

【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】

<b>C 07 D 487/04</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 61 K 31/519</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 61 P 31/10</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 01 N 43/54</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 01 N 25/30</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 01 N 25/02</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 01 P 1/00</b>	<b>(2006.01)</b>
<b>A 61 P 35/00</b>	<b>(2006.01)</b>

【F I】

C 07 D 487/04	1 4 2
C 07 D 487/04	C S P
A 61 K 31/519	
A 61 P 31/10	
A 01 N 43/54	Z
A 01 N 25/30	
A 01 N 25/02	
A 01 P 1/00	
A 61 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

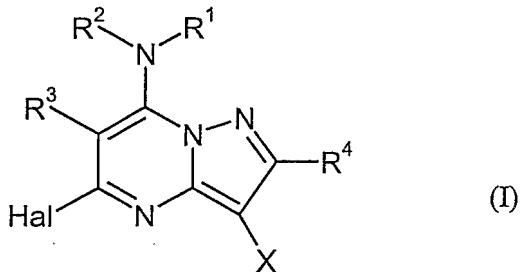
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次式

【化1】



(式中、R<sup>1</sup>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アルキニル)

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<sup>2</sup> は水素又はアルキルを表し、又は

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

R<sup>3</sup> は場合により置換されていてもよい複素環を表し、

R<sup>4</sup> は水素又はアルキルを表し、

H a 1 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<sup>1</sup> 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<sup>1</sup> 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<sup>1</sup> 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<sup>1</sup> 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<sup>1</sup> 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<sup>2</sup> 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<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> が、これらを結合している窒素原子と一緒にになって、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<sup>3</sup> 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<sup>4</sup> 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 1 が、弗素、塩素又は臭素を表し、及び

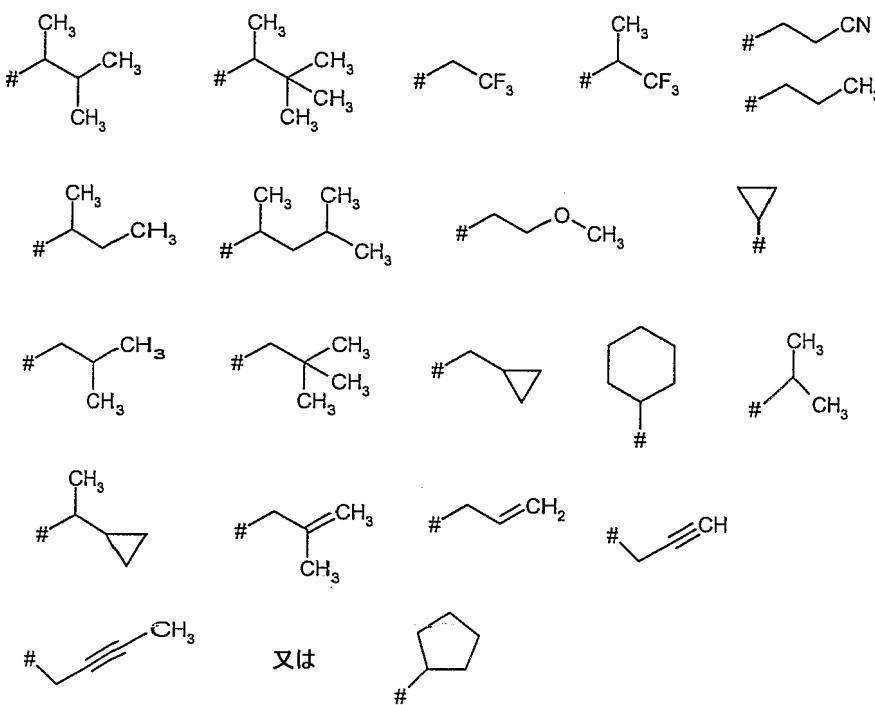
X が、シアノ、弗素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、ホルミル、1から6個の炭素原子と1から9個の弗素、塩素及び／又は臭素原子とを有するハロゲン化アルキル、1から4

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、カルボキシリ、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、カルボキシリ、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<sup>1</sup>が次式

## 【化2】



(#は結合位置を示す。)で示される基を表し、

R<sup>2</sup>が、水素、メチル、エチル又はプロピルを表し、又は

R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>が、これらを結合している窒素原子と一緒にになって、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(2H)-ピペリジニル又はテトラヒドロ-1(2H)-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<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>が、これらを結合している窒素原子と一緒にになって、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<sup>3</sup>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置換されていてもよい。)を表すか、又は

R<sup>3</sup>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置換されていてもよい。)を表すか、又は

R<sup>3</sup>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置換されていてもよい。)を表すか、又は

R<sup>3</sup>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置換されていてもよい。)を表し、

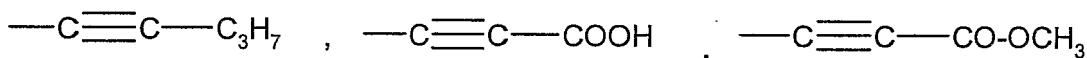
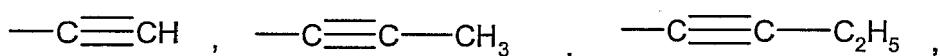
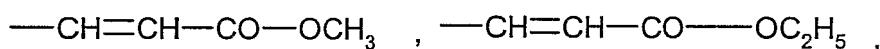
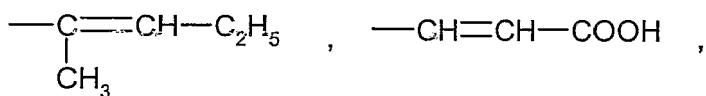
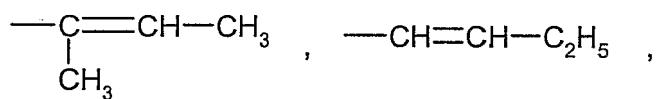
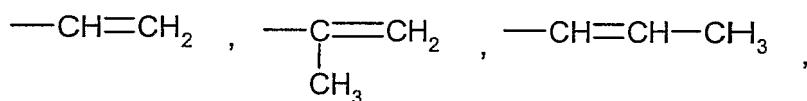
R<sup>4</sup>が、水素、メチル、エチル、プロピル又はイソプロピルを表し、

H<sub>a</sub>1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、シクロプロビル、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】



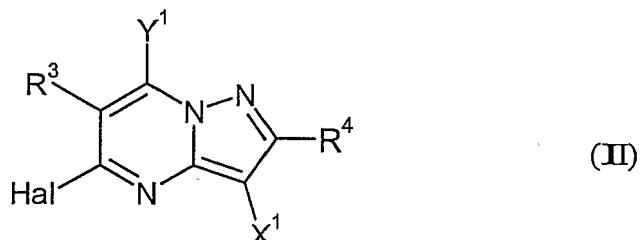
で示される基を表す、請求項1又は2に記載の式(I)で示されるピラゾロピリミジン。

## 【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、

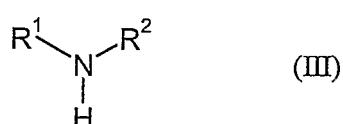
$R^3$ 、 $R^4$ 、及びHalは前記の意味を有し、

$X^1$ 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】



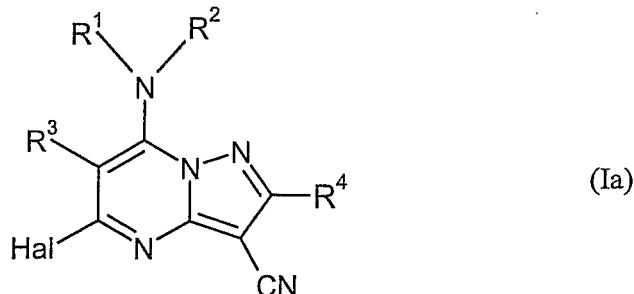
(式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は前記の意味を有する。)

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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>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、

) 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



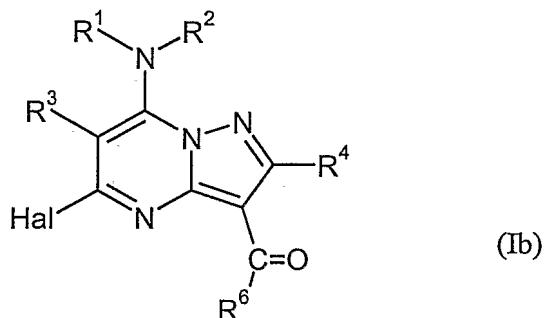
(式中、R<sup>5</sup>はアルキルを表し、X<sup>2</sup>は塩素又は臭素を表す。)

で示されるグリニヤール化合物と反応させるか、

又は、

c) 次式

【化8】



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びHalは前記の意味を有し及びR<sup>6</sup>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を、

) 希釈剤の存在下で及び場合により触媒の存在下で、次式



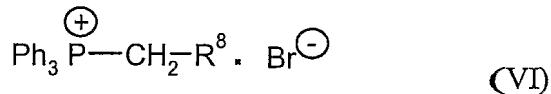
(式中、R<sup>7</sup>は水素又はアルキルを表す。)

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】



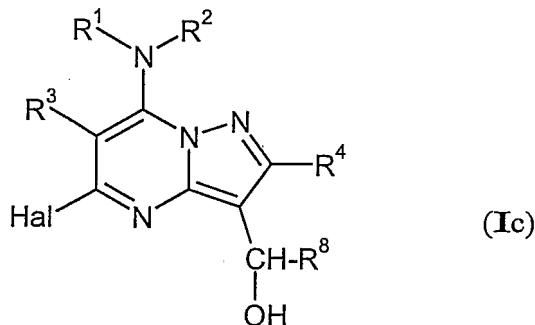
(式中、Phはフェニルを表し及びR<sup>8</sup>は水素又は場合により置換されていてもよいアルキルを表す。)

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、

d) 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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>8</sup>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、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



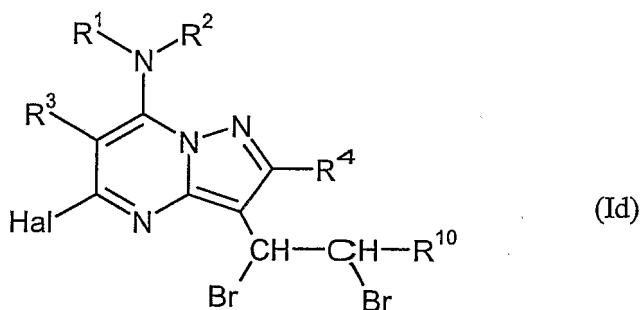
(式中、R<sup>9</sup>はアルキルを表し、X<sup>3</sup>は塩素、臭素、ヨウ素又は基R<sup>9</sup>O-SO<sub>2</sub>-O-を表す。)

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】



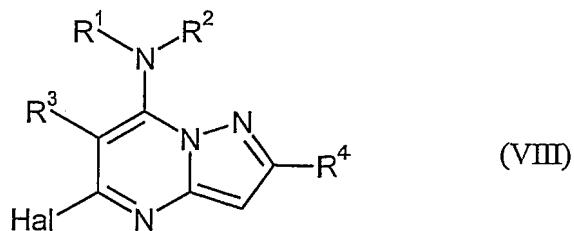
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びHalは前記の意味を有し、R<sup>10</sup>は水素又は場合により置換されていてもよいアルキルを表す。)

で示されるピラゾロピリミジンを、希釈剤の存在下で、強塩基と反応させるか、

又は、

e) 次式

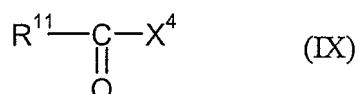
【化12】



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

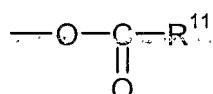
で示されるピラゾロピリミジンを、触媒の存在下で及び希釈剤の存在下で、次式

【化13】



(式中、R<sup>11</sup>はアルキルを表し及びX<sup>4</sup>は塩素又は式

【化14】



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。

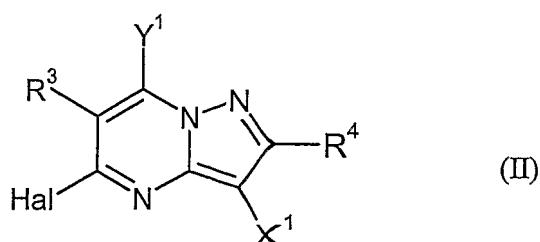
【請求項6】

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15】



(式中、R<sup>3</sup>は場合により置換されていてもよい複素環を表し、

R<sup>4</sup>は水素又はアルキルを表し、

Halはハロゲンを表し、

X<sup>1</sup>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

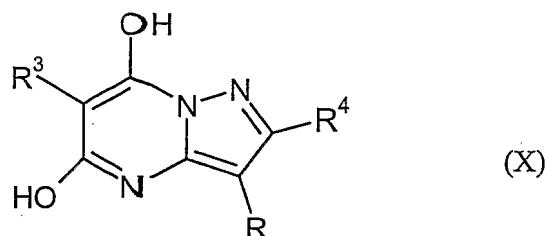
$\gamma^1$  はハロゲンを表す)

で示されるハロゲン化ピラゾロピリミジン。

【請求項 8】

f) 次式

【化 16】



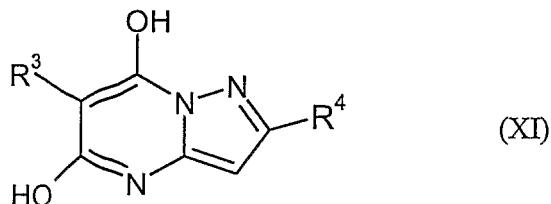
(式中、 $R^3$  及び  $R^4$  は請求項 7 に記載の意味を有し、及び  $R$  はハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルキルアミノカルボニルを表す。)

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 17】



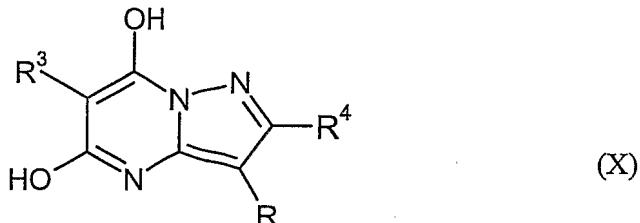
(式中、 $R^3$  及び  $R^4$  は請求項 7 に記載の意味を有する。)

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 18】



(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、及び

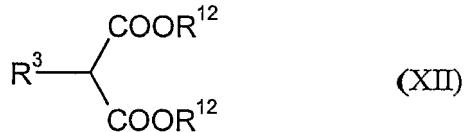
$R$  はハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロゲン化アルキル、シクロアルキル、チ

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

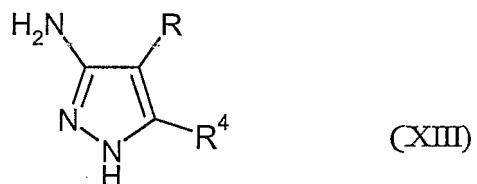
## 【化 19】



(式中、 $\text{R}^3$  は請求項 9 に記載の意味を有し及び  $\text{R}^{12}$  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、 $\text{R}^4$  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。