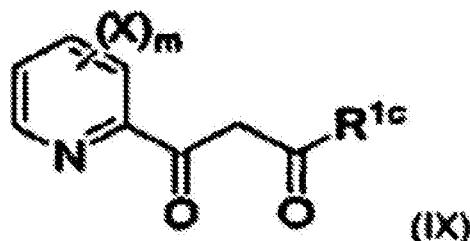


pri čemu su R<sup>3</sup>, X i m kao što je definirano gore,

(4) reakcija spoja prikazanog formulom (I-3):

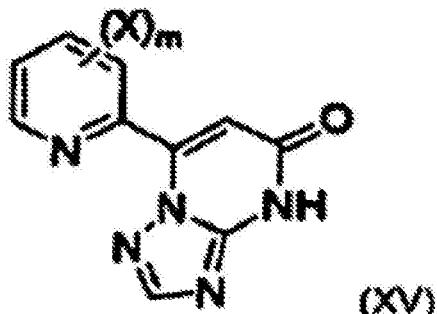


pri čemu su  $R^3$ , X i m kao što je definirano gore, a na je cijeli broj od 1-2, s nukleofilnim reagensom;  
 (5) kondenziranje spoja prikazanog formulom (IX):



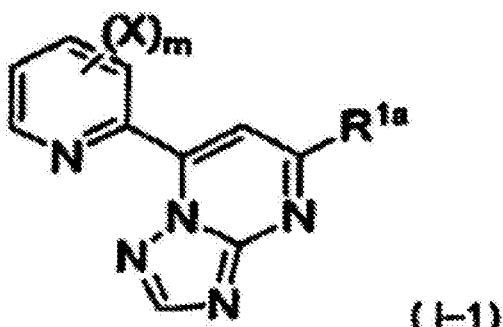
gdje su X i m kao što je definirano gore,  $R^{1c}$  je alkil koji može biti supstituiran sa A, cikloalkil koji može biti supstituiran sa A, alkenil koji može biti supstituiran sa A, alkinil koji može biti supstituiran sa A, aril ili heterociklička skupina i spoj prema gornjoj formuli (V); ili

(6) halogeniranje 4,5-dihidro-5-okso [1,2,4] triazolo [1,5-a] derivat pirimidina predstavljenog formulom (XV):



Gdje su X i m kao što je definirano gore.

7. Postupak za proizvodnju piridil-triazolopirimidin derivata predstavljen formulom (I-1), ili njegova sol,



**naznačen time**, da je  $R^{1a}$  alkil koji može biti supstituiran sa A, cikloalkil koji može biti supstituiran sa A, alkenil koji može biti supstituiran sa A, alkinil koji može biti supstituiran sa A, arilom ili heterocikličkom skupinom; X je alkil, alkenil, alkinil, halogen, haloalkil, cijano, ili nitro;

$R^2$  je vodik, alkil, alkenil, alkinil, haloalkil ili aril;

$R^3$  je alkil;

$R^4$  je vodik ili alkil;

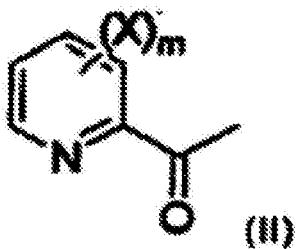
$R^5$  je vodik ili alkil;

A je halogen,  $OR^2$ ,  $S(O)_nR^3$ ,  $NR^4R^5$ , cijano, cikloalkil, aril ili heterociklička skupina;

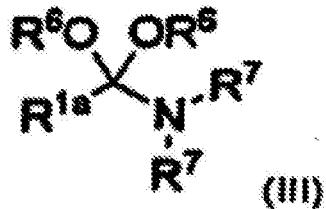
m je cijeli broj od 1-4, i

n je cijeli broj od 0-2;

koja obuhvaća kondenzaciju spoja prikazanog formulom (II):

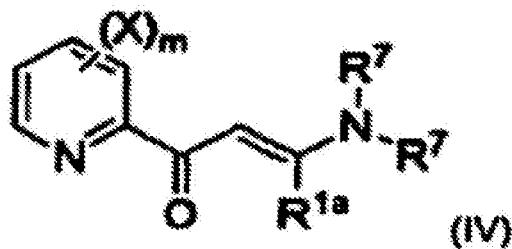


gdje su X i m kao što je definirano gore, i spoj predstavljen formulom (III):

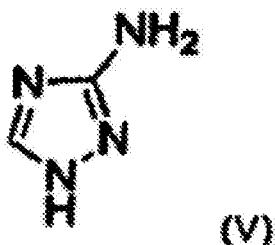


gdje je R<sup>1a</sup> definiran kao gore;

5 a svaki od R<sup>6</sup> i R<sup>7</sup>, koji su neovisni jedan o drugome, je alkil, da se dobije α, β-nezasićeni derivat ketona predstavljen formulom (IV):

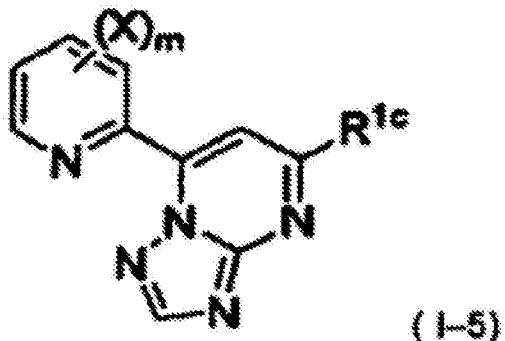


gdje su R<sup>1a</sup>, R<sup>7</sup>, X i m kao što je definirano gore, i kondenzaciju dobivenog derivata ketona i spoja predstavljenog formulom (V):



10

8. Postupak za proizvodnju piridil-triazolopirimidina derivata predstavljenog formulom (I-5) ili njegove soli,



**naznačen time**, da je R<sup>1c</sup> alkil koji može biti supstituiran sa A, cikloalkil koji može biti supstituiran sa A, alkenil koji može biti supstituiran sa A, alkinil koji može biti supstituiran sa A, arilom ili heterocikličkom skupinom;

15

X je alkil, alkenil, alkinil, halogen, haloalkil, cijano ili nitro;

R<sup>2</sup> je vodik, alkil, alkenil, alkinil, haloalkil ili aril;

R<sup>3</sup> je alkil;

R<sup>4</sup> je vodik ili alkil;

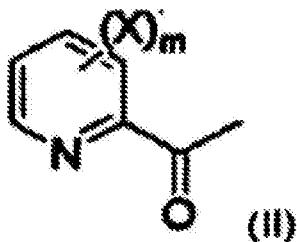
R<sup>5</sup> je vodik ili alkil;

20 A je halogen, OR<sup>2</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup>, NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, cijano, cikloalkil, aril, ili heterociklička skupina;

m je cijeli broj od 1-4, i

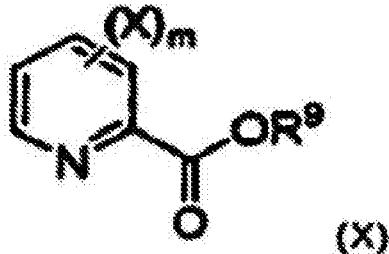
n je cijeli broj od 0-2, koji uključuje

(1) reakciju spoja prikazanog formulom (II):

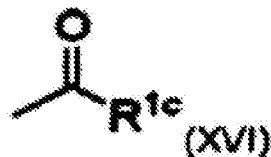


gdje su X i m kao što je definirano gore, sa spojem prema formuli (VIII):  
pri čemu je  $R^{1c}$  definiran kao gore, a  $R^8$  je alkil, ili

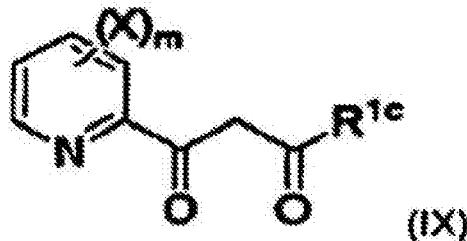
5 (2) reakciju spoja prikazanog formulom (X):



gdje su X i m kao što je definirano gore, a  $R^9$  je alkil, sa spojem formule (XVI):



pri čemu je  $R^{1c}$  definiran kao gore, da se dobije spoj predstavljen formulom (IX):



10

pri čemu je  $R^{1c}$ , X i m kao što je definirano gore, i

(3) kondenziranje spoja iz gornje formule (IX) i spoja predstavljenog formulom (V):

