(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)特許出願公表番号
特表2005-531549
(P2005-531549A)
(43)公表日　平成17年10月20日(2005.10.20)

(51)Int.Cl.[7]	F I		テーマコード（参考）
C07D 487/04	C07D 487/04	143	4C050
	C07D 487/04	CSP	

審査請求 未請求　予備審査請求 未請求　（全 61 頁）

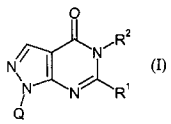
(21)出願番号	特願2004-501408 (P2004-501408)
(86)(22)出願日	平成15年4月22日 (2003.4.22)
(85)翻訳文提出日	平成16年12月21日 (2004.12.21)
(86)国際出願番号	PCT/EP2003/004137
(87)国際公開番号	WO2003/093269
(87)国際公開日	平成15年11月13日 (2003.11.13)
(31)優先権主張番号	102 19 435.1
(32)優先日	平成14年5月2日 (2002.5.2)
(33)優先権主張国	ドイツ(DE)

(71)出願人　302063961
バイエル・クロツプサイエンス・アクチエンゲゼルシヤフト
ドイツ４０７８９モンハイム・アルフレート－ノベル－シユトラーセ５０
(74)代理人　100062007
弁理士　川口　義雄
(74)代理人　100113332
弁理士　一入　章夫
(74)代理人　100114188
弁理士　小野　誠
(74)代理人　100103920
弁理士　大崎　勝真
(74)代理人　100124855
弁理士　坪倉　道明

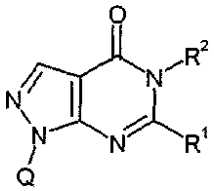
最終頁に続く

(54)【発明の名称】置換ピラゾロ－ピリミジン－４－オン

(57)【要約】
本発明は、式（Ｉ）：
【化３８】



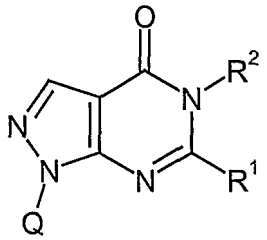
(I)



(I)

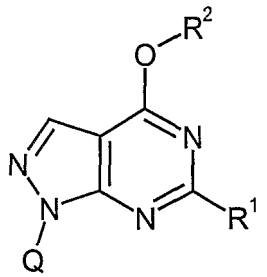
（式中、Q、R^1 及びR^2 は明細書に記載の意味を有する）
を有する化合物、その製造方法、及びその除草剤及び／または殺線虫剤としての使用に関する。

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：
【化１】



(I)

（式中、
Ｑは、それぞれ最高１０個の炭素原子及び適当ならば最高５個の窒素原子及び／または適当ならば１個の酸素または硫黄原子を有するアリールまたはヘテロアリールを表し、前記したアリールまたはヘテロアリールはそれぞれニトロ、シアノ、ハロゲン、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキル、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルコキシ、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキルチオ、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキルスルフィニル及び場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されており、
R^1は水素；場合によりシアノ、ハロゲンまたはC_{1-4}アルコキシで置換されたC_{1-6}アルキルまたはC_{1-6}アルコキシカルボニル；場合によりハロゲンで置換されたC_{2-6}アルケニルまたはC_{2-6}アルキニル；場合によりシアノ、ハロゲンまたはC_{1-4}アルキルで置換されたC_{3-6}シクロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル；場合によりニトロ、シアノ、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、C_{1-4}アルコキシまたはC_{1-4}ハロアルコキシで置換された、アリール基に最高１０個の炭素原子及び適当ならばアルキル部分に最高４個の炭素原子を有するアリールまたはアリールアルキル；または場合によりニトロ、シアノ、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、C_{1-4}アルコキシまたはC_{1-4}ハロアルコキシで置換された、最高１０個の炭素原子、最高５個の窒素原子及び／または１個の酸素または硫黄原子を有するヘテロシクリルを表し、および
R^2は水素；場合によりシアノ、ハロゲン、C_{1-4}アルコキシまたはC_{1-4}アルコキシカルボニルで置換されたC_{1-6}アルキル；または場合によりハロゲンで置換されたC_{2-6}アルケニルまたはC_{2-6}アルキニルを表す）
を有する化合物、但し１，５－ジヒドロ－６－メチル－１－（２，４，６－トリクロロフェニル）－４Ｈ－ピラゾロ－［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オンを除くものとする。
【請求項２】
式（Ｉａ）：
【化２】



(Ia)

（式中、Ｑ、R^1及びR^2は請求項１に記載の通りである）

を有する化合物。
【請求項３】
請求項１または２に記載の式（Ｉ）及び（Ｉａ）
（式中、
Ｑは６～１０個の炭素原子を有するアリールまたは最高５個の炭素原子、最高３個の窒素原子及び／または適当ならば１個の酸素または硫黄原子を有するヘテロアリールを表し、前記したアリール及びヘテロアリールはそれぞれニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、および場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキル、場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルコキシ、場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキルチオ、場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキルスルフィニル及び場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されており、
R^1は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシで置換されたC_{1-5}アルキルまたはC_{1-5}アルコキシカルボニル；場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたC_{2-5}アルケニルまたはC_{2-5}アルキニル；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メチルまたはエチルで置換されたC_{3-6}シクロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキル－C_{1-3}アルキル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換された、アリール基に６～１０個の炭素原子及び適当ならばアルキル部分に最高３個の炭素原子を有するアリールまたはアリールアルキル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換された、最高１０個の炭素原子、最高４個の窒素原子及び／または１個の酸素または硫黄原子を有するヘテロシクリルを表し、および
R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－イソプロポキシカルボニルで置換されたC_{1-5}アルキル；または場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたC_{2-5}アルケニルまたはC_{2-5}アルキニルを表す）
を有する化合物。
【請求項４】
請求項１または２に記載の式（Ｉ）及び（Ｉａ）
（式中、
Ｑはニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、フルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ブロモエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフル

オロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ｎ－もしくはｉ－プロピルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されたフェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラゾリル、フリルまたはチエニルを表し、

R^1は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシカルボニル；場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたエテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メチルまたはエチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチルまたはシクロヘキシルメチル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表し、および

R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル；または場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたエテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す）

を有する化合物。

【請求項５】

請求項１または２に記載の式（Ｉ）及び（Ｉａ）

（式中、

Ｑは２位及び４位に少なくとも２つの同一または異なる置換基及び場合により６位に１つの更なる置換基を含むフェニルを表し、置換基はニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキ

シ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択され、

R^1は水素；メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－もしくはｓ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル；エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、フルオロプロペニル、クロロプロペニル、ジフルオロプロペニル、ジクロロプロペニル、クロロフルオロプロペニル、フルオロブテニル、クロロブテニル、ジフルオロブテニル、ジクロロブテニル、クロロフルオロブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりフッ素、塩素またはメチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表し、および

R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル；または場合によりフッ素及び／または塩素で置換されたプロペニル、ブテニル、ペンテニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す）

を有する化合物。

【請求項６】

請求項１または２に記載の式（Ｉ）及び（Ｉａ）

（式中、

Ｑは３位及び５位に少なくとも２つの同一または異なる置換基及び場合により６位に１つの更なる置換基を含むピリジン－２－イルを表し、置換基はニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホ

ニルからなる群から選択され、
R^1は水素；メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－もしくはｓ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル；エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、フルオロプロペニル、クロロプロペニル、ジフルオロプロペニル、ジクロロプロペニル、クロロフルオロプロペニル、フルオロブテニル、クロロブテニル、ジフルオロブテニル、ジクロロブテニル、クロロフルオロブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりフッ素、塩素またはメチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表し、および
R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル；または場合によりフッ素及び／または塩素で置換されたプロペニル、ブテニル、ペンテニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す）
を有する化合物。
【請求項７】
請求項１または２に記載の式（Ｉ）及び（Ｉａ）
（式中、
Ｑは１位及び５位に少なくとも２つの同一または異なる置換基及び場合により４位に１つの更なる置換基を含むピラゾール－３－イルを表し、置換基はニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択され、
R^1は水素；メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－もしくはｓ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフ

ルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル；エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、フルオロプロペニル、クロロプロペニル、ジフルオロプロペニル、ジクロロプロペニル、クロロフルオロプロペニル、フルオロブテニル、クロロブテニル、ジフルオロブテニル、ジクロロブテニル、クロロフルオロブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりフッ素、塩素またはメチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表し、および

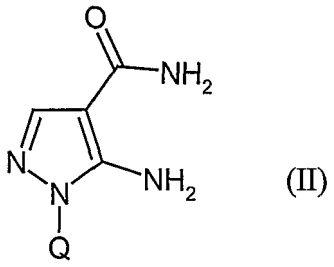
R^2 は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル；または場合によりフッ素及び／または塩素で置換されたプロペニル、ブテニル、ペンテニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す）

を有する化合物。

【請求項８】

（ａ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（ＩＩ）：

【化３】



(II)

（式中、Ｑは請求項１に定義されている通りである）

を有する化合物を式（ＩＩＩ）：

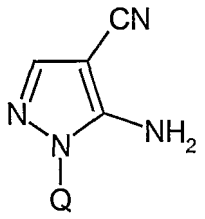
$$R^1-(OR')_3 \qquad (III)$$

（式中、R^1 は請求項１に定義されている通りであり、Ｒ’はアルキルを表す）

を有する化合物と反応させる、または

（ｂ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（ＩＶ）：

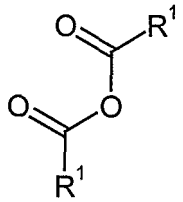
【化４】



(IV)

（式中、Ｑは請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物を式（Ｖ）：

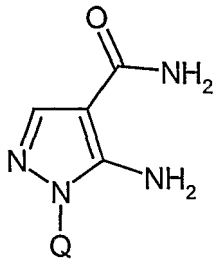
【化５】



(V)

（式中、Ｒ^{1}は請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物と反応させる、または
（ｃ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（ＩＩ）：

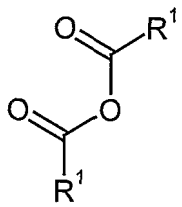
【化６】



(II)

（式中、Ｑは請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物を式（Ｖ）：

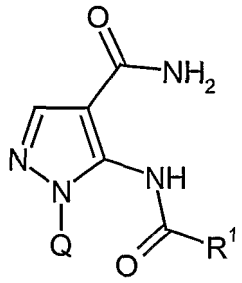
【化７】



(V)

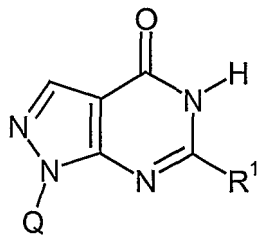
（式中、Ｒ^{1}は請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物と反応させる、または
（ｄ）適当ならば１つ以上の縮合剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（ＶＩ）：

【化８】



(VI)

（式中、Ｑ及びＲ[1]は請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物を反応させる、または
（ｅ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（Ｉｂ）：
【化９】



(Ib)

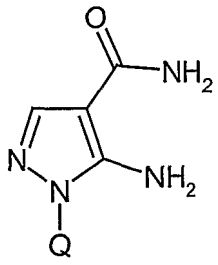
（式中、Ｑ及びＲ[1]は請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物を式（ＶＩＩ）：

Ｘ－Ｒ[2]　　（ＶＩＩ）

または式（ＶＩＩＩ）：

Ｒ[2]－Ｏ－ＳＯ$_2$－Ｏ－Ｒ[2]　　（ＶＩＩＩ）

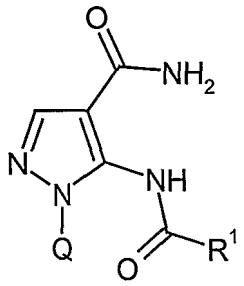
（式中、Ｒ[2]は請求項１に定義されている通りであり、Ｘはハロゲンを表す）
を有するアルキル化剤、アルケニル化剤またはアルキニル化剤と反応させることを含む請求項１または２に記載の式（Ｉ）及び（Ｉａ）を有する化合物の製造方法。
【請求項９】
式（ＩＩ）：
【化１０】



(II)

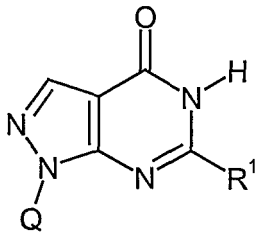
（式中、Ｑは請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物。
【請求項１０】
式（ＶＩ）：

【化１１】



(VI)

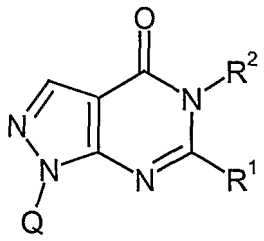
（式中、Ｑ及びＲ[1]は請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物。
【請求項１１】
式（Ｉｂ）：
【化１２】



(Ib)

（式中、Ｑ及びＲ[1]は請求項１に定義されている通りである）
を有する化合物。
【請求項１２】
請求項１～７のいずれか１項に記載の少くとも１種の化合物及び慣用の増量剤及び／または界面活性剤を含む作物処理剤。
【請求項１３】
請求項１～７のいずれか１項に記載の少くとも１種の化合物または請求項１２に記載の組成物の望ましくない植物及び／または線虫を防除するための使用。
【請求項１４】
請求項１～７のいずれか１項に記載の少くとも１種の化合物または請求項１２に記載の組成物を植物及び／または線虫及び／またはその生育地に作用させる望ましくない植物及び／または線虫の防除方法。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、新規な置換ピラゾロピリミジン－４－オン、その製造方法及びその作物処理剤、特に除草剤及び殺線虫剤としての使用に関する。
【背景技術】
【０００２】
特定の置換ピラゾロピリミジン－４－オン類、例えば１，５－ジヒドロ－６－メチル－１－（２，４，６－トリクロロフェニル）－４Ｈ－ピラゾロ－［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オンは既に公知である（国際特許出願公開第９４／１３６７７号パンフレット及び米国特許第６，２１８，３９７号明細書参照）。しかしながら、これらの化合物は作物処理剤として重要でなかった。
【発明の開示】
【０００３】
今回、本発明は、一般式（Ｉ）：

【０００４】
【化１３】



(I)

を有する新規な置換ピラゾロピリミジン－４－オンを提供する。上記式中、

Ｑは、それぞれ最高１０個の炭素原子及び適当ならば最高５個の窒素原子及び／または適当ならば１個の酸素または硫黄原子を有するアリールまたはヘテロアリールを表し、前記したアリールまたはヘテロアリールはそれぞれニトロ、シアノ、ハロゲン、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキル、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルコキシ、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキルチオ、場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキルスルフィニル及び場合によりハロゲン置換されたC_{1-6}アルキルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されており、

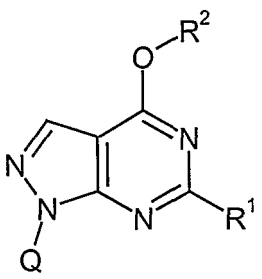
R^1は水素；場合によりシアノ、ハロゲンまたはC_{1-4}アルコキシで置換されたC_{1-6}アルキルまたはC_{1-6}アルコキシカルボニル；場合によりハロゲンで置換されたC_{2-6}アルケニルまたはC_{2-6}アルキニル；場合によりシアノ、ハロゲンまたはC_{1-4}アルキルで置換されたC_{3-6}シクロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル；場合によりニトロ、シアノ、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、C_{1-4}アルコキシまたはC_{1-4}ハロアルコキシで置換された、アリール基に最高１０個の炭素原子及び適当ならばアルキル部分に最高４個の炭素原子を有するアリールまたはアリールアルキル；または場合によりニトロ、シアノ、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、C_{1-4}アルコキシまたはC_{1-4}ハロアルコキシで置換された、最高１０個の炭素原子、最高５個の窒素原子及び／または１個の酸素または硫黄原子を有するヘテロシクリルを表し、

R^2は水素；場合によりシアノ、ハロゲン、C_{1-4}アルコキシまたはC_{1-4}アルコキシカルボニルで置換されたC_{1-6}アルキル；または場合によりハロゲンで置換されたC_{2-6}アルケニルまたはC_{2-6}アルキニルを表す。ただし、公知化合物の１，５－ジヒドロ－６－メチル－１－（２，４，６－トリクロロフェニル）－４Ｈ－ピラゾロ－［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（国際特許出願公開第９４／１３６７７号パンフレット）は特許権の一部放棄により除外される。

【０００５】

本発明は、式（Ｉａ）：

【０００６】
【化１４】



(Ia)

（式中、Ｑ、R^1及びR^2は上記と同義である）

を有するビラゾロピリミジンをも提供する。この化合物は一般式（Ｉ）を有する置換ピラゾロピリミジン－４－オンの異性体である。

【０００７】

上記定義中、アルキルまたはアルケニルのような炭化水素鎖はそれぞれ直鎖または分枝鎖であり、アルコキシのようにヘテロ原子を含む炭化水素鎖も同様である。

【０００８】

場合により置換された基は単置換であっても多置換であってもよく、多置換の場合に置換基は同一でも異なっていてもよい。

【０００９】

上記及び下記する式中の基の好ましい置換基は以下の通りである：

好ましくは、Ｑは６～１０個の炭素原子を有するアリールまたは最高５個の炭素原子、最高３個の窒素原子及び／または適当ならば１個の酸素または硫黄原子を有するヘテロアリールを表し、前記したアリール及びヘテロアリールはそれぞれニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキル、場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルコキシ、場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキルチオ、場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキルスルフィニル及び場合により１～３個のフッ素及び／または塩素原子で置換されたC_{1-4}アルキルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されている。

【００１０】

好ましくは、R^1は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシまたはｎ－もしくはｉ－プロポキシで置換されたC_{1-5}アルキルまたはC_{1-5}アルコキシカルボニル；場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたC_{2-5}アルケニルまたはC_{2-5}アルキニル；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メチルまたはエチルで置換されたC_{3-6}シクロアルキルまたはC_{3-6}シクロアルキル－C_{1-3}アルキル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換された、アリール基に６～１０個の炭素原子及び適当ならばアルキル部分に最高３個の炭素原子を有するアリールまたはアリールアルキル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換された、最高１０個の炭素原子、最高４個の窒素原子及び／または１個の酸素または硫黄原子を有するヘテロシクリルを表す。

【００１１】

好ましくは、R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－イソプロポキシカルボニルで置換されたC_{1-5}アルキル；または場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたC_{2-5}アルケニルまたはC_{2-5}アルキニルを表す。

【００１２】

より好ましくは、Ｑはニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、フルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ブロモエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ｎ－もしくはｉ－プロピルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されたフェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラゾリル、フリルまたはチエニルを表す。

【００１３】

より好ましくは、R^1は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシカルボニル；場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたエテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メチルまたはエチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチルまたはシクロヘキシルメチル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表す。

【００１４】

より好ましくは、R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル；または場合によりフッ素、塩素及び／または臭素で置換されたエテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す。

【００１５】

特に好ましくは、Ｑはニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフル

オロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されたフェニル、ピリジニルまたはピラゾリルを表す。

【００１６】

特に好ましくは、R^1 は水素；メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－もしくはｓ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル；エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、フルオロプロペニル、クロロプロペニル、ジフルオロプロペニル、ジクロロプロペニル、クロロフルオロプロペニル、フルオロブテニル、クロロブテニル、ジフルオロブテニル、ジクロロブテニル、クロロフルオロブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりフッ素、塩素またはメチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表す。

【００１７】

特に好ましくは、R^2 は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル；または場合によりフッ素及び／または塩素で置換されたプロペニル、ブテニル、ペンテニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す。

【００１８】

本発明の好ましさは、好ましいとして上記した意味の組合せを含む式（Ｉ）を有する化合物に対して適用される。

【００１９】

本発明のより好ましさは、より好ましいとして上記した意味の組合せを含む式（Ｉ）を有する化合物に対して適用される。

【００２０】

本発明の特に好ましさは、特に好ましいとして上記した意味の組合せを含む式（Ｉ）を有する化合物に対して適用される。

【００２１】

好ましさは、Ｑが２つの基で置換されている式（Ｉ）を有する化合物にも適用される。非常に好ましい群は、式（Ｉ）（式中、Ｑはニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択される少なくとも２つの同一または異なる置換基で置換されたフェニルまたはピリジニルを表す）を有する化合物である。

【００２２】

特に好ましい群は、式（Ｉ）（式中、

Ｑは２位及び４位に少なくとも２つの同一または異なる置換基及び場合により６位に１つの更なる置換基を含むフェニルを表し、置換基はニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択され、

R^1 は水素；メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－もしくはｓ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル；エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、フルオロプロペニル、クロロプロペニル、ジフルオロプロペニル、ジクロロプロペニル、クロロフルオロプロペニル、フルオロブテニル、クロロブテニル、ジフルオロブテニル、ジクロロブテニル、クロロフルオロブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりフッ素、塩素またはメチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ

、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表し、

R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル；または場合によりフッ素及び／または塩素で置換されたプロペニル、ブテニル、ペンテニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す）

を有する化合物である。

【００２３】

Ｑが２，４－ジクロロフェニル、２，４，６－トリクロロフェニル、２－クロロ－４－トリフルオロメチルフェニルまたは２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルフェニルを表す化合物が特に強調される。

【００２４】

更に非常に好ましい群は、式（Ｉ）（式中、

Ｑは３位及び５位に少なくとも２つの同一または異なる置換基及び場合により６位に１つの更なる置換基を含むピリジン－２－イルを表し、置換基はニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択され、

R^1は水素；メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－もしくはｓ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル；エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、フルオロプロペニル、クロロプロペニル、ジフルオロプロペニル、ジクロロプロペニル、クロロフルオロプロペニル、フルオロブテニル、クロロブテニル、ジフルオロブテニル、ジクロロブテニル、クロロフルオロブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりフッ素、塩素またはメチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエ

トキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表し、および

R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル；または場合によりフッ素及び／または塩素で置換されたプロペニル、ブテニル、ペンテニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す）

を有する化合物である。

【００２５】

Ｑが３，５－ジクロロピリジン－２－イルまたは３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イルを表す化合物が特に強調される。

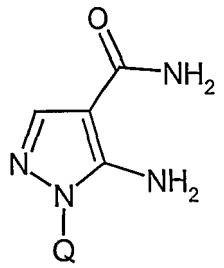
【００２６】

更に非常に好ましい群は、式（Ｉ）（式中、

Ｑは１位及び５位に少なくとも２つの同一または異なる置換基及び場合により４位に１つの更なる置換基を含むピラゾル－３－イルを表し、置換基はニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロジクロロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、フルオロジクロロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル及びトリフルオロメチルスルホニルからなる群から選択され、

R^1は水素；メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－もしくはｓ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニル；エテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、フルオロプロペニル、クロロプロペニル、ジフルオロプロペニル、ジクロロプロペニル、クロロフルオロプロペニル、フルオロブテニル、クロロブテニル、ジフルオロブテニル、ジクロロブテニル、クロロフルオロブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニル；場合によりフッ素、塩素またはメチルで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル；場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたフェニル、ベンジルまたはフェニルエチル；または場合によりニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－もしくはｉ－プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシまたはトリフルオロエトキシで置換されたピリジニル、

ピリミジニル、フリル、テトラヒドロフリルまたはチエニルを表し、および
R^2は水素；場合によりシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－もしくはｉ－プロポキシカルボニルで置換されたメチル、エチル、ｎ－もしくはｉ－プロピル；または場合によりフッ素及び／または塩素で置換されたプロペニル、ブテニル、ペンテニル、プロピニル、ブチニルまたはペンチニルを表す）
を有する化合物である。
【００２７】
Ｑが５－ジフルオロメトキシ－１－メチルピラゾル－３－イルまたは５－ジフルオロメトキシ－１，４－ジメチルピラゾル－３－イルを表す化合物が特に強調される。
【００２８】
上記した一般的な基または好ましい基の定義は式（Ｉ）を有する最終生成物のみならず製造のために必要な出発物質または中間体にも適用される。これらの基の定義は所望により相互に組み合わされ、すなわち好ましい範囲内の組合せが含まれる。
【００２９】
一般式（Ｉ）を有する新規な置換ピラゾロピリミジン－４－オンは強力で選択的な除草及び殺線虫活性を有する。
【００３０】
一般式（Ｉ）を有する新規な置換ピラゾロピリミジン－４－オンは、
（ａ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（ＩＩ）：
【００３１】
【化１５】

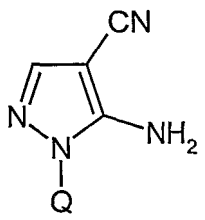


(II)

（式中、Ｑは上記と同義である）
を有する５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドを式（ＩＩＩ）：

$R^1-(OR')_3$ （ＩＩＩ）

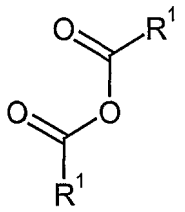
（式中、R^1は上記と同義であり、Ｒ’はアルキルを表す）
を有するカルボン酸オルトエステルと反応させる、または
（ｂ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（ＩＶ）：
【００３２】
【化１６】



(IV)

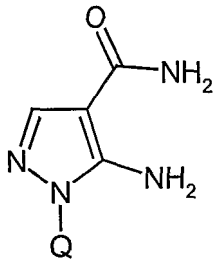
（式中、Ｑは上記と同義である）
を有する５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボニトリルを式（Ｖ）：
【００３３】

【化１７】



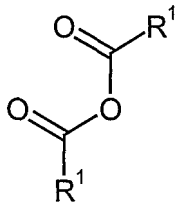
(V)

（式中、Ｒ[1]は上記と同義である）
を有する無水カルボン酸と反応させる、または
（ｃ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（ＩＩ）：
【００３４】
【化１８】



(II)

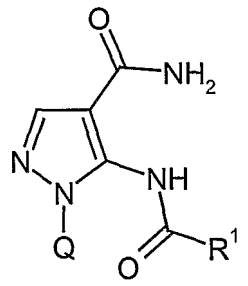
（式中、Ｑは上記と同義である）
を有する５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドを式（Ｖ）：
【００３５】
【化１９】



(V)

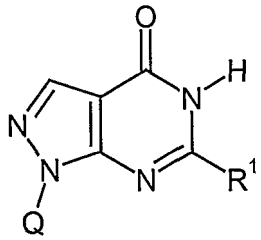
（式中、Ｒ[1]は上記と同義である）
を有する無水カルボン酸と反応させる、または
（ｄ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の縮合剤の存在下で式（ＶＩ）：
【００３６】

【化２０】



(VI)

（式中、Ｑ及びＲ^{1}は上記と同義である）
を有する５－アシルアミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドを反応させる、または
（ｅ）適当ならば１つ以上の反応助剤の存在下、適当ならば１つ以上の希釈剤の存在下で式（Ｉｂ）：
【００３７】
【化２１】



(Ib)

（式中、Ｑ及びＲ^{1}は上記と同義である）
を有する置換ピラゾロピリミジン－４－オンを式（ＶＩＩ）：

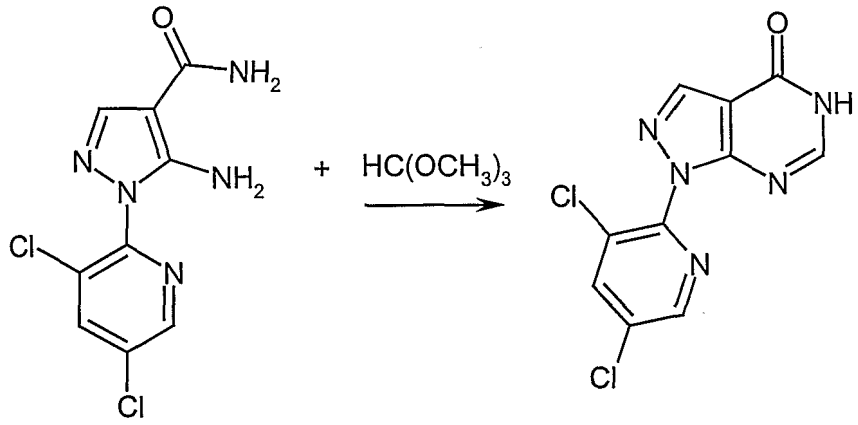
Ｘ－Ｒ^{2} （ＶＩＩ）

または式（ＶＩＩＩ）：

Ｒ^{2}－Ｏ－ＳＯ$_{2}$－Ｏ－Ｒ^{2} （ＶＩＩＩ）

（式中、Ｒ^{2}は上記と同義であり、Ｘはハロゲンを表す）
を有するアルキル化剤、アルケニル化剤またはアルキニル化剤と反応させることにより得られる。
【００３８】
例えば５－アミノ－１－（３，５－ジクロロピリジン－２－イル）－ピラゾール－４－カルボキサミド及びオルトギ酸トリメチルを出発物質として用いると、本発明の方法（ａ）における反応は下記スキームにより示され得る。
【００３９】

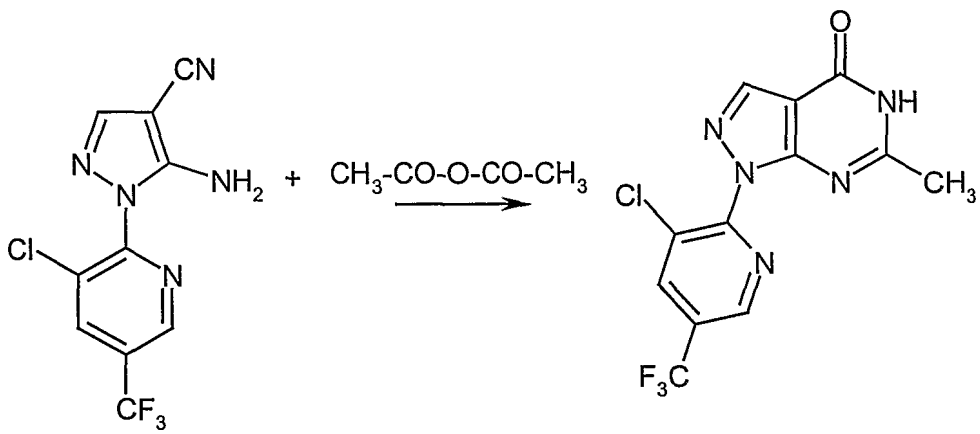
【化２２】



例えば５－アミノ－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－ピラゾール－４－カルボニトリル及び無水酢酸を出発物質として用いると、本発明の方法（ｂ）における反応は下記スキームにより示され得る。

【００４０】

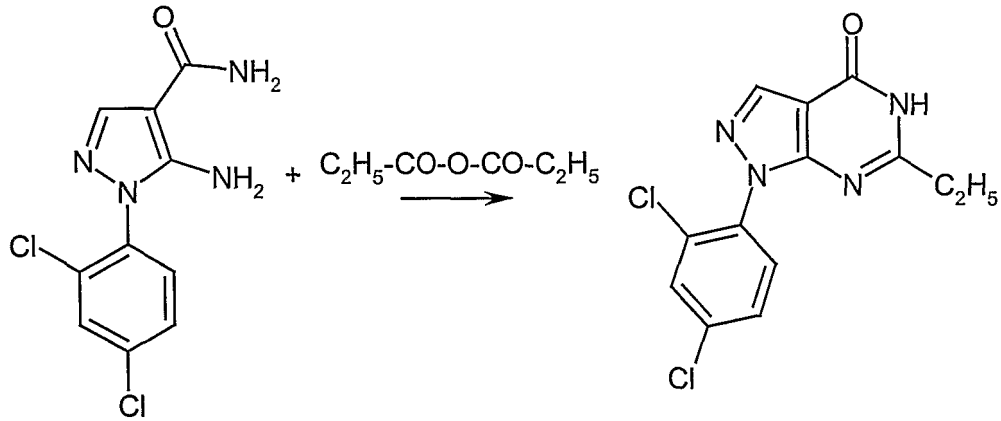
【化２３】



例えば５－アミノ－１－（２，４－ジクロロフェニル）ピラゾール－４－カルボキサミド及び無水プロピオン酸を出発物質として用いると、本発明の方法（ｃ）における反応は下記スキームにより示され得る。

【００４１】

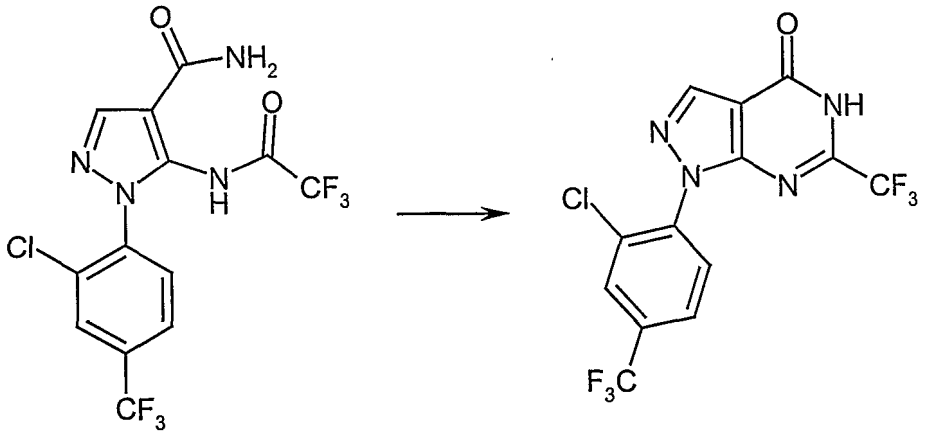
【化２４】



例えば１－（２－クロロ－４－トリフルオロメチルフェニル）－５－トリフルオロアセチルアミノピラゾール－４－カルボキサミドを出発物質として用いると、本発明の方法（ｄ）における反応は下記スキームにより示され得る。

【００４２】

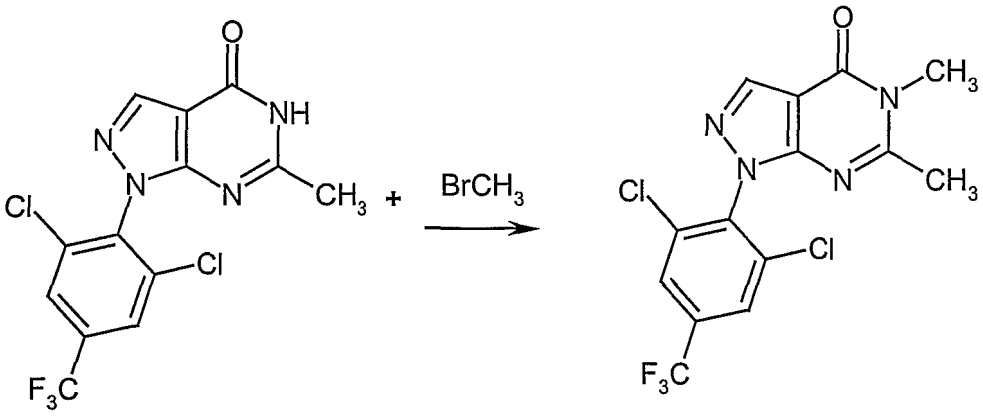
【化２５】



例えば１－（２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルフェニル）－６－メチル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］ピリミジン－７－オン及び臭化メチルを出発物質として用いると、本発明の方法（ｅ）における反応は下記スキームにより示され得る。

【００４３】

【化２６】



式（ＩＩ）は、式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ａ）及び（ｃ）における出発物質として使用される５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドの一般的定義を与える。式（ＩＩ）中、Ｑは好ましくは本発明の式（Ｉ）を有する化合物の記載に関連して好ましい、特に好ましい、非常に好ましいＱとして上記した意味を有する。

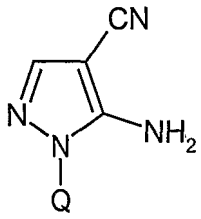
【００４４】

５－アミノ－１－（２，４，６－トリクロロフェニル）－ピラゾール－４－カルボキサミド（国際特許出願公開第９４／１３６７７号パンフレット参照）を除いて、一般式（ＩＩ）を有する出発物質は今まで文献に記載されておらず、５－アミノ－１－（２，４，６－トリクロロフェニル）ピラゾール－４－カルボキサミドを除いて、それらは新規物質として本発明の主題の一部をなす。

【００４５】

一般式（ＩＩ）を有する５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドは、一般式（ＩＶ）：

【００４６】
【化２７】



(IV)

（式中、Ｑは上記と同義である）
を有する５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボニトリルを一般的方法、例えば０～１００℃の温度で硫酸と反応させることにより（製造例参照）加水分解することにより得られる。
【００４７】
式（ＩＩＩ）は、式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ａ）における出発物質として使用されるカルボン酸オルトエステルの一般的定義を与える。式（ＩＩＩ）中、R^1は好ましくは本発明の式（Ｉ）を有する化合物の記載に関連して好ましい、特に好ましい、非常に好ましいR^1として上記した意味を有する。R^1は、好ましくは炭素数１～４のアルキル、特にメチルまたはエチルを表す。
【００４８】
一般式（ＩＩＩ）を有する出発物質は合成用の公知の有機化合物である。
【００４９】
式（ＩＶ）は、式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ｂ）における出発物質として使用される５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボニトリルの一般的定義を与える。式（ＩＶ）中、Ｑは本発明の式（Ｉ）を有する化合物の記載に関連して好ましい、特に好ましい、非常に好ましいＱとして上記した意味を有する。
【００５０】
一般式（ＩＶ）を有する出発物質は公知である及び／またはそれ自体公知の方法により製造され得る（ドイツ国特許出願公開第３４０８７２７号明細書、同第３４２０９８５号明細書、同第３５２０３２７号明細書、同第３５２０３３１号明細書、同第３５４０８３９号明細書、同第３６２５６８６号明細書、同第１９５３０６０６号明細書、同第１９６２３８９２号明細書、同第１９６３１８６５号明細書、欧州特許出願公開第５４２３８８号明細書、英国特許出願公開第２１２３４２０号明細書、米国特許第５，１６７，６９１号明細書、同第５，１９８，０１４号明細書、同第５，２５０，５０４号明細書、国際特許出願公開第８３／００３３１号パンフレット及び同第９４／０８９９９号パンフレット）。
【００５１】
式（Ｖ）は、式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ｂ）及び（ｃ）における出発物質として使用される無水カルボン酸の一般的定義を与える。式（Ｖ）中、R^1は好ましくは本発明の式（Ｉ）を有する化合物の記載に関連して好ましい、特に好ましい、非常に好ましいR^1として上記した意味を有する。
【００５２】
一般式（Ｖ）を有する出発物質は合成用の公知の有機化合物である。
【００５３】
式（ＶＩ）は、式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ｄ）における出発物質として使用される５－アシルアミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドの一般的定義を与える。式（ＶＩ）中、Ｑ及びR^1は好ましくは本発明の式（Ｉ）を有する化合物の記載に関連して好ましい、特に好ましい、非常に好ましいＱ及びR^1として上記した意味を有する。
【００５４】

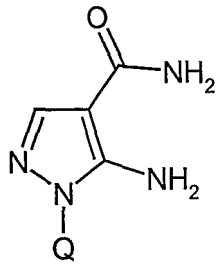
１－（２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルチオフェニル）－５－プロピオニル－アミノピラゾール－４－カルボキサミド（ドイツ国特許出願公開第３４２０９８５号明細書）を除いて、一般式（ＶＩ）を有する出発物質は今まで文献に記載されておらず、１－（２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルチオフェニル）－５－プロピオニル－アミノピラゾール－４－カルボキサミドを除いて、それらは新規物質として本発明の主題の一部をなす。

【００５５】

式（ＶＩ）を有する新規な５－アシルアミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドは、適当ならば反応助剤（例えば、水素化ナトリウム、炭酸カリウムまたはピリジン）の存在下及び適当ならば希釈剤（例えば、アセトニトリル）の存在下で一般式（ＩＩ）：

【００５６】

【化２８】



(II)

（式中、Ｑは上記と同義である）

を有する５－アミノ－１－アリールピラゾール－４－カルボキサミドを一般式（ＩＸ）：

$$X^1-R^1 \qquad (IX)$$

（式中、R^1 は上記と同義であり、X^1 はハロゲン、特にフッ素、塩素または臭素を表す）

を有するアシル化剤と０～１００℃の温度で反応させることにより（製造例参照）得られる。

【００５７】

上記方法で使用される一般式（ＩＸ）を有する化合物は合成用の公知の化学物質である。

【００５８】

式（Ｉｂ）は、式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ｅ）における出発物質として使用される置換ピラゾロピリミジン－４－オンの一般的定義を与える。式（Ｉｂ）中、Ｑ及びR^1 は好ましくは本発明の式（Ｉ）を有する化合物の記載に関連して好ましい、特に好ましい、非常に好ましいＱ及びR^1 として上記した意味を有する。

【００５９】

式（Ｉｂ）を有する出発物質は新規物質として本発明の主題の一部をなし、それらは本発明の方法（ａ）～（ｄ）により製造され得る。

【００６０】

式（ＶＩＩ）及び（ＶＩＩＩ）は、式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ｅ）における出発物質として使用されるアルキル化剤、アルケニル化剤またはアルキニル化剤の一般的定義を与える。式（ＶＩＩ）及び（ＶＩＩＩ）中、R^2 は好ましくは本発明の式（Ｉ）を有する化合物の記載に関連して好ましい、特に好ましい、非常に好ましいR^2 として上記した意味を有し、式（ＶＩＩ）中のＸは好ましくはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素、特に塩素または臭素を表す。

【００６１】

式（ＶＩＩ）及び（ＶＩＩＩ）を有する出発物質は合成用の公知の有機化合物である。

【００６２】

本発明の方法（ｄ）は縮合剤を用いて実施される。適当な縮合剤は特に塩基性化合物である。これらには、特にアンモニア；アミン、例えばメチルアミン、エチルアミン、ｎ－もしくはｉ－プロピルアミン、ｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブチルアミン、ジメチルアミン、ジエチルアミン、ジプロピルアミンまたはジブチルアミン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミンまたはトリブチルアミン；アルカリ金属またはアルカリ土類金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化マグネシウムまたは水酸化カルシウム；またはアルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、ナトリウムｎ－もしくはｉ－プロポキシド、ナトリウムｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシド、カリウムメトキシド、カリウムエトキシド、カリウムｎ－もしくはｉ－プロポキシド、カリウムｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシドが含まれる。

【００６３】

一般式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ａ）、（ｂ）、（ｃ）及び（ｅ）を１つ以上の反応助剤を用いて実施することが好ましい。本発明の方法（ａ）、（ｂ）、（ｃ）及び（ｅ）に対する適当な反応助剤は通常慣用されている無機または有機の塩基または酸受容体である。これらには、好ましくはアルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、アミド、炭酸塩、重炭酸塩、水素化物、水酸化物またはアルコキシド（例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウムまたは酢酸カルシウム；リチウムアミド、ナトリウムアミド、カリウムアミドまたはカルシウムアミド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸カルシウム；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムまたは重炭酸カルシウム；水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムまたは水素化カルシウム；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムまたは水酸化カルシウム；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、ナトリウムｎ－もしくはｉ－プロポキシドまたはナトリウムｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシド；カリウムメトキシド、カリウムエトキシド、カリウムｎ－もしくはｉ－プロポキシドまたはカリウムｎ－，ｉ－，ｓ－もしくはｔ－ブトキシド）及び塩基性有機窒素化合物（例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、Ｎ，Ｎ－ジメチルシクロヘキシルアミン、ジシクロヘキシルアミン、エチルジシクロヘキシルアミン、Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン、Ｎ，Ｎ－ジメチルベンジルアミン、ピリジン、２－メチル－，３－メチル－，４－メチル－，２，４－ジメチル－，２，６－ジメチル－，３，４－ジメチル－及び３，５－ジメチルピリジン、５－エチル－２－メチルピリジン、４－ジメチルアミノピリジン、Ｎ－メチルピペリジン、１，４－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン（ＤＡＢＣＯ）、１，５－ジアザビシクロ［４．３．０］ノン－５－エン（ＤＢＮ）または１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン（ＤＢＵ））が含まれる。

【００６４】

一般式（Ｉ）を有する化合物を製造するための本発明の方法（ａ）～（ｅ）を１つ以上の希釈剤を用いて実施することが好ましい。本発明の方法を実施するための適当な希釈剤は特に不活性有機溶媒である。これらには、特にハロゲン化されていてもよい脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素類、例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、クロロホルムまたは四塩化炭素；エーテル類、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランまたはエチレングリコールジメチルエーテルまたはエチレングリコールジエチルエーテル；ケトン類、例えばアセトン、ブタノンまたはメチルイソブチルケトン；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリルまたはブチロニトリル；アミド類、例えばＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルホルムアニリド、Ｎ－メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル類、例えば酢酸メチルまたは酢酸エチル；スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシド；アルコール類、例えばメタノール、エタノール、ｎ－またはｉ－プロパノール、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテルまたはジエチレングリコールモノエチルエーテル；その水または純水との混合物が含まれる。

【００６５】
本発明を実施する際、反応温度は比較的広範囲で変更され得る。通常、方法は－３０～＋１５０℃、好ましくは０～１２０℃の温度で実施される。
【００６６】
本発明の方法は通常大気圧下で実施される。しかしながら、本発明の方法は高圧または減圧下、通常０．１～１０バールの圧力で実施され得る。
【００６７】
本発明の方法を実施するために、出発物質は通常ほぼ等モル量で使用される。しかしながら、成分の１方を比較的大過剰量使用することも可能である。反応は通常反応助剤の存在下に適当な希釈剤中で実施され、反応混合物は通常必要な温度で数時間撹拌する。後処理は通常の方法で実施される（製造例参照）。
【００６８】
本発明の活性化合物は落葉剤、乾燥剤、殺桿剤、及び特に除草剤として使用され得る。雑草は広義に望ましくない場所で生長しているすべての植物を指すと理解される。本発明の化合物が総合的または選択的除草剤として作用するかは特にその使用量に依存する。
【００６９】
本発明の活性化合物は、例えば下記植物において使用され得る。
【００７０】
以下の属の双子葉雑草：イチビ、ヒユ、ブタクサ、アノダ、カミツレ、イワムシロ、ハマアカザ、ヒナギク、センダングサ、ナズナ、ヒレアザミ、カワラケツメイ、ヤグルマギク、アカザ、アザミ、セイヨウヒルガオ、チョウセンアサガオ、ヌスビトハギ、Ｅｍｅｘ、エゾスズシロ、トウダイグサ、チシマオドリコソウ、ハキダメギク、ヤエムグラ、フヨウ、サツマイモ、ホウキギ、オドリコソウ、マメグンバイナズナ、アゼナ、シカギク、ハッカ、ヤマアイ、ザクロソウ（Ｍｕｌｌｕｇｏ）、ワスレナグサ、ケシ、アサガオ、オオバコ、タデ、スベリヒユ、キンポウゲ、ダイコン、イヌガラシ、キカシグサ、ギシギシ、オカヒジキ、キオン、ツノクサネム、キンゴジカ、シロガラシ、ナス、ハチジョウナ、ナカボノウルシ、ハコベ、タンポポ、グンバイナズナ、シャジクソウ、イラクサ、クワガタソウ、スミレ、オナモミ。
【００７１】
以下の属の双子葉作物：ナンキンマメ、フダンソウ、カンラン、キウリ、カボチャ、ヒマワリ、ニンジン、ダイズ、ワタ、サツマイモ、アキノノゲシ、アマ、トマト、タバコ、インゲン、エンドウ、ジャガイモ、ソラマメ。
【００７２】
以下の属の単子葉雑草：ヤギムギ、カモジグサ、コヌカグサ、スズメノテッポウ、Ａｐｅｒａ、カラスムギ、ニクキビ、スズメノチャヒキ、クリノイガ、ツユクサ、ギヨウギシバ、カヤツリグサ、タツノツメガヤ、メヒシバ、ヒエ、ハリイ、オヒシバ、スズメガヤ、ナルコビエ、ウシノケグサ、テンツキ、アメリカコナギ、チガヤ、カモノハシ、アゼガヤ、ドクムギ、ミズアオイ、キビ、スズメノヒユ、クサヨシ、アワガエリ、イチゴツナギ、ツノアイアシ、オモダカ、ホタルイ、エノコログサ、モロコシ。
【００７３】
以下の属の単子葉作物：ネギ、バイナップル、クサスギカズラ、カラスムギ、オオムギ、イネ、キビ、サトウキビ、ライムギ、モロコシ、ライコムギ、コムギ、トウモロコシ。
【００７４】
しかしながら、本発明の活性化合物の使用は決して上記属に限定されず、他の植物にも同様に敷衍される。
【００７５】
本発明の活性化合物は、濃度に応じて、例えば産業地や線路、植樹されている歩道やエリア、植樹されていない歩道やエリアに生えている雑草を完全に防除するために適している。また、本発明の活性化合物は多年生作物、例えば森林、装飾的植栽、果樹園、ぶどう園、柑橘類の果樹園、ナッツ園、バナナ園、コーヒー園、茶畑、ゴム園、アブラヤシ園、

カカオ園、小果樹農園及びホップ畑における；芝生、芝地や牧草地上の雑草を防除するため、一年生作物中の雑草を選択的に防除するために使用され得る。

【００７６】

本発明の式（Ｉ）を有する化合物は土壌及び植物の地上部分に使用したときに強い除草活性及び広い活性スペクトルを有する。ある程度、本発明の式（Ｉ）を有する化合物は発生前及び発生後処理方法により単子葉及び双子葉作物中の単子葉及び双子葉雑草を選択的に防除するためにも適している。

【００７７】

ある濃度または施用量では、本発明の活性化合物は動物病害生物並びに真菌性または細菌性疾患を防除するためにも使用され得る。適当ならば、本発明の活性化合物は他の活性化合物を合成するための中間体または前駆体としても使用され得る。

【００７８】

本発明によれば、すべての植物及び植物の一部を処理することができる。本明細書中、植物とは、所望するもののみならず所望しない野生植物または作物（天然に存在する作物をも含む）のようなすべての植物及び植物集団と理解される。作物は、慣用の育種及び最適化方法により、またはバイオテクノロジー及び組換え方法により、またはこれらの方法の組合せにより得ることができる植物であり得、この中にはトランスジェニック植物及び植物育種家の権利により保護され得るまたは保護され得ない植物品種が含まれる。植物部分とは、苗、葉、花及び根のような植物の地上及び地下部分及び器官すべてを意味し、その例として桿、針葉、茎、幹、花、子実体、果実、種子、並びに根、塊茎及び根茎が挙げられ得る。植物部分には収穫物及び栄養繁殖物、生殖繁殖物、例えば挿し木、塊茎、根茎、小さい球根及び種子も含まれる。

【００７９】

本発明による活性化合物を用いる植物及び植物部分の処理は直接実施してもよく、または一般的な処理方法、例えば含浸、噴霧、蒸発、煙霧、散布、塗布により、繁殖材料、特に種子の場合には１つ以上のコートを適用することにより周囲、環境または貯蔵スペースに化合物を作用させることにより実施してもよい。

【００８０】

活性化合物を一般的な製剤、例えば溶液、乳濁液、水和剤、懸濁液、粉剤、ダスト、ペースト剤、可溶性粉末、粒剤、懸濁液－乳濁液濃厚物、活性化合物を含浸させた天然及び合成物質並びにポリマー物質へのマイクロカプセル化に変換させてもよい。

【００８１】

製剤は公知の方法により、例えば活性化合物と液体溶媒及び／または固体担体である増量剤とを場合により乳化剤及び／または分散剤及び／または発泡剤である界面活性剤を用いて混合することにより調製される。

【００８２】

使用する増量剤が水のとき、例えば補助溶媒として有機溶媒を使用してもよい。本質的に、好適な液体溶媒は芳香族類（例えば、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン）、塩素化芳香族類または塩素化脂肪族炭化水素類（例えば、クロロベンゼン、クロロエチレンまたはジクロロメタン）、脂肪族炭化水素類（例えば、シクロヘキサンまたは鉱油分画のようなパラフィン）、鉱油及び植物油類、アルコール類（例えば、ブタノールまたはグリコール）並びにそのエーテル類及びエステル類、ケトン類（例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノン）、強極性溶媒（例えば、ジメチルホルムアミドまたはジメチルスルホキシド）、または水である。

【００８３】

好適な固体担体の例は、アンモニウム塩、粉砕天然鉱物（例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土）及び粉砕合成材料（例えば、高分散シリカ、アルミナ及びシリケート）である。粒剤用の好適な固体担体の例は、粉砕・分画化天然岩（例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及び苦灰石）、無機及び有機鉱物の合成顆粒、有機材料の顆粒（例えば、おが屑、ヤシ殻、トウモロ

コシ穂軸及びタバコの茎）である。好適な乳化剤及び／または発泡剤の例は、ノニオン性及びアニオン性乳化剤（例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、アルキルアリールポリグリコールエーテルのようなポリオキシエチレン脂肪族アルコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネート）、またはタンパク質水解物である。好適な分散剤の例は、リグノサルフィト廃液及びメチルセルロースである。

【００８４】

カルボキシメチルエルロースや粉末、顆粒またはラテックスの形態の天然及び合成ポリマーのような増粘剤、例えばアラビアガム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル；天然リン脂質、例えばセファリン及びレシチン；及び合成リン脂質を製剤中に使用することができる。他の添加剤は鉱油及び植物油である。

【００８５】

無機顔料（例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー）及び有機顔料（例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料）のような着色剤及び微量栄養素（例えば、鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩）を使用することができる。

【００８６】

製剤は通常０．１～９５重量％、好ましくは０．５～９０重量％の活性化合物を含む。

【００８７】

雑草を防除するために、そのままままたは製剤の形の本発明の活性化合物は公知の除草剤及び／または作物の相容性を改善させる物質（緩和剤“ safener ”）との混合物としても使用され得る。最終製品またはタンクミックスも考えられる。１つ以上の除草剤と緩和剤からなる殺草剤との混合物も考えられる。

【００８８】

混合物に対する適当な成分は公知の除草剤である。例えば、アセトクロール、アシフロルフェン（－ナトリウム）、アクロニフェン、アラクロール、アロキシジム（－ナトリウム）、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロール、アミドスルフロン、アニロホス、アスラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロン、ベフルブタミド、ベナゾリン（－エチル）、ベンフレセート、ベンスルフロン（－メチル）、ベンタゾン、ベンズフェンジゾン、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナップ、ベンゾイルプロップ（－エチル）、ビアラホス、ビフェノックス、ビスピリバック（－ナトリウム）、ブロモブチド、ブロモフェノキシム、ブロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル（－アリル）、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カロキシジム、カルベタミド、カルフェントラゾン（－エチル）、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロリダゾン、クロリムロン（－エチル）、クロルニトロフェン、クロルスルフロン、クロロトルロン、シニドン（－エチル）、シンメチリン、シノスルフロン、クレホキシジム、クレソジム、クロジナホップ（－プロパルギル）、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラスルフロン（－メチル）、クロランスラム（－メチル）、クミルロン、シナジン、シブチレン、シクロエート、シクロスルファムロン、シクロキシジム、シハロホップ（－ブチル）、２，４－Ｄ、２，４－ＤＢ、デスメジファム、ジアレート、ジカンバ、ジクロロプロップ（－Ｐ）、ジクロホップ（－メチル）、ジクロスラム、ジエタチル（－エチル）、ジフェンゾクアット、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロン、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメキシフラム、ジニトラミン、ジフェナミド、ジクワット、ジチオピル、ジウロン、ジムロン、エプロヘポダン、ＥＰＴＣ、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメツルフロン（－メチル）、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシスルフロン、エトベンザニド、フェノキサプロップ（－Ｐ－エチル）、フェントラザミド、フラムプロップ（－イソプロピル、－イソプロピル－Ｌ、－メチル）、フラザスルフロン、フロラスラム、フルアジホップ（－Ｐ－ブチル）、フルアゾレート、フルカルバゾン（－ナトリウム）、フルフェナセット、フルフェンピル、フルメツラム、フルミクロラック（－ペンチル）、フルミオキサジン、フルミプロピン、フルメツラム、フロメツロン、フルオロクロリドン、フルオログリコフェン（－エチル）、フルポ

キサム、フルプロパシル、フルルピルスルフロン（－メチル、－ナトリウム）、フルレノール（－ブチル）、フルリジン、フルロキシピル（－ブトキシプロピル、－メプチル）、フルルピリミドール、フルルタモン、フルチアセト（－メチル）、フルチアミド、ホメサフェン、ホラムスルフロン、グルホシネート（－アンモニウム）、グリホサート（－イソプロピルアンモニウム）、ハロサフェン、ハロキシホップ（－エトキシエチル、－Ｐ－メチル）、ヘキサジノン、イマザメタベンズ（－メチル）、イマザメタピル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキイン、イマゼサピル、イマザスルフロン、ヨードスルフロン（－メチル、－ナトリウム）、イオキシニル、イソプロパリン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサクロロトール、イソキサフルトール、イソキサピリホップ、ケトスピラドックス、ラクトフェン、レナシル、リニュロン、ＭＣＰＡ、メコプロップ、メフェナセット、メソトリオン、メタミトロン、メタザクロール、メサベンズチズロン、メトベンズロン、メトブロムロン、（α）メトラクロール、メトスラム、メトキスロン、メトリブジン、メツルフロン（－メチル）、モリネート、モノリヌロン、ナプロアニリド、ナプロパミド、ネブロン、ニコスルフロン、ノルフルラゾン、オルベンカルブ、オリザリン、オキサジアルジル、オキサジアゾン、オキサスルフロン、オキサジクロメホン、オキシフルオロフェン、パラクワット、ペラルゴン酸、ペンディメタリン、ペンドラリン、ペノキシスラム、ペントキサゾン、ペソキサミド、フェンメディファム、ピコリナフェン、ピペロホス、プレチラクロール、プリミスルフロン（－メチル）、プロフルアゾール、プロホキシジム、プロメトリン、プロパクロール、プロパニル、プロパキザホップ、プロピソクロール、プロポキシカルバゾン（－ナトリウム）、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロン、ピラフルフェン（－エチル）、ピラゾジル、ピラゾレート、ピラゾスルフロン（－エチル）、ピラゾキシフェン、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリデート、ピリダトール、ピリフタリド、ピリミノバック（－メチル）、ピリチオバック（－ナトリウム）、キンクロラック、キンメラック、キノクラミン、キザロホップ（－Ｐ－エチル、－Ｐ－テフリル）、リムスルフロン、セトキシジム、シマジン、シメトリン、スルコトリオン、スルフェントラゾン、スルホメツロン（－メチル）、スルホセート、スルホスルフロン、テブタム、テブチウロン、テプラロキシジム、テルブチラジン、テルブチリン、テニルクロール、チアフラミド、チアゾピル、チジアジミン、チフェンスルフロン（－メチル）、チオベンゾカルブ、チオカルバジル、トラルコキシジム、トリアレート、トリアスフロン、トリベヌロン（－メチル）、トリクロピル、トリジファン、トリフルラリン、トリフロキシスルフロン、トリフルスルフロン（－メチル）、トリトスルフロン。

【００８９】

更に、ＡＤ－６７、ＢＡＳ－１４５１３８、ベノキサコル、クロキントセット（－メキシル）、シオメトリニル、２，４－Ｄ、ＤＫＡ－２４、ジクロルミド、ジムロン、フェンクロリム、フェンクロラゾル（－エチル）、フルラゾル、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン（－エチル）、ＭＣＰＡ、メコプロップ（－Ｐ）、メフェンピル（－ジエチル）、ＭＧ－１９１、オキサベトリニル、ＰＰＧ－１２９２、Ｒ－２９１４８のような公知の緩和剤も混合するのに適している。

【００９０】

他の公知の活性化合物、例えば真菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、鳥忌避剤、植物栄養素及び土壌構造改善剤との混合物も可能である。

【００９１】

活性化合物はそのまま、製剤の形態で、または更に希釈することにより製造される使用形態（例えば、用時使用される溶液、懸濁液、乳濁液、粉末、ペースト及び顆粒）で使用し得る。これらは慣用の方法で、例えば灌水、散布、噴霧または全面散布により使用される。

【００９２】

本発明の活性化合物は植物の発生前または発生後に施用され得る。本発明の活性化合物はまた播種前に土壌に取り込まれ得る。

【００９３】
使用される活性化合物の量は比較的広範囲で変更され得る。その量は本質的に所望効果の種類に依存する。通常、使用量は土壌表面１ヘクタールあたり１～１０ｋｇの活性化合物、好ましくは５～５ｋｇの活性化合物である。
【００９４】
上記したように、すべての植物及びその一部を本発明に従って処理することができる。好ましい実施態様では、野生植物種及び植物栽培品種、または交配またはプロトプラスト融合のような一般的な生物学的育種により得られる品種が処理される。更に好ましい実施態様では、遺伝子工学操作に場合により慣用の方法を組み合わせて得られるトランスジェニック植物及び植物栽培品種（遺伝子修飾生物）またはその一部を処理する。「一部」、「植物の一部」または「植物部分」は前に説明したとおりである。
【００９５】
特に好ましくは、市販されているかまたは使用されている植物栽培品種の植物を本発明に従って処理する。植物栽培品種とは、従来の育種法、突然変異誘発または組換えＤＮＡ技術を用いて生長させた新しい性質（形質）を有する植物を意味すると理解されたい。これらは栽培品種、生物型及び遺伝子型であり得る。
【００９６】
植物種または植物栽培品種、その場所及び生長条件（土壌、気候、生育期、飼料）に応じて、本発明の処理により相加（相乗）効果をも得ることができる。例えば、施用量の少量化及び／または活性スペクトルの拡大及び／または本発明に従って使用される物質及び組成物（他の農化学化合物との組合せを含む）の活性の上昇、良好な作物成長、作物の高温または低温に対する高い耐性、作物の干ばつ、または水または土壌塩濃度に対する高い耐性、より高い開花性能、より容易な収穫、早い成熟、より高い収穫物収率、収穫物のより良好な品質及び／またはより高い栄養価、収穫物のより良好な貯蔵安定性及び／または加工性を実際予想される効果以上に発揮することができる。
【００９７】
本発明により好ましく処理されるトランスジェニック植物または植物栽培品種（すなわち、遺伝子工学により得られる品種）には、遺伝子修飾で植物に対して特に有用な性質（形質）を付与する遺伝子材料を含む植物すべてが含まれる。そのような性質の例はより良好な植物生長；高温または低温に対するより高い耐性；干ばつ、または水または土壌塩濃度に対するより高い耐性；より高い開花性能；より容易な収穫；早い成熟；より高い収穫物収率；収穫物のより良好な品質及び／またはより高い栄養価；収穫物のより良好な貯蔵安定性及び／または加工性である。更に特に強調すべき性質は動物や微生物害虫、例えば昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌及び／またはウイルスに対する植物のより高い防御効果、並びにある除草活性化合物に対する植物のより高い耐性である。トランスジェニック植物の例として重要な作物、例えば穀物（小麦、米）、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿、菜種；及び果実植物（リンゴ、ナシ、柑橘、ブドウの果実を付けた植物）が挙げられ得、特にトウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿及び菜種が強調される。強調される形質は、特に植物中で形成される毒素、特にバシラス・チュリンジエンシス由来の遺伝子材料（例えば、ＣｒｙＩＡ（ａ）、ＣｒｙＩＡ（ｂ）、ＣｒｙＩＡ（ｃ）、ＣｒｙＩＩＡ、ＣｒｙＩＩＩＡ、ＣｒｙＩＩＩＢ２、Ｃｒｙ９ｃ、Ｃｒｙ２Ａｂ、Ｃｒｙ３Ｂｂ及びＣｒｙＩＦ、及びその組合せ）により植物（以下、“Ｂｔ植物”という）中に形成されるものによる昆虫に対する植物の高い防御である。同様に特に強調される形質は、浸透獲得耐性（ＳＡＲ）、システミン、フィトアレキシン、エリシター及び耐性遺伝子、並びに対応発現タンパク質及び毒素による真菌、細菌及びウイルスに対する植物の高い耐性である。更に特に強調される形質は、ある除草活性化合物、例えばイミダゾリノン、スルホニル尿素、グリホサートまたはホスフィノトリシン（例えば、“ＰＡＴ”遺伝子）に対する植物の高い耐性である。所望形質を与える遺伝子をトランスジェニック植物中に相互に組み合わせて存在させてもよい。“Ｂｔ植物”の例としてはトウモロコシ品種、綿品種、大豆品種及びジャガイモ品種が挙げられ得、これらはＹＩＥＬＤ　ＧＡＲＤ（登録商標）（例えば、

トウモロコシ、綿、大豆）、ＫｎｏｃｋＯｕｔ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、ＳｔａｒＬｉｎｋ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Ｂｏｌｌｇａｒｄ（登録商標）（綿）、Ｎｕｃｏｔｏｎ（登録商標）（綿）、ＮｅｗＬｅａｆ（登録商標）（ジャガイモ）の商品名で販売されている。除草剤耐性植物の例としてはトウモロコシ品種、綿品種及び大豆品種が挙げられ得、これらはＲｏｕｎｄｕｐ　Ｒｅａｄｙ（登録商標）（グリホサートに対する耐性、例えばトウモロコシ、綿、大豆）、Ｌｉｂｅｒｔｙ　Ｌｉｎｋ（登録商標）（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば菜種）、ＩＭＩ（登録商標）（イミダゾリノンに対する耐性）及びＳＴＳ（登録商標）（スルホニル尿素に対する耐性、例えばトウモロコシ）の商品名で販売されている。例示し得る除草剤耐性植物（除草剤耐性のために慣用の方法で育成した植物）には、Ｃｌｅａｒｆｉｅｌｄ（登録商標）（例えば、綿）の商品名で販売されている品種が含まれる。勿論、これらの記述は上記遺伝子形質またはなお開発中の遺伝子形質を有する植物品種に対しても適用される。これらの植物品種は将来開発され及び／または市販されるであろう。

【００９８】

上記した植物は本発明に従って式（Ｉ）を有する化合物または本発明の活性化合物混合物を用いて特に有利な方法で処理され得る。この場合、雑草植物の効果的防除に加えて、トランスジェニック植物または植物栽培品種との上記した相乗効果が生ずる。活性化合物または混合物について上記した好ましい範囲はこれらの植物の処理にも適用される。植物が本明細書に特記した化合物または混合物で処理されることが強調される。

【００９９】

本発明の活性化合物は動物有害生物、特に農業、森林、保存品や材料の保護の際及び衛生部門において遭遇する昆虫類、クモ形類及び線虫類を防除するためにも適している。

【０１００】

本発明の活性化合物を作物防護剤として使用することが好ましい。本発明の活性化合物は通常の感受性及び耐性種及びすべての発育段階に対して有効である。

【０１０１】

殺虫剤、殺ダニ剤または殺線虫剤として使用する場合、本発明の活性化合物は更に市販の製剤、前記製剤から調製される使用形態、相乗剤との混合物中に存在させ得る。相乗剤は、添加する相乗剤それ自体が活性である必要はなく活性化合物の活性を高める化合物である。

【０１０２】

市販製剤から調製される使用形態の活性化合物の含量は広範囲で変更され得る。使用形態の活性化合物の濃度は０．０００００００１～９５重量％、好ましくは０．０００１～１重量％の活性化合物であり得る。

【０１０３】

使用形態に適した方法で施用され得る。

【０１０４】

本発明の式（Ｉ）を有する活性化合物は、農業生産家畜（例えば、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、水牛、家兎、トリ、七面鳥、アヒル、ガチョウ及びハチ）、他のペット（例えば、イヌ、ネコ、かごで飼われる鳥及びアクアリウムフィッシュ）及び所謂実験動物（例えば、ハムスター、モルモット、ラット及びマウス）に群がる節足動物を防除するためにも適している。本発明の活性化合物を使用することによりより経済的且つ容易に畜産をすることができるようにこれらの節足動物を防除することにより死亡例及び（肉、乳、羊毛、皮革、卵、蜜等の）生産性の低下を抑えなければならない。

【０１０５】

本発明の活性化合物は公知の方法で、例えば錠剤、カプセル剤、水剤、飲薬、顆粒剤、ペースト剤、ボーラス、フィードスループロセスや懸濁液の形態での経腸投与により、例えば注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）やインプラントのように非経口投与により、鼻内投与により、例えば液浸、水浴、スプレー、注入、スポット、洗浄や散布の形態の皮膚使用により、活性化合物を含有する成形体、例えばカラー、耳マーカー、尾マーカー

、脚バンド、ホールター、マーキングデバイス等を用いて獣医部門で使用される。

【０１０６】

ウシ、家禽、ペット等に使用する場合、式（Ｉ）を有する活性化合物は１～８０重量％の量の活性化合物を含む製剤（例えば、粉末、乳濁液、自由流動性組成物）として直接または１００～１０，０００倍希釈後に使用され得る。或いは、式（Ｉ）を有する活性化合物は化学浴として使用され得る。

【０１０７】

活性化合物は、密閉空間（例えば、平地、工場、事務所、車両等）において遭遇する動物有害生物、特に昆虫類、クモ形類及びダニ類を防除するためにも適している。これらの有害生物を防除するために、活性化合物はそれ自体でまたは家庭用殺虫剤中の他の活性化合物及び助剤と組み合わせて使用され得る。これらの化合物は感受性及び耐性種及びすべての発達段階に対して活性である。

【０１０８】

活性化合物はエアゾール、無圧スプレー製品（例えば、ポンプやアトマイザースプレー）、自動煙霧システム、煙霧機、フォーム、ゲル、セルロースまたはポリマーからなる蒸発用錠剤、液体蒸発装置、ゲル及び膜蒸発装置、噴射剤駆動蒸発剤、非エネルギーまたは受動的蒸発システムを含む蒸発製品、蛾ペーパー、蛾バッグ、蛾ゲル、顆粒剤、ダスト、散布用餌または餌ステーションでの餌の形で使用される。

【０１０９】

本発明の活性化合物の製造及び使用を下記実施例により説明する。

【実施例】

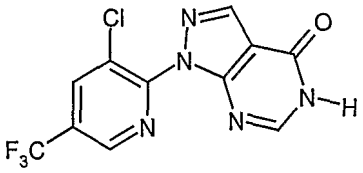
【０１１０】

製造例

（実施例１）

【０１１１】

【化２９】



方法（ａ）

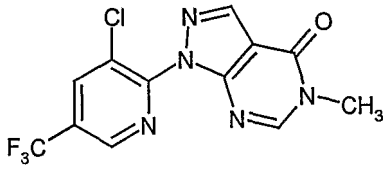
５－アミノ－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）ピラゾール－４－カルボキサミド（０．７０ｇ，０．２９ミリモル）、オルトギ酸トリメチル（０．２７ｇ，２．５２ミリモル）、ｐ－トルエンスルホン酸（０．１０ｇ）及びトルエン（８０ｍｌ）の混合物を還流下で１２時間撹拌する。次に、混合物に更にオルトギ酸トリメチル（０．１４ｇ）を添加し、混合物を還流下で更に１２時間撹拌する。冷却後、混合物を濾過し、濾液を減圧下で濃縮する。残渣をイソプロパノールと一緒に粉砕し、生じた結晶性生成物を吸引濾過により単離する。こうして、０．３２ｇ（理論収量の４４％）の１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（融点＝３３１℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝１．５４）を得る。

【０１１２】

（実施例２）

【０１１３】

【化３０】



方法（ｅ）

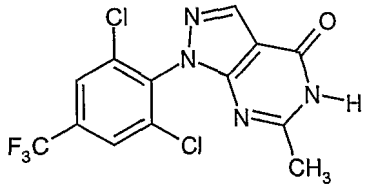
１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（０．２１ｇ，０．６６５ミリモル）、炭酸カリウム（０．１１ｇ，０．８０ミリモル）、ヨウ化メチル（０．１０ｇ，０．７３ミリモル）及びアセトニトリル（４０ｍｌ）の混合物を２０～２５℃で１２時間撹拌した後、減圧下で濃縮する。次に、残渣を水と一緒に撹拌し、濃塩酸で酸性化し、生じた結晶性生成物を吸引濾過により単離する。こうして、０．１２ｇ（理論収量の５５％）の１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－５－メチル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（融点＝２５３℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝１．７６）を得る。

【０１１４】

（実施例３）

【０１１５】

【化３１】



方法（ｃ）

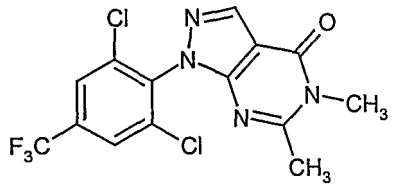
５－アミノ－１－（２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルフェニル）ピラゾール－４－カルボキサミド（１．３６ｇ，４．０ミリモル）、無水酢酸（０．６１ｇ，６ミリモル）及びキシレン（５０ｍｌ）の混合物を還流温度で８時間撹拌した後、減圧下で濃縮する。油状残渣をｎ－プロパノールと一緒に粉砕し、生じた結晶性生成物を吸引濾過により単離する。こうして、０．４８ｇ（理論収量の３０％）の１－（２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルフェニル）－６－メチル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（融点＝３００℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝２．２５）を得る。

【０１１６】

（実施例４）

【０１１７】

【化３２】



方法（ｅ）

１－（２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルフェニル）－６－メチル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］ピリミジン－４－オン（０．３８ｇ，１．０４ミリモル）、ヨウ化メチル（０．２２ｇ，１．５６ミリモル）、炭酸カリウム（０．２２ｇ，１．

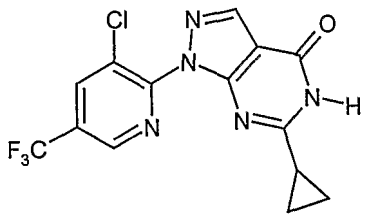
５６ミリモル）及びジメチルホルムアミド（３０ｍｌ）の混合物を２０～２５℃で６時間撹拌した後、減圧下で濃縮する。残渣を水と一緒に撹拌し、濃塩酸で酸性化する。生じた結晶性生成物を吸引濾過により単離する。こうして、０．３０ｇ（理論収量の７５．５％）の１－（２，６－ジクロロ－４－トリフルオロメチルフェニル）－５，６－ジメチル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（融点＝１９５℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝２．６９）を得る。

【０１１８】

（実施例５）

【０１１９】

【化３３】



方法（ｂ）

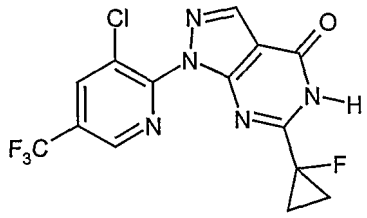
５－アミノ－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）ピラゾール－４－カルボニトリル（２．８８ｇ，１０ミリモル）、無水シクロプロパンカルボン酸（２．０ｇ，１３ミリモル）、濃硫酸（４滴）及びトルエン（８０ｍｌ）の混合物を還流下で３時間撹拌した後、減圧下で濃縮する。残渣をイソプロパノールと一緒に粉砕し、生じた結晶性生成物を吸引濾過により単離する。こうして、１．４ｇ（理論収量の３８％）の１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－６－シクロプロピル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（融点＝２３９℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝２．１９）を得る。

【０１２０】

（実施例６）

【０１２１】

【化３４】



方法（ｄ）

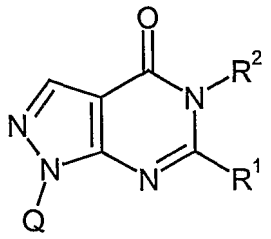
５－（１－フルオロシクロプロピルカルボニルアミノ）－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）ピラゾール－４－カルボキサミド（０．２９ｇ，０．７４ミリモル）、濃アンモニア水（２０ｍｌ）及びエタノール（３０ｍｌ）の混合物を還流下で６時間加熱する。室温（約２０℃）に冷却した後、混合物を酢酸エチルで抽出し、有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過する。濾液から溶媒を減圧下で注意深く留去させる。こうして、３８ｍｇ（理論収量の１２．５％）の６－（１－フルオロシクロプロピル）－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］－ピリミジン－４－オン（融点＝２１１℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝２．２９）を得る。

【０１２２】

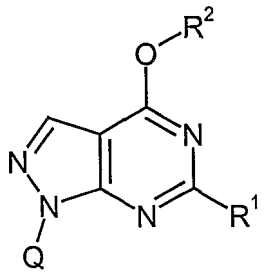
実施例１～６と同様にし、本発明の製造方法の一般的記載に従って、例えば下表１にリストした一般式（Ｉ）及び（Ｉａ）の化合物も製造することができる。

【０１２３】

【表１】

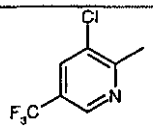
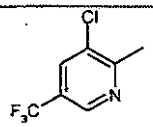
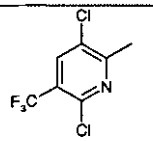
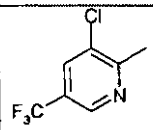
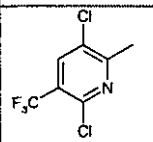
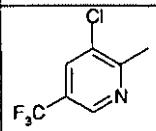
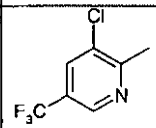


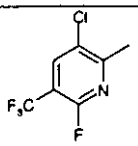
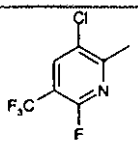
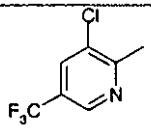
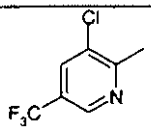
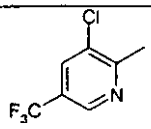
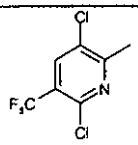
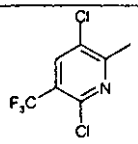
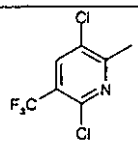
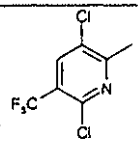
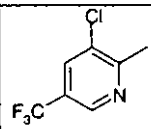
(I)

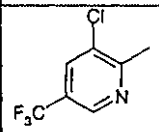
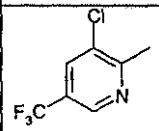
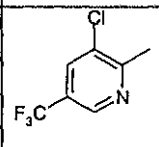
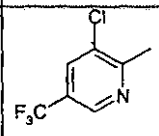
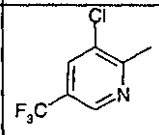
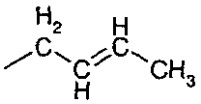
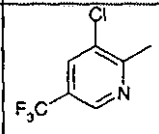
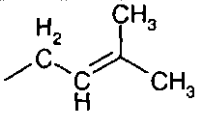
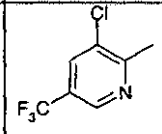
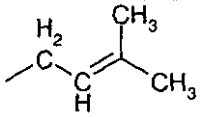
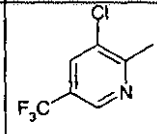
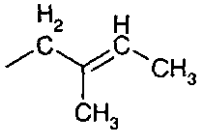
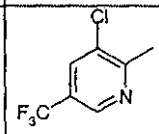
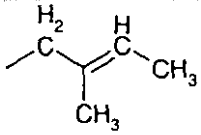
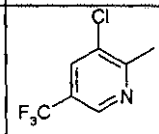
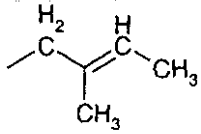


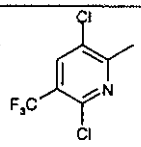
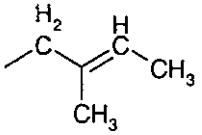
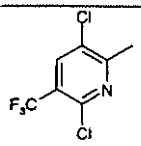
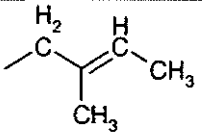
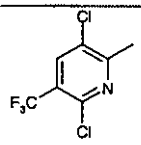
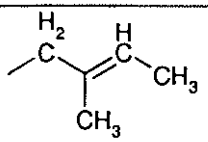
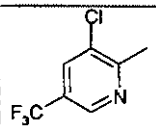
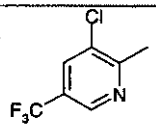
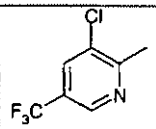
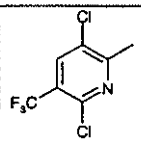
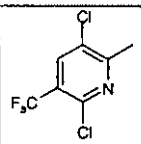
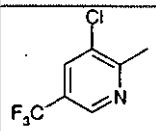
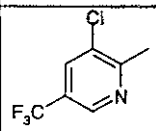
(Ia)

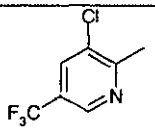
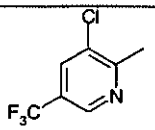
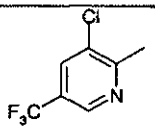
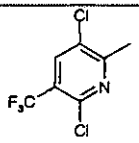
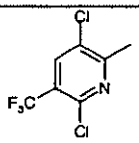
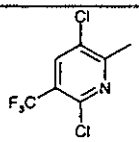
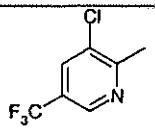
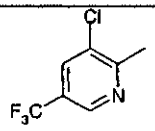
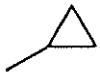
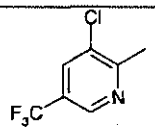
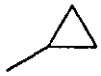
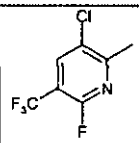
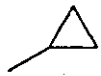
表１：式（Ｉ）及び（Ｉａ）を有する化合物の例

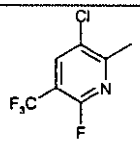
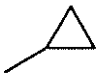
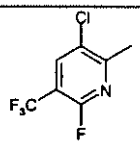
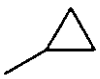
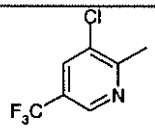
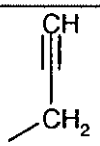
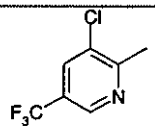
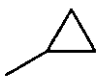
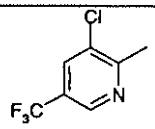
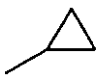
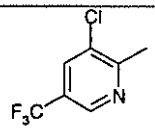
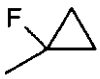
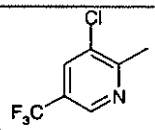
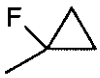
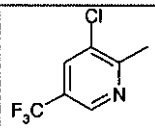
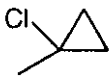
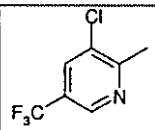
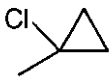
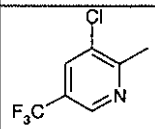
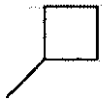
実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
7		CH_3	H	(I) logP = 1.64 [a)]
8		CH_3	CH_3	(I) logP = 1.97 [a)]
9		CH_3	CH_3	(I)
10		CH_3	CH_3	(Ia)
11		CH_3	CH_3	(Ia)
12		$CHCl_2$	H	(I) logP = 2.39 [a)]
13		C_2H_5	H	(I) logP = 2.39 [a)]

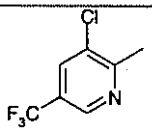
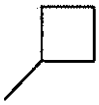
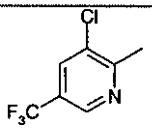
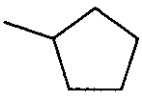
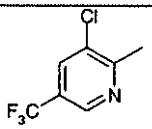
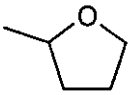
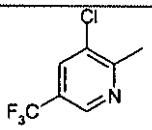
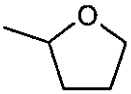
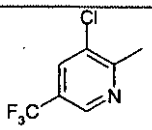
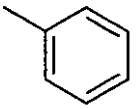
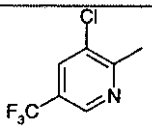
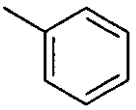
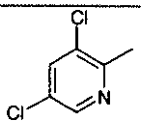
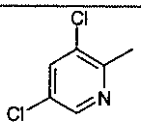
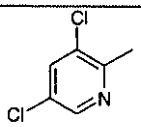
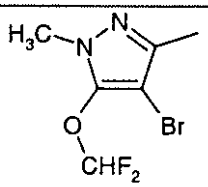
実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
14		C_2H_5	CH_3	(I)
15		C_2H_5	CH_3	(Ia)
16		C_2H_5	CH_3	(I) logP = 2.46 a)
17		C_3H_7-i	H	(I) logP = 2.36 a)
18		C_3H_7-i	CH_3	(I) logP = 2.89 a)
19		C_3H_7-i	CH_3	(I)
20		C_3H_7-i	CH_3	(Ia)
21		C_3H_7-i	C_2H_5	(I)
22		C_3H_7-i	C_2H_5	(Ia)
23		C_3H_7-n	H	(I) logP = 2.28 a)

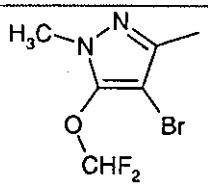
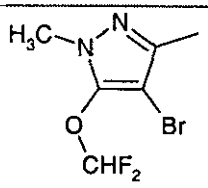
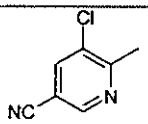
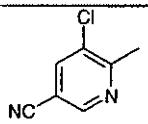
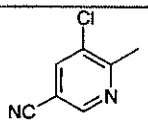
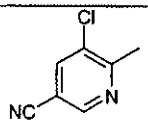
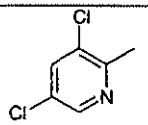
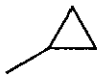
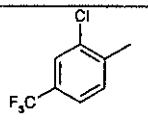
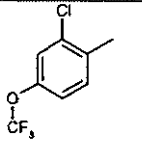
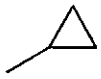
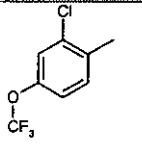
実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
24		C_3H_7-n	CH_3	(I) logP = 2.81 [a)]
25		C_4H_9-i	H	(I) logP = 2.52 [a)]
26		C_4H_9-t	H	(I) logP = 2.74 [a)]
27		C_4H_9-t	CH_3	(Ia) logP = 2.74 [a)]
28			CH_3	(I) logP = 2.62 [a)]
29			CH_3	(I) logP = 2.84 [a)]
30			CH_3	(Ia)
31			H	(I) logP = 2.55 [a)]
32			CH_3	(I) logP = 2.77 [a)]
33			CH_3	(Ia) logP = 4.84 [a)]

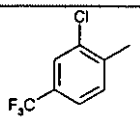
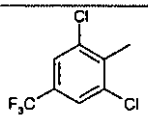
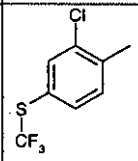
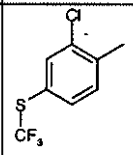
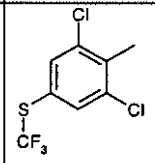
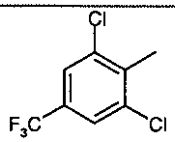
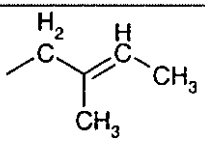
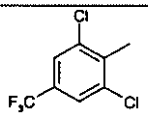
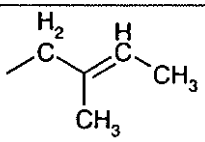
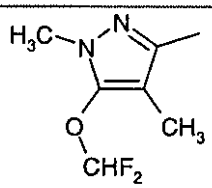
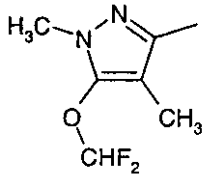
実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
34			H	(I)
35			CH_3	(I)
36			CH_3	(Ia)
37		CF_3	H	(I) logP = 2.42 [a)]
38		CF_3	CH_3	(I) logP = 3.11 [a)]
39		CF_3	CH_3	(Ia) logP = 3.99 [a)]
40		CF_3	C_2H_5	(I)
41		CF_3	C_2H_5	(Ia)
42		CF_3	$CH_2COOC_2H_5$	(Ia) logP = 4.05 [a)]
43		CF_2Cl	H	(I) logP = 2.53 [a)]

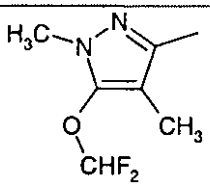
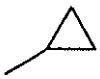
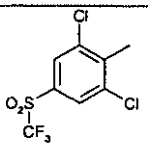
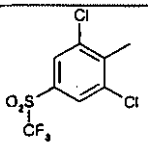
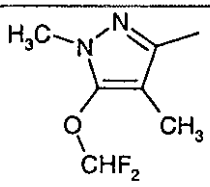
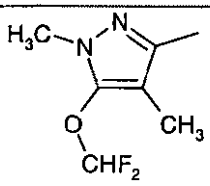
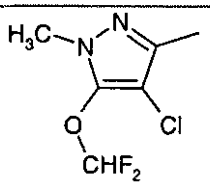
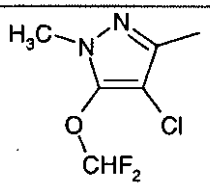
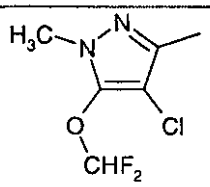
実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
44		C_2F_5	H	(I) logP = 2.84 [a)]
45		C_2F_5	CH_3	(Ia)
46		$COOC_2H_5$	CH_3	(I) logP = 2.74 [a)]
47			H	(I)
48			CH_3	(I)
49			CH_3	(Ia)
50			C_2H_5	(I) logP = 2.96 [a)]
51			C_2H_5	(Ia) logP = 4.42 [a)]
52			C_3H_7-i	(Ia) logP = 4.86 [a)]
53			H	(I)

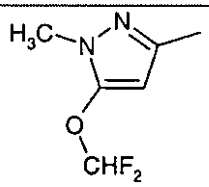
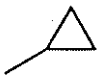
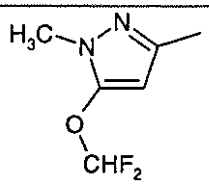
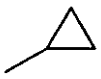
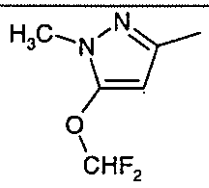
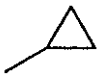
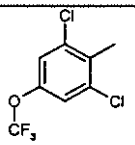
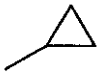
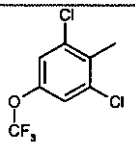
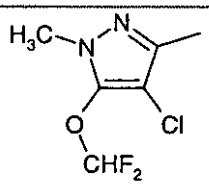
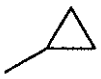
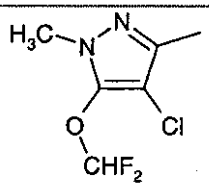
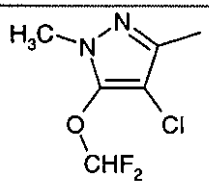
実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
54			CH_3	(I)
55			CH_3	(Ia)
56				(I) logP = 2.95 [a)]
57			CHF_2	(Ia) logP = 4.24 [a)]
58			$CH_2COOC_2H_5$	(Ia) logP = 3.88 [a)]
59			CH_3	(I) logP = 2.82 [a)]
60			CH_3	(Ia) logP = 3.73 [a)]
61			CH_3	(I)
62			CH_3	(Ia)
63			H	(I) logP = 2.46 [a)]

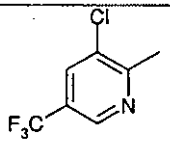
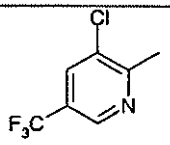
実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
64			CH_3	(I) logP = 3.03 [a)]
65			CH_3	(I) logP = 3.36 [a)]
66			H	(I) logP = 1.86 [a)]
67			CH_3	(I) logP = 2.13 [a)]
68			CH_3	(I) logP = 2.94 [a)]
69			CH_3	(Ia) logP = 4.78 [a)]
70		CH_3	CH_3	(I)
71		CH_3	CH_3	(Ia)
72		CF_3	CH_3	(Ia) logP = 3.76 [a)]
73			H	(I)

実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
74			CH_3	(I)
75			CH_3	(Ia)
76		C_3H_7-i	CH_3	(I)
77		C_3H_7-i	CH_3	(Ia)
78			CH_3	(I)
79			CH_3	(Ia)
80			CH_3	(I) logP = 2.30 [a)]
81		CH_3	CH_3	(I) logP = 2.30 [a)]
82			CH_3	(I)
83		C_3H_7-i	CH_3	(Ia)

実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
84		C_3H_7-i	CH_3	(I) logP = 3.52 [a)]
85		C_3H_7-i	CH_3	(I) logP = 3.78 [a)]
86			CH_3	(I)
87		C_3H_7-i	CH_3	(I)
88			CH_3	(I)
89			CH_3	(I)
90			CH_3	(Ia)
91		CH_3	CH_3	(I) logP = 1.53 [a)]
92			H	(I) logP = 1.71 [a)]

実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
93			CH_3	(I) logP = 2.04 [a)]
94		C_3H_7-i	CH_3	(I)
95		C_3H_7-i	CH_3	(Ia)
96		C_3H_7-i	CH_3	(I)
97		C_3H_7-i	CH_3	(Ia)
98		CH_3	H	(I) logP = 1.40 [a)] m.p. = 254°C
99		CH_3	CH_3	(I) logP = 1.68 [a)] m.p. = 199°C
100		CH_3	CH_3	(Ia)

実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
101			H	(I) logP = 1.59 [a)]
102			CH_3	(I) logP = 1.90 [a)]
103			CH_3	(Ia) logP = 3.02 [a)]
104			CH_3	(I)
105		C_3H_7-i	CH_3	(Ia)
106			H	(I) logP = 1.85 [a)] m.p. = 210°C
107			CH_3	(I) logP = 2.21 [a)] m.p. = 220°C
108			CH_3	(Ia)

実施例番号	Q	R^1	R^2	一般式 物性データ
109			CH_3	(I) logP = 2.61 a)
110			CH_3	(Ia) logP = 3.97 a)

表中に示したｌｏｇＰ値は、ＥＥＣ　Ｄｉｒｅｃｔｉｖｅ　７９／８３１　アネックスＶ．Ａ８に従って逆相カラム（Ｃ１８）を用いるＨＰＬＣ（高速液体クロマトグラフィー）により測定した。温度は４３℃とした。

【０１２４】

（ａ）酸性範囲での測定用移動相：０．１％　リン酸－アセトニトリル（アセトニトリル１０％からアセトニトリル９０％への直線勾配）。相当する測定結果は表１中にａ）を付した。

【０１２５】

（ｂ）中性範囲での測定用移動相：０．０１モル　リン酸緩衝水溶液－アセトニトリル（アセトニトリル１０％からアセトニトリル９０％への直線勾配）。相当する測定結果は表１中にｂ）を付した。

【０１２６】

校正は公知のｌｏｇＰ値（ｌｏｇＰ値は２つの連続アルカノン間を線形補間して保持時間により決定）を有するＣ$_{3-16}$直鎖アルカン－２－オンを用いて実施した。

【０１２７】

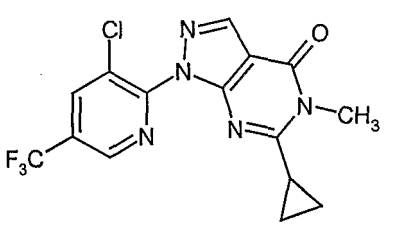
ラムダｍａｘ値は、２００～４００ｎｍのＵＶスペクトルを用いてクロマトグラフィー信号の極大で測定した。

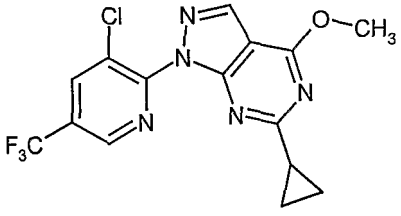
【０１２８】

実施例１０９～１１０として上記表１にリストした化合物は例えば次のようにして製造され得る。

【０１２９】

【化３５】





１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－６－シクロプロピル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］ピリミジン－４－オン（実施例５参照）（０．８０ｇ，２．２５ミリモル）、硫酸ジメチル（０．３１ｇ，２．４７ミリモル）、炭酸カリウム（０．３７ｇ，２．７ミリモル）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（４０ｍｌ）の混合物を室温（約２０℃）で１２時間撹拌した後、減圧下で濃縮する。残渣を水と一緒に撹拌し、濃塩酸で酸性化し、酢酸エチルで抽出し、抽出物を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過する。濾液を減圧下で濃縮する。精製のために、残渣として得た粗生成物（０．

９０ｇ）をシリカゲルカラムを用いるクロマトグラフィー（トルエン／酢酸エチル，１：１，ｖ／ｖ）にかける。こうして、０．２２ｇ（理論収量の２６％）の１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－４－メトキシ－６－シクロプロピルピラゾロピリミジン－４－オン（融点＝１４２℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝３．９７）及び０．５６ｇ（理論収量の６３％）の１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－５－メチル－６－シクロプロピル－１，５－ジヒドロピラゾロ［３，４－ｄ］ピリミジン－４－オンを得る（融点＝１２１℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝２．６１）を得る。

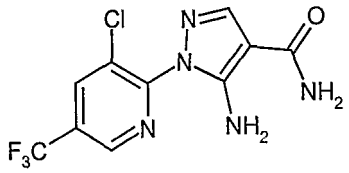
【０１３０】

式（ＩＩ）を有する出発物質

（実施例ＩＩ－１）

【０１３１】

【化３６】



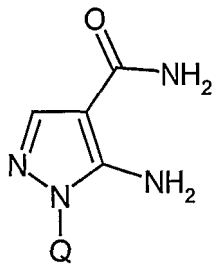
５－アミノ－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）ピラゾール－４－カルボニトリル（１５ｇ，５２ミリモル）を９８％硫酸（１５０ｍｌ）中６０℃で４時間撹拌する。溶液を２０℃に冷却した後、氷水（８００ｍｌ）と一緒に撹拌する。次に、溶液を酢酸エチルで３回、塩化メチレンで３回抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過する。濾液から溶媒を減圧下で注意深く留去させる。こうして、１４．８ｇ（理論収量の９４％）の５－アミノ－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）ピラゾール－４－カルボキサミド（融点＝１９６℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝１．４６）を得る。

【０１３２】

実施例ＩＩ－１と同様にして、例えば下表２にリストした式（ＩＩ）を有する化合物も製造することができる。

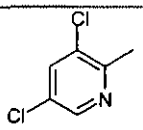
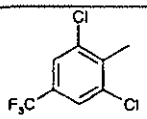
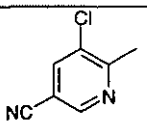
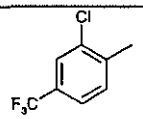
【０１３３】

【表２】



(II)

表２：式（ＩＩ）を有する化合物の例

実施例番号	Q	物性データ
II-2		logP = 1.02 a)
II-3		logP = 1.02 a)
II-4		
II-5		

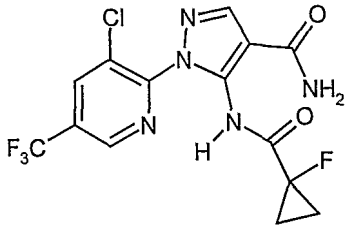
【０１３４】

式（ＶＩ）を有する出発物質

（実施例ＶＩ－１）

【０１３５】

【化３７】



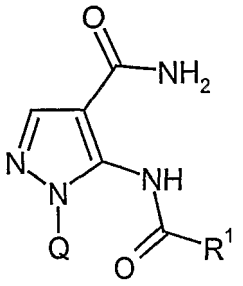
室温（約２０℃）において、アセトニトリル（５０ｍｌ）中の５－アミノ－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチル－ピリジン－２－イル）ピラゾール－４－カルボキサミド（４．８６ｇ，１５．９ミリモル）に水素化ナトリウム（パラフィン中８０％）（０．８０ｇ，３１．８ミリモル）を少しずつ添加し、混合物を１０分間撹拌し、１－フルオロシクロプロパンカルボニルクロリド（３．９ｇ，３１．８ミリモル）を添加し、混合物を室温で１２時間撹拌する。混合物を減圧下で濃縮し、水を残渣に添加した後、混合物を濃塩酸で酸性化する。生じた結晶性生成物を吸引濾過により単離する。こうして、３．１ｇ（理論収量の４６％）の５－（１－フルオロシクロプロピルカルボニルアミノ）－１－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）ピラゾール－４－カルボキサミド（融点＝２０４℃、ｌｏｇＰ（ｐＨ２）＝２．０２）を得る。

【０１３６】

実施例ＶＩ－１と同様にして、例えば下表３にリストした式（ＶＩ）を有する化合物も製造することができる。

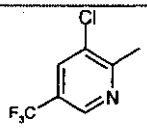
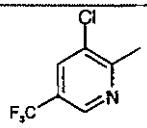
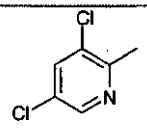
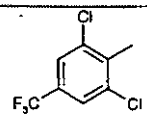
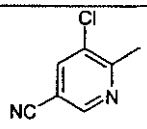
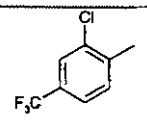
【０１３７】

【表３】



(VI)

表３：式（ＶＩ）を有する化合物の例

実施例	Q	R^1	物性データ
VI-2		C_4H_9-t	logP = 2.20 [a)]
VI-3		$C(CH_3)_2CH_2Cl$	logP = 2.26 [a)]
VI-4		C_4H_9-t	
VI-5		C_4H_9-t	
VI-6		C_4H_9-t	
VI-7		C_4H_9-t	

【０１３８】

使用例

（実施例Ａ）

発生前処理試験（除草作用）：

活性化合物の適当な調製物を作成するために、１重量部の活性化合物を溶媒としての５重量部のアセトンと混合し、乳化剤としての１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテルを添加し、濃厚物を所望濃度まで水で希釈する。

【０１３９】

試験植物の種子を通常の土壌に播種する。２４時間後、単位面積あたり特定量の所望活性化合物が施用されるように土壌に活性化合物の調製物を散布する。散布液中の活性化合物の濃度は、１ヘクタールあたり１０００Ｌの水で特定量の所望活性化合物が施用されるように選択する。

【０１４０】

３週間後、植物に対する被害度を未処理コントロールの発生と比較した被害％で評価す

る。０％は効果なし（未処理コントロールと同様）、１００％は完全撲滅を示す。

【０１４１】

この試験で、例えば製造例８、１６、１８、２４、２７、３２、３３、５７、５９、６０、６４、６６、６７、８０、９２及び１０９の化合物は雑草に対して強い作用を示し、これらの化合物の幾つかは作物（例えば、トウモロコシ、小麦及び甜菜）にとって十分耐性である。

【０１４２】

（実施例Ｂ）

発生後処理試験（除草作用）：

活性化合物の適当な調製物を作成するために、１重量部の活性化合物を溶媒としての５重量部のアセトンと混合し、乳化剤としての１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテルを添加し、濃厚物を所望濃度まで水で希釈する。

【０１４３】

高さ５～１５ｃｍの試験植物に対して単位面積あたり特定量の所望活性化合物が施用されるように活性化合物の調製物を散布する。散布液中の活性化合物の濃度は、１ヘクタールあたり１０００Ｌの水で特定量の所望活性化合物が施用されるように選択する。

【０１４４】

３週間後、植物に対する被害度を未処理コントロールの発生と比較した被害％で評価する。０％は効果なし（未処理コントロールと同様）、１００％は完全撲滅を示す。

【０１４５】

この試験で、例えば製造例６、１６、１８、２４、２７、３１、３２、３３、３９、５７、５９、６０、６４、６６、６７、６９、８０、８５、９２、１０９及び１１０の化合物は雑草に対して強い作用を示し、これらの化合物の幾つかは作物（例えば、小麦）にとって十分耐性である。

【０１４６】

（実施例Ｃ）

メロイドギネ試験（殺線虫作用）：

活性化合物の適当な調製物を作成するために、１重量部の活性化合物を溶媒としての７重量部のジメチルホルムアミド及び乳化剤としての２重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテルと混合し、濃厚物を所望濃度まで水で希釈する。

【０１４７】

容器に砂、活性化合物の溶液、サツマイモネコブセンチュウ（Ｍｅｌｏｉｄｏｇｙｎｅ ｉｎｃｏｇｎｉｔａ）の卵／幼虫懸濁液及びレタス種子を充填する。レタス種子を発芽させ、植物を成長させる。根にこぶが形成される。

【０１４８】

所望期間後、殺線虫作用をこぶの形成により％で測定する。１００％はこぶが見られなかった、０％は処理植物上のこぶの数が未処理コントロールのものに匹敵することを意味する。

【０１４９】

この試験で、例えば製造例１６及び８０の化合物が良好な活性を示す。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 03/04137

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04 C07D401/04 C07D231/38 C07D231/42 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D A01N

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)
EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, BEILSTEIN Data, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 542 388 A (SCHERING AG) 19 May 1993 (1993-05-19) claims 1,4	1,12
Y	GB 1 406 412 A (PFIZER) 17 September 1975 (1975-09-17) claims 1,7	1,12
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 007, no. 011 (C-145), 18 January 1983 (1983-01-18) & JP 57 167902 A (OTSUKA KAGAKU YAKUHIN KK), 16 October 1982 (1982-10-16) abstract	1,12
A	WO 94 13677 A (PFIZER ;CHEN YUHPYNG LIANG (US)) 23 June 1994 (1994-06-23) cited in the application * Seite 44; Preparation Q *	1

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
21 July 2003	09.12.03

Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Wörth, C.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
EP03/04137

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

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

See supplemental 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 an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.

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.:
1-8, 11-14

Remark on Protest

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
EP03/04137

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, as follows:

1. Claims: 1-8, 11-14

   bicyclic pyrazolo-pyrimidin-4-one of formula (I), its use as herbicide and bicyclic precursor stages of formula (Ib)

2. Claim: 9

   compounds of formula (II)

3. Claim: 10

   compounds of formula (VI)

Form PCT/ISA/210

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
PCT/EP 03/04137

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 0542388	A	19-05-1993	DE	4137872 A1	19-05-1993
			DE	4212919 A1	21-10-1993
			AP	391 A	03-08-1995
			AT	142625 T	15-09-1996
			AU	676802 B2	20-03-1997
			AU	2492395 A	21-09-1995
			AU	662771 B2	14-09-1995
			AU	2927992 A	15-06-1993
			BG	98740 A	31-05-1995
			BR	9206743 A	11-04-1995
			CA	2123606 A1	27-05-1993
			CN	1073440 A ,B	23-06-1993
			CZ	9401186 A3	12-07-1995
			DE	69213769 D1	17-10-1996
			DE	69213769 T2	10-04-1997
			DK	643700 T3	24-02-1997
			WO	9310100 A1	27-05-1993
			EP	0542388 A1	19-05-1993
			EP	0643700 A1	22-03-1995
			ES	2094380 T3	16-01-1997
			GR	3021762 T3	28-02-1997
			HU	66844 A2	30-01-1995
			IL	103678 A	12-09-1996
			IL	116507 A	14-08-1997
			JP	7505125 T	08-06-1995
			JP	3333201 B2	15-10-2002
			PH	30135 A	21-01-1997
			RO	113984 B1	30-12-1998
			RU	2094433 C1	27-10-1997
			SK	55594 A3	08-02-1995
			TR	26513 A	15-03-1995
			US	5405829 A	11-04-1995
			US	5556986 A	17-09-1996
			US	5668278 A	16-09-1997
			ZA	9208788 A	08-06-1993
			MX	9300890 A1	31-08-1994
GB 1406412	A	17-09-1975	NONE		
JP 57167902	A	16-10-1982	NONE		
WO 9413677	A	23-06-1994	AT	195738 T	15-09-2000
			AU	680226 B2	24-07-1997
			AU	5728194 A	04-07-1994
			BR	9307648 A	25-05-1999
			CA	2150709 A1	23-06-1994
			CN	1094048 A ,B	26-10-1994
			CZ	9501586 A3	15-11-1995
			DE	69329296 D1	28-09-2000
			DE	69329296 T2	28-12-2000
			DK	674642 T3	18-09-2000
			EG	20273 A	31-05-1998
			EP	0674642 A1	04-10-1995
			ES	2150482 T3	01-12-2000
			FI	935675 A	18-06-1994
			GR	3034507 T3	29-12-2000
			HU	70426 A2	30-10-1995
			IL	107944 A	06-12-2000

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
PCT/EP 03/04137

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9413677 A		JP 2862375 B2	03-03-1999
		JP 7509728 T	26-10-1995
		KR 167395 B1	15-01-1999
		KR 225720 B1	15-10-1999
		NO 952399 A	16-08-1995
		NZ 259114 A	24-03-1997
		PL 309359 A1	02-10-1995
		PT 674642 T	31-01-2001
		RU 2124016 C1	27-12-1998
		TW 444018 B	01-07-2001
		WO 9413677 A1	23-06-1994
		US 6218397 B1	17-04-2001
		ZA 9309405 A	15-06-1995

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 1992)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 03/04137

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04 C07D401/04 C07D231/38 C07D231/42 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)
EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, BEILSTEIN Data, PAJ

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 542 388 A (SCHERING AG) 19. Mai 1993 (1993-05-19) Ansprüche 1,4	1,12
Y	GB 1 406 412 A (PFIZER) 17. September 1975 (1975-09-17) Ansprüche 1,7	1,12
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN Bd. 007, Nr. 011 (C-145), 18. Januar 1983 (1983-01-18) & JP 57 167902 A (OTSUKA KAGAKU YAKUHIN KK), 16. Oktober 1982 (1982-10-16) Zusammenfassung	1,12
A	WO 94 13677 A (PFIZER ;CHEN YUHPYNG LIANG (US)) 23. Juni 1994 (1994-06-23) in der Anmeldung erwähnt * Seite 44; Preparation Q *	1

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

° Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
21. Juli 2003	09. 12. 03

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31–70) 340–3016	Wörth, C.

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 03/04137

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich

2. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich

3. ☐ Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. ☒ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.

3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.

4. ☒ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:
1-8, 11-14

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs
☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/04137

WEITERE ANGABEN PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-8, 11-14

Bizyklische Pyrazolo-pyrimidin-4-one der Formel (I), deren Verwendung als Herbicide sowie bizyklische Vorsufen der Formel (Ib).

---

2. Anspruch: 9

Verbindungen der Formel (II)

---

3. Anspruch: 10

Verbindungen der Formel (VI)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 03/04137

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0542388 A	19-05-1993	DE 4137872 A1	19-05-1993
		DE 4212919 A1	21-10-1993
		AP 391 A	03-08-1995
		AT 142625 T	15-09-1996
		AU 676802 B2	20-03-1997
		AU 2492395 A	21-09-1995
		AU 662771 B2	14-09-1995
		AU 2927992 A	15-06-1993
		BG 98740 A	31-05-1995
		BR 9206743 A	11-04-1995
		CA 2123606 A1	27-05-1993
		CN 1073440 A ,B	23-06-1993
		CZ 9401186 A3	12-07-1995
		DE 69213769 D1	17-10-1996
		DE 69213769 T2	10-04-1997
		DK 643700 T3	24-02-1997
		WO 9310100 A1	27-05-1993
		EP 0542388 A1	19-05-1993
		EP 0643700 A1	22-03-1995
		ES 2094380 T3	16-01-1997
		GR 3021762 T3	28-02-1997
		HU 66844 A2	30-01-1995
		IL 103678 A	12-09-1996
		IL 116507 A	14-08-1997
		JP 7505125 T	08-06-1995
		JP 3333201 B2	15-10-2002
		PH 30135 A	21-01-1997
		RO 113984 B1	30-12-1998
		RU 2094433 C1	27-10-1997
		SK 55594 A3	08-02-1995
		TR 26513 A	15-03-1995
		US 5405829 A	11-04-1995
		US 5556986 A	17-09-1996
		US 5668278 A	16-09-1997
		ZA 9208788 A	08-06-1993
		MX 9300890 A1	31-08-1994
GB 1406412 A	17-09-1975	KEINE	
JP 57167902 A	16-10-1982	KEINE	
WO 9413677 A	23-06-1994	AT 195738 T	15-09-2000
		AU 680226 B2	24-07-1997
		AU 5728194 A	04-07-1994
		BR 9307648 A	25-05-1999
		CA 2150709 A1	23-06-1994
		CN 1094048 A ,B	26-10-1994
		CZ 9501586 A3	15-11-1995
		DE 69329296 D1	28-09-2000
		DE 69329296 T2	28-12-2000
		DK 674642 T3	18-09-2000
		EG 20273 A	31-05-1998
		EP 0674642 A1	04-10-1995
		ES 2150482 T3	01-12-2000
		FI 935675 A	18-06-1994
		GR 3034507 T3	29-12-2000
		HU 70426 A2	30-10-1995
		IL 107944 A	06-12-2000

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 03/04137

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9413677 A		JP 2862375 B2	03-03-1999
		JP 7509728 T	26-10-1995
		KR 167395 B1	15-01-1999
		KR 225720 B1	15-10-1999
		NO 952399 A	16-08-1995
		NZ 259114 A	24-03-1997
		PL 309359 A1	02-10-1995
		PT 674642 T	31-01-2001
		RU 2124016 C1	27-12-1998
		TW 444018 B	01-07-2001
		WO 9413677 A1	23-06-1994
		US 6218397 B1	17-04-2001
		ZA 9309405 A	15-06-1995

フロントページの続き

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HU,IE,IT,LU,MC,NL,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NI,NO,NZ,OM,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

(72)発明者 リンカー，カールーハインツ
ドイツ国、５１３７７・レバークーゼン、クルトーシユーマツハーーリング・５６
(72)発明者 アンドレー，ローラント
ドイツ国、４０７６４・ランゲンフエルト、デシヤントーミーバハーベーク・３７
(72)発明者 ホイシエン，ドロテー
ドイツ国、４０４７４・デユツセルドルフ、ホルテンジーンシユトラーセ・３１
(72)発明者 シエバルツ，ハンスーゲオルク
ドイツ国、４０７６４・ランゲンフエルト、ハイネンブツシユ・１９・エー
(72)発明者 ドレベス，マルク・ビルヘルム
ドイツ国、４０７６４・ランゲンフエルト、ゲーテシユトラーセ・３８
(72)発明者 ダーメン，ペーター
ドイツ国、４１４７０・ノイス、アルテブリユツカー・シユトラーセ・６１
(72)発明者 フオイヒト，デイーター
ドイツ国、６５７６０・エシユボーン、ブルクグラーベン・７・アー
(72)発明者 ポンツエン，ロルフ
ドイツ国、４２７９９・ライヒリンゲン、アム・クロスター・６９
(72)発明者 レーゼル，ペーター
ドイツ国、５１３７１・レバークーゼンーヒトドルフ、ロールシユトラーセ・９０・アー

Ｆターム(参考) 4C050 AA01 BB05 CC08 DD10 EE04 FF02 GG02 GG03 HH04