

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 19 年 8 月 2 日 (2007.8.2)

【公表番号】特表 2007-506665 (P2007-506665A)

【公表日】平成 19 年 3 月 22 日 (2007.3.22)

【年通号数】公開・登録公報 2007-011

【出願番号】特願 2006-515995 (P2006-515995)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 0 1 N 43/54 (2006.01)

A 0 1 N 25/30 (2006.01)

A 0 1 N 25/02 (2006.01)

A 0 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 2

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 31/10

A 0 1 N 43/54 Z

A 0 1 N 25/30

A 0 1 N 25/02

A 0 1 P 1/00

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 6 月 15 日 (2007.6.15)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

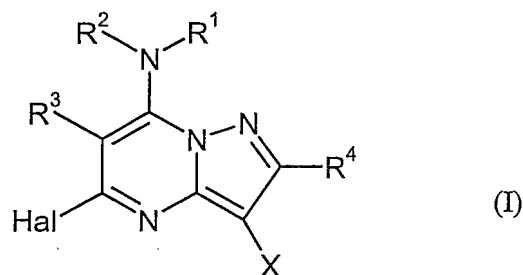
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式

【化 1】



(式中、 R^1 は場合により置換されていてもよいアルキル、場合により置換されていてもよいアルケニル、場合により置換されていてもよいアルキニル、場合により置換されてい

てもよいシクロアルキル、又は場合により置換されていてもよい複素環を表し、

R^2 は水素又はアルキルを表し、又は

R^1 と R^2 はこれらを結合している窒素原子と一緒にあって、場合により置換されていてもよい複素環を表し、

R^3 は場合により置換されていてもよい複素環を表し、

R^4 は水素又はアルキルを表し、

H a l はハロゲンを表し、及び

X はハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、場合により置換されていてもよいアルケニル、場合により置換されていてもよいアルキニル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、ホルミル、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、ヒドロキシイミノアルキル、アルコキシイミノアルキル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルキルアミノカルボニルを表す。)

で示されるピラゾロピリミジン。

【請求項 2】

R^1 が、1 から 6 個の炭素原子を有するアルキル (このアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1 から 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、及び / 又は 3 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキルで、同じか異なる 1 から 5 置換されていてもよい。) を表すか、又は

R^1 が、2 から 6 個の炭素原子を有するアルケニル (このアルケニルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1 から 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、及び / 又は 3 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキルで、同じか異なる 1 から 3 置換されていてもよい。) を表すか、又は

R^1 が、2 から 6 個の炭素原子を有するアルキニル (このアルキニルは、ハロゲン、シアノ、1 から 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、及び / 又は 3 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキルで、同じ異なる 1 から 3 置換されていてもよい。) を表すか、又は

R^1 が、3 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキル (このシクロアルキルは、ハロゲン、及び / 又は 1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルで、同じか異なる 1 から 3 置換されていてもよい。) を表すか、又は、

R^1 が、5 個又は 6 個の環構成要素と 1 から 3 個の異種原子 (例えば窒素、酸素及び / 又は硫黄原子) とを有する飽和又は不飽和複素環を表し (前記複素環は、ハロゲン、1 から 4 個の炭素原子を有するアルキル、シアノ、ニトロ、及び / 又は 3 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキルで 1 置換又は 2 置換されていてもよい。)、

R^2 が、水素を表すか又は 1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルを表すか、又は、

R^1 と R^2 が、これらを結合している窒素原子と一緒にあって、3 から 6 個の環構成要素を有する飽和又は不飽和複素環を表し (前記複素環式化合物は、環構成要素としてさらに窒素、酸素又は硫黄原子を含有していてもよく、及び前記複素環式化合物は弗素、塩素、臭素、ニトロ、1 から 4 個の炭素原子を有するアルキル、及び / 又は 1 から 4 個の炭素原子と 1 から 9 個の弗素及び / 又は塩素原子とを有するハロゲン化アルキルで最大 3 置換されていてもよい。)、

R^3 が、5 個又は 6 個の環構成要素と 1 から 4 個の異種原子 (例えば酸素、窒素及び / 又は硫黄原子) とを有する飽和又は不飽和複素環を表し (前記複素環は、弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、それぞれのアルキル部分に 1 から 3 個の炭素原子をそれぞれ有するヒドロキシイミノアルキル又はアルコキシイミノアルキル、それぞれ 1 から 3 個の炭素原子と 1 から 7 個のハロゲン原子を有するハロゲン化アルキル又はハロゲン化アルコキシで、同じか異なる 1 から 4 置換されていてもよい。)、

R^4 が、水素を表すか又は 1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルを表し、

H a l が、弗素、塩素又は臭素を表し、及び

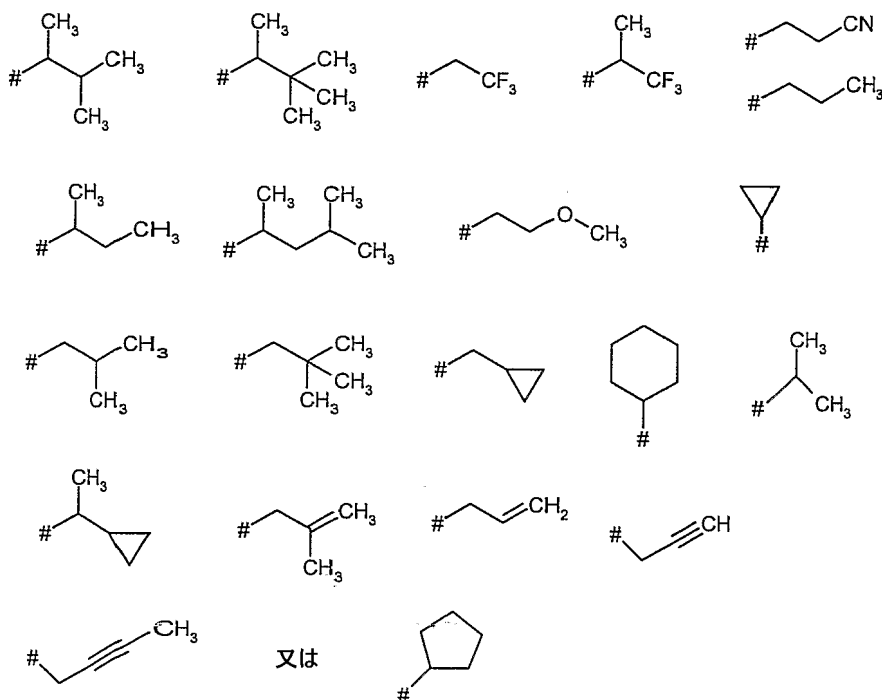
X が、シアノ、弗素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、ホルミル、1 から 6 個の炭素原子と 1 から 9 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子とを有するハロゲン化アルキル、1 から 4

個の炭素原子を有するアルキル、2 から 6 個の炭素原子を有するアルケニル、カルボキシ
ル、メトキシカルボニル又はエトキシカルボニルで置換され、アルケニル部分に 2 から 5
個の炭素原子を有するアルケニル、2 から 6 個の炭素原子を有するアルキニル、カルボキ
シル、メトキシカルボニル又はエトキシカルボニルで置換され、アルキニル部分に 2 から
5 個の炭素原子を有するアルキニル、1 から 4 個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル
、アルコキシ部分に 1 から 4 個の炭素原子を有し及びアルキル部分に 1 から 4 個の炭素原
子を有するアルコキシアルキル、3 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキル、チオカ
ルバモイル、アルコキシ部分に 1 から 4 個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、アル
キル部分に 1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルカルボニル、アルキル部分に 1 から
4 個の炭素原子を有するヒドロキシイミノアルキル、アルコキシ部分に 1 から 4 個の炭素
原子を有し及びアルキル部分に 1 から 4 個の炭素原子を有するアルコキシイミノアルキル
、1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルチオ、1 から 4 個の炭素原子を有するアルキル
スルフィニル、1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、又はアルキル部分に
1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルアミノカルボニルを表す、請求項 1 に記載の式 (I)
で示されるピラゾロピリミジン。

【請求項 3】

 R^1 が次式

【化 2】



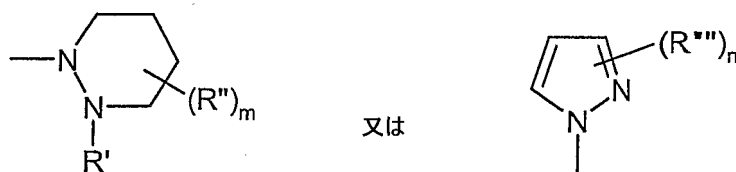
(# は結合位置を示す。) で示される基を表し、

R² が、水素、メチル、エチル又はプロピルを表し、又は

R¹ と R² が、これらを結合している窒素原子と一緒に、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、3, 6 - ジヒドロ - 1 (2 H) - ピペリジニル又はテトラヒドロ - 1 (2 H) - ピリダジニルを表し (但し、これらの基は、1 から 3 個の弗素原子、1 から 3 個のメチル基及び / 又はトリフルオロメチルで置換されていてもよい。)、又は

R^1 と R^2 が、これらを結合している窒素原子と一緒にあって、次式

【化 3】



〔式中、 R' は、水素又はメチルを表し、

R'' は、メチル、エチル、弗素、塩素又はトリフルオロメチルを表し、

m は整数 0、1、2 又は 3 を表し（但し、 m が 2 又は 3 を表す場合には、 R'' は同一又は異なる基を表す。）、

R''' はメチル、エチル、弗素、塩素又はトリフルオロメチルを表し、及び

n は整数 0、1、2 又は 3 を表す（但し、 n が 2 又は 3 を表す場合には、 R''' は同一又は異なる基を表す。）。〕

で示される基を表し、

R^3 が、ピリジル（このピリジルは、2 位又は 4 位で結合していて、及び弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び／又はトリフルオロメチルで、同じか異なる 1 から 4 置換されていてよい。）を表すか、又は

R^3 が、ピリミジル（このピリミジルは、2 位又は 4 位で結合していて、及び弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び／又はトリフルオロメチルで、同じか異なる 1 から 3 置換されていてよい。）を表すか、又は

R^3 が、チエニル（このチエニルは、2 位又は 3 位で結合していて、及び弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び／又はトリフルオロメチルで、同じか異なる 1 から 3 置換されていてよい。）を表すか、又は

R^3 が、チアゾリル（このチアゾリルは、2 位、4 位又は 5 位で結合していて、及び弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び／又はトリフルオロメチルで、同じか異なる 1 又は 2 置換されていてよい。）を表し、

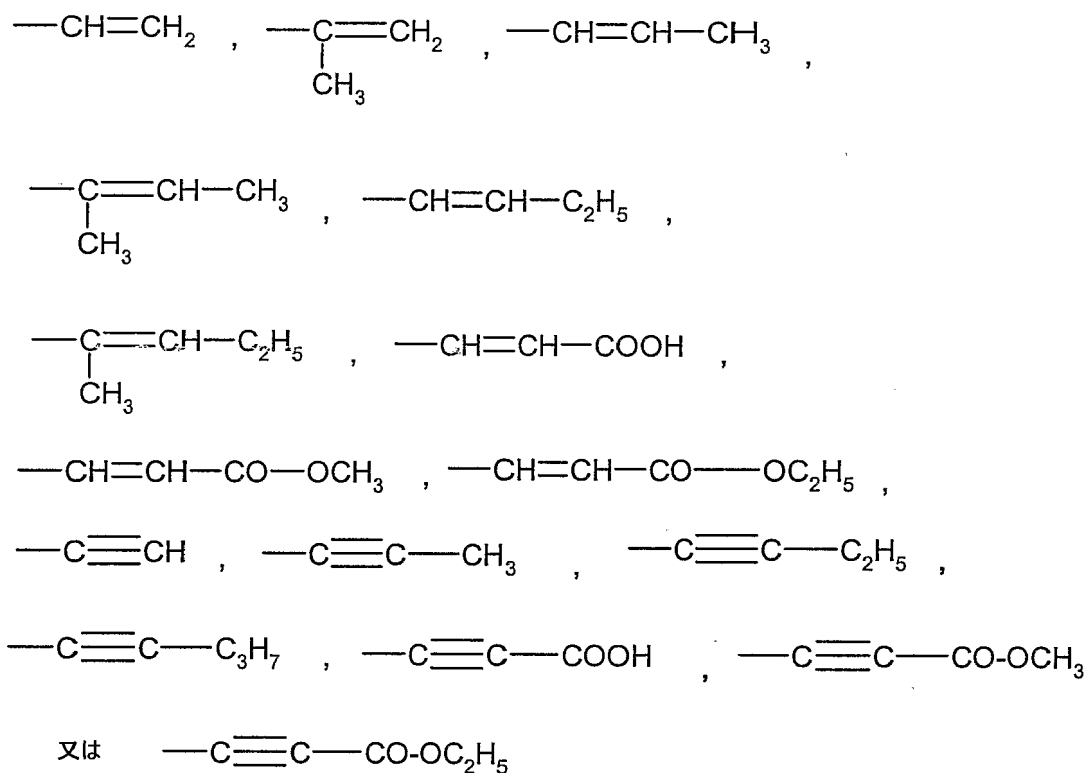
R^4 が、水素、メチル、エチル、プロピル又はイソプロピルを表し、

Hal が、弗素又は塩素を表し、及び

X が、シアノ、弗素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、ホルミル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メチル、エチル、シクロプロピル、チオカルバモイル、メトキシカルボニル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、ヒドロキシイミノメチル、メトキシイミノメチル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、メチルアミノカルボニル、エテニル、プロペニル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエタン - 1 - イル、メトキシメチル、エトキシメチル又は 1 - メトキシ - エチルを表すか、又は

X が、次式

【化 4】



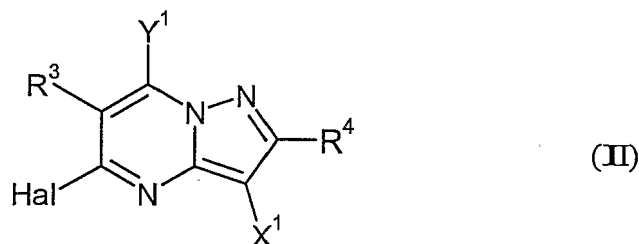
で示される基を表す、請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) で示されるピラゾロピリミジン。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の式 (I) で示されるピラゾロピリミジンの製造方法であって、

a) 次式

【化 5】



(式中、

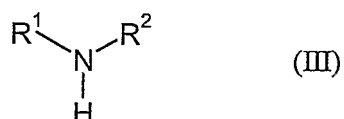
R^3 、 R^4 、及び Hal は前記の意味を有し、

X^1 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、ホルミル、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルキルアミノカルボニルを表し、及び

Y^1 はハロゲンを表す。)

で示されるハロゲン化ピラゾロピリミジンを、次式

【化 6】



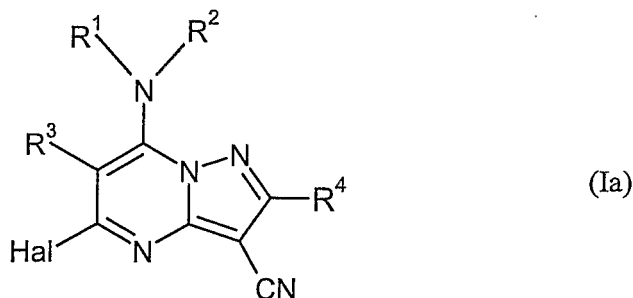
(式中、 R^1 及び R^2 は前記の意味を有する。)

で示されるアミンと、場合により希釈剤の存在下で、場合により触媒の存在下で及び場合により酸受容体の存在下で反応させるか、

又は、

b) 次式

【化 7】



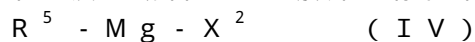
(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び Hal は前記の意味を有する。)

で示されるピラゾロピリミジン、

) 塩化アンモニウム水溶液の存在下で及び有機希釈剤の存在下で、水素化ジイソブチルアルミニウムと反応させるか、

又は

) 希釈剤の存在下で及び場合により触媒の存在下で、次式



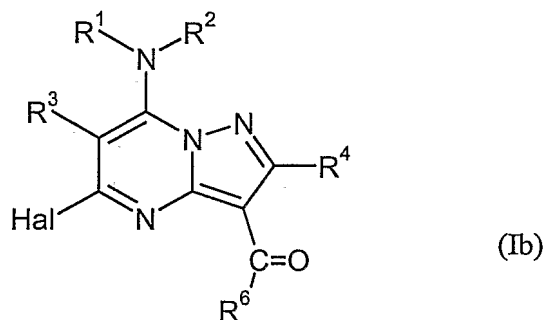
(式中、 R^5 はアルキルを表し、 X^2 は塩素又は臭素を表す。)

で示されるグリニャール化合物と反応させるか、

又は、

c) 次式

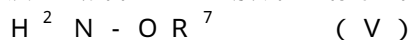
【化 8】



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び Hal は前記の意味を有し及び R^6 は水素又はアルキルを表す。)

で示されるピラゾロピリミジン、

) 希釈剤の存在下で及び場合により触媒の存在下で、次式



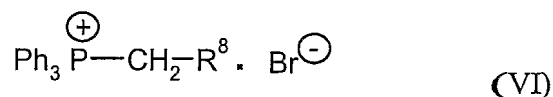
(式中、 R^7 は水素又はアルキルを表す。)

で示される化合物と反応させるか(式(V)で示されるアミノ化合物はこの酸付加塩の形態で使用することもできる。)、

又は、

) 塩基の存在下で及び希釈剤の存在下で、次式

【化 9】

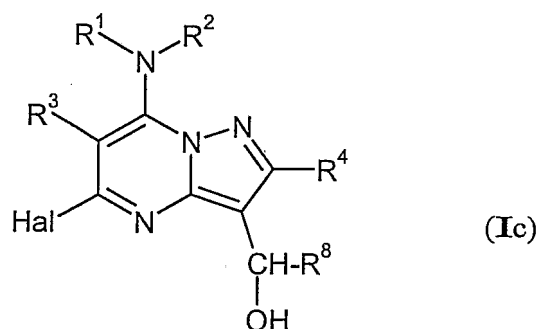


(式中、Phはフェニルを表し及び R^8 は水素又は場合により置換されていてもよいアルキルを表す。)

で示されるトリフェニルホスホニウム塩と反応させるか、
又は、

) 塩化アンモニウム水溶液の存在下で及び有機希釈剤の存在下で、水素化ジイソブチルアルミニウムと反応させるか、

又は希釈剤の存在下で水素化ホウ素ナトリウムと反応させ、場合によって、得られた次式
【化 10】



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 及びHalは前記の意味を有する。)

で示されるピラゾロピリミジン、場合によって塩基の存在下で及び希釈剤の存在下で、
次式



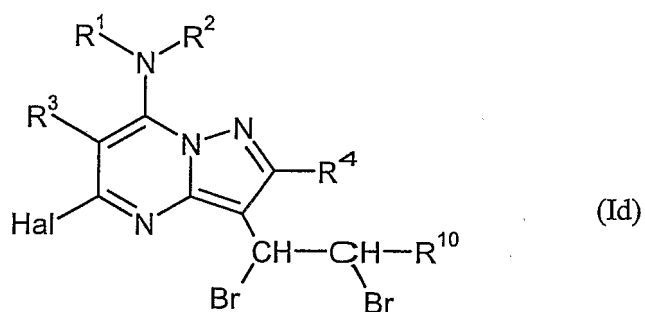
(式中、 R^9 はアルキルを表し、 X^3 は塩素、臭素、ヨウ素又は基 $\text{R}^9\text{O}-\text{SO}_2-\text{O}-$ を表す。)

で示されるアルキル化剤と反応させるか、

又は、

d) 次式

【化 11】



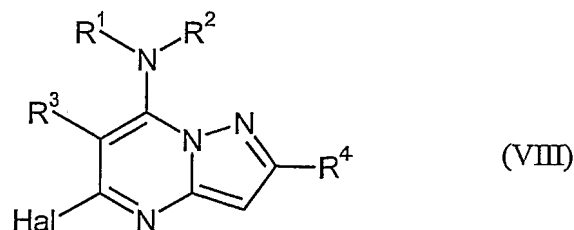
(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及びHalは前記の意味を有し、 R^{10} は水素又は場合により置換されていてもよいアルキルを表す。)

で示されるピラゾロピリミジン、希釈剤の存在下で、強塩基と反応させるか、

又は、

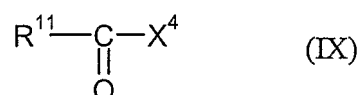
e) 次式

【化 1 2】



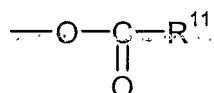
(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び Hal は前記の意味を有する。)
 で示されるピラゾロピリミジンを、触媒の存在下で及び希釈剤の存在下で、次式

【化 1 3】



(式中、 R^{11} はアルキルを表し及び X^4 は塩素又は式

【化 1 4】



で示される基を表す。)

で示されるアシル誘導体と反応させる

ことを特徴とする、請求項 1 に記載の式 (I) で示されるピラゾロピリミジンの製造方法。

【請求項 5】

望ましくない微生物を防除するための、請求項 1 から 3 の一つ以上に記載の式 (I) で示されるピラゾロピリミジンの使用。

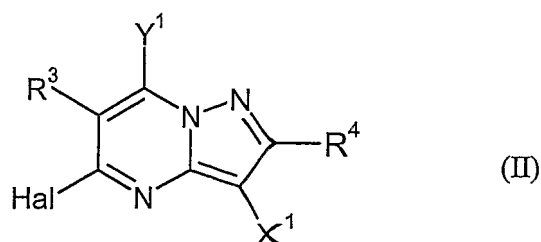
【請求項 6】

請求項 1 から 3 の一つ以上に記載の式 (I) で示されるピラゾロピリミジンを、望ましくない微生物及び / 又はこの生息環境に施用することを特徴とする、望ましくない微生物の防除方法。

【請求項 7】

次式

【化 1 5】



(式中、 R^3 は場合により置換されていてもよい複素環を表し、

R^4 は水素又はアルキルを表し、

Hal はハロゲンを表し、

X^1 はハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、

ホルミル、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルキルアミノカルボニルを表し、及び

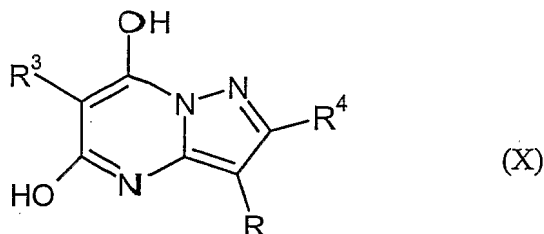
Y¹ はハロゲンを表す)

で示されるハロゲン化ピラゾロピリミジン。

【請求項 8】

f) 次式

【化 1 6】



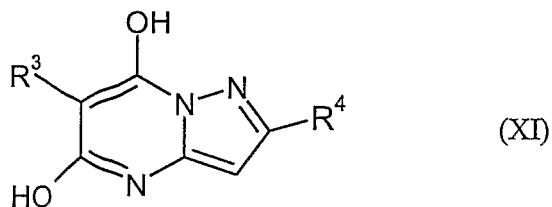
(式中、R³ 及び R⁴ は請求項 7 に記載の意味を有し、及び R はハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルキルアミノカルボニルを表す。)

で示されるヒドロキシピラゾロピリミジンを、場合により希釈剤の存在下で、ハロゲン化剤と反応させるか、

又は、

g) 次式

【化 1 7】



(式中、R³ 及び R⁴ は請求項 7 に記載の意味を有する。)

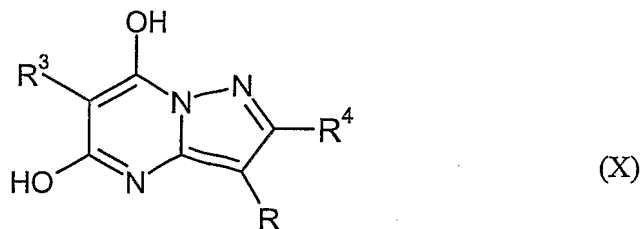
で示されるヒドロキシピラゾロピリミジンを、ジメチルホルムアミドの存在下でオキシ塩化リンと反応させ、場合によって五塩化リンを加えながらさらに反応させる

ことを特徴とする、請求項 7 に記載の式 (II) で示されるハロゲン化ピラゾロピリミジンの製造方法。

【請求項 9】

次式

【化 1 8】



(式中、R³ は場合により置換されていてもよい複素環を表し、

R⁴ は水素又はアルキルを表し、及び

R はハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、チ

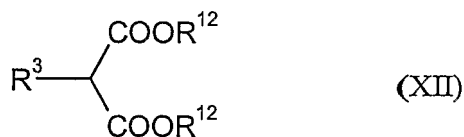
オカルバモイル、アルコキシカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルキルアミノカルボニルを表す。)

で示されるヒドロキシピラゾロピリミジン。

【請求項 10】

(h) 次式

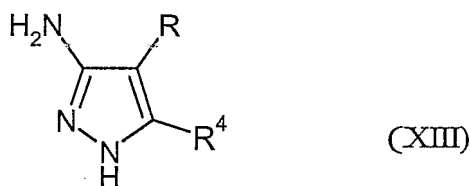
【化 19】



(式中、 R^3 は請求項 9 に記載の意味を有し及び R^{12} は 1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルを表す。)

で示される複素環式マロン酸エステルを、次式

【化 20】



(式中、 R^4 及び R は請求項 9 に記載の意味を有する。)

で示されるアミノピラゾールと、場合により希釈剤の存在下で及び場合により酸結合剤の存在下で反応させることを特徴とする、請求項 9 に記載の式 (X) で示されるヒドロキシピラゾロピリミジンの製造方法。