

【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16年10月14日(2004.10.14)

【公表番号】特表2000-508630(P2000-508630A)

【公表日】平成12年7月11日(2000.7.11)

【出願番号】特願平9-534859

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 273/04

A 0 1 N 43/88

C 0 7 C 281/02

C 0 7 D 209/14

C 0 7 D 213/42

C 0 7 D 317/28

C 0 7 D 333/20

C 0 7 D 413/06

【F I】

C 0 7 D 273/04

A 0 1 N 43/88 1 0 2

C 0 7 C 281/02

C 0 7 D 209/14

C 0 7 D 213/42

C 0 7 D 317/28

C 0 7 D 333/20

C 0 7 D 413/06

【手続補正書】

【提出日】平成15年9月26日(2003.9.26)

【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】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

手続補正書

平成15年9月26日

特許庁長官 今 井 康 夫 殿

1. 事件の表示

平成9年特許願第534859号

2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名称 バイエル・アクチエンゲゼルシャフト

3. 代理人

〒107-0052

住所 東京都港区赤坂1丁目9番15号

日本自転車会館

氏名 (6078) 弁理士 小田島 平 吉



電話 3585-2256

4. 補正命令の日付 なし

5. 補正の対象

請求の範囲

6. 補正の内容

別紙のとおり



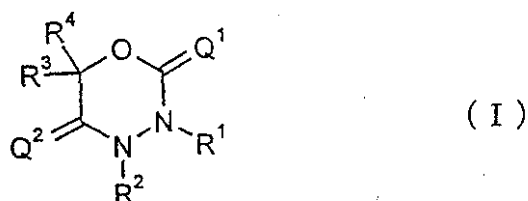
方 式 審 査



(別 紙)

請求の範囲

1. 式 (I)



[式中、

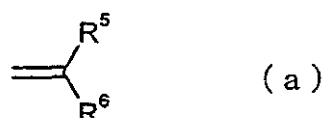
R¹及びR²は互いに独立してそれぞれ水素、それぞれ場合によりハロゲン置換されていることができるアルキル、ヒドロキシアルキル、アルカノイルオキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールアルコキシアルキル、メルカプトアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、カルボキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アリールオキシカルボニルアルキル、アリールアルキルオキシカルボニルアルキル、カルバモイルアルキル、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシカルボニルアミノアルキル、アルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニルを示すか、又はそれぞれ場合により置換されていることができるシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、アリールカルボニル、ヘテロシクリルアルキル、ヘタリールもしくはヘタリールアルキルを示すか、あるいは

R¹、R²及び2つの連結窒素原子は場合により置換されていることができる複素環式環を示し、

R³及びR⁴は互いに独立してそれぞれ水素、それぞれ場合によりハロゲン置換されていることができるアルキル、アルケニル、ヒドロキシア

ルキル、アルカノイルオキシアルキル、アルコキシアルキル、アリー
 アルコキシアルキル、メルカプトアルキル、アルキルチオアルキル、ア
 ルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルコキ
 シカルボニルアルキル、アリールオキシカルボニルアルキル、アリー
 ルアルキルオキシカルボニルアルキル、カルバモイルアルキル、アミノア
 ルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキ
 ルカルボニル、シクロアルキルカルボニルを示すか、又はそれぞれ場合
 により置換されていることができるシクロアルキル、シクロアルキルア
 ルキル、アリール、アリールアルキル、ヘタリールもしくはヘタリール
 アルキルを示すか、あるいは

R^3 及び R^4 は一緒になってアルキレン又は基 (a) を示し、



ここで

R^5 及び R^6 は互いに独立してそれぞれ水素、それぞれ場合によりハロ
 ゲン—置換されていることができるアルキル、アルケニル、ヒドロキシ
 アルキル、アルカノイルオキシアルキル、アルコキシアルキル、アリー
 ルアルコキシアルキル、メルカプトアルキル、アルキルチオアルキル、
 アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルコ
 キシカルボニルアルキル、アリールオキシカルボニルアルキル、アミノ
 アルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アル
 キルカルボニルを示すか、又はそれぞれ場合により置換されていること
 ができるシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリー

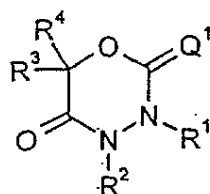
ルアルキル、ヘタリールもしくはヘタリールアルキルを示し、

Q^1 及び Q^2 は互いに独立してそれぞれ酸素又は硫黄を示し、

ただし、6, 6-ジフェニル-(1, 3, 4)-オキサジアジナソ-2, 5-ジオンを除く]

のオキサジアジン誘導体。

2. A) 式 (I-a)



(I-a)

[式中、

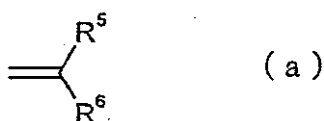
R^1 及び R^2 は互いに独立してそれぞれ水素、それぞれ場合によりハロゲン-置換されていることができるアルキル、ヒドロキシアルキル、アルカノイルオキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールアルコキシアルキル、メルカプトアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、カルボキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アリールオキシカルボニルアルキル、アリールアルキルオキシカルボニルアルキル、カルバモイルアルキル、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシカルボニルアミノアルキル、アルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニルを示すか、又はそれぞれ場合により置換されていることができるシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、アリールカルボニル、ヘテロシクリルアルキル、ヘタリールもしくはヘタリールアルキルを示すか、あるいは

R^1 、 R^2 及び2つの連結窒素原子は場合により置換されていることがで

きる複素環式環を示し、

R^3 及び R^4 は互いに独立してそれぞれ水素、それぞれ場合によりハロゲン—置換されていることができるアルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルカノイルオキシアルキル、アルコキシアルキル、アリーラルコキシアルキル、メルカプトアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アリールオキシカルボニルアルキル、アリーラルキルオキシカルボニルアルキル、カルバモイルアルキル、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニルを示すか、又はそれぞれ場合により置換されていることができるシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリーラルキル、ヘタリールもしくはヘタリールアルキルを示すか、あるいは

R^3 及び R^4 は一緒になってアルキレン又は基 (a) を示し、



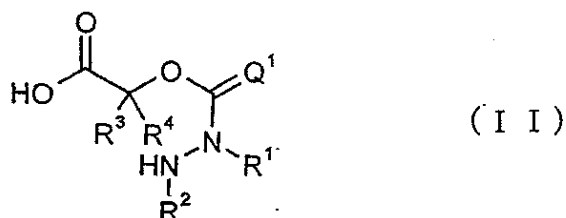
ここで

R^5 及び R^6 は互いに独立してそれぞれ水素、それぞれ場合によりハロゲン—置換されていることができるアルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルカノイルオキシアルキル、アルコキシアルキル、アリーラルコキシアルキル、メルカプトアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アリールオキシカルボニルアルキル、アミノ

アルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニルを示すか、又はそれぞれ場合により置換されていることができるシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘタリールもしくはヘタリールアルキルを示し、

Q¹は酸素又は硫黄を示す]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を製造する場合、式(I I)

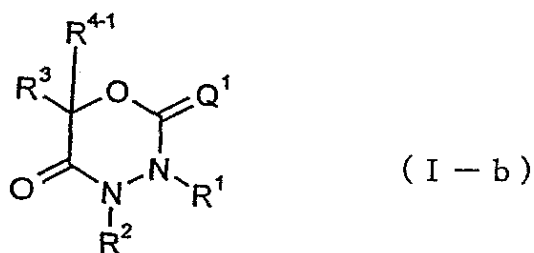


[式中、

R¹~R⁴及びQ¹はそれぞれ上記で定義された通りである]

のカルバゼートを反応助剤及び希釈剤の存在下で及び適宜塩基の存在下で反応させ、

B) 式(I - b)



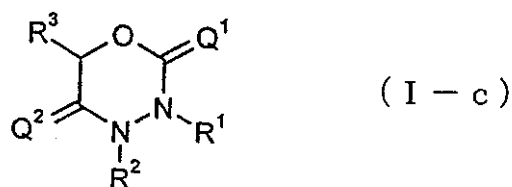
[式中、

R¹~R³及びQ¹はそれぞれ上記で定義された通りであり、

Q²は酸素又は硫黄を示し、

R⁴⁻¹は水素を除くR⁴と同じ基を示す]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を製造する場合、式(I - c)



[式中、

R^1 及び R^2 は水素以外の意味を有し、

R^3 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の (1, 3, 4) - オキサジアジン誘導体を式 (I I I)



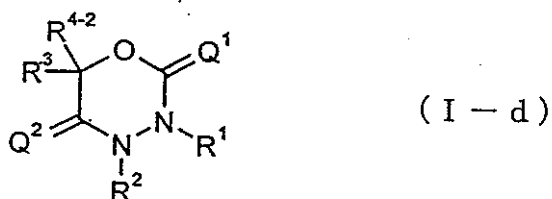
[式中、

R^{4-1} は上記で定義された通りであり、

E は電子一吸引性脱離基を示す]

の化合物と、適宜希釈剤の存在下で及び適宜反応助剤の存在下で反応させ、

C) 式 (I - d)



[式中、

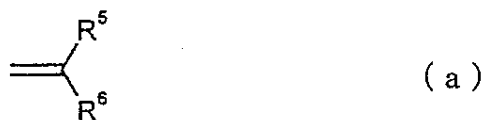
$R^1 \sim R^3$ 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りであり、

R^{4-2} は基 (b) を示し、



ここで

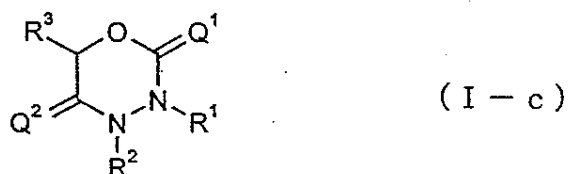
R^5 及び R^6 は互いに独立してそれぞれ水素、場合により置換されていることができるアルキル又はアリールを示すか、あるいは
 R^3 及び R^{4-2} は一緒になって基 (a) を示し、



ここで

R^5 及び R^6 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の (1, 3, 4) -オキサジアジン誘導体を製造する場合、式 (I - c)



[式中、

$R^1 \sim R^3$ 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の (1, 3, 4) -オキサジアジン誘導体を式 (I V)

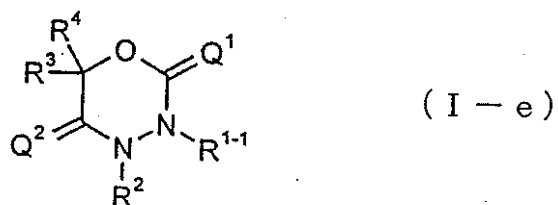


[式中、

R^5 及び R^6 はそれぞれ上記で定義された通りである]

のケトン又はアルデヒドと、適宜希釈剤の存在下で及び適宜反応助剤の存在下で反応させ、続いて適宜水を脱離させ、

D) 式 (I - e)



[式中、

R^{1-1} は水素を除いて R^1 と同じ基を示し、

$R^2 \sim R^4$ 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を製造する場合、式(I - f)



[式中、

$R^2 \sim R^4$ 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を式(V)



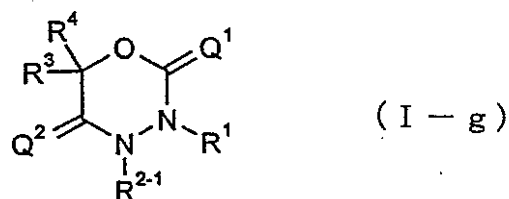
[式中、

R^{1-1} は上記で定義された通りであり、

Eは電子-吸引性脱離基を示す]

の化合物と、適宜希釈剤の存在下で及び適宜反応助剤の存在下で反応させ、

E) 式(I - g)

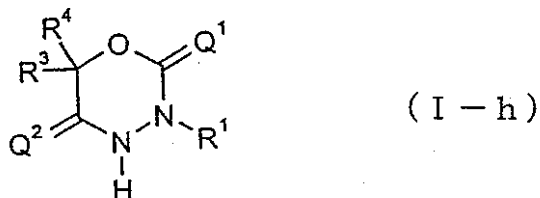


[式中、

R^1 、 R^3 、 R^4 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りであり、

R^{2-1} は水素を除いて R^2 と同じ基を示す]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を製造する場合、式(I-h)



[式中、

R^1 、 R^3 、 R^4 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を式(VI)



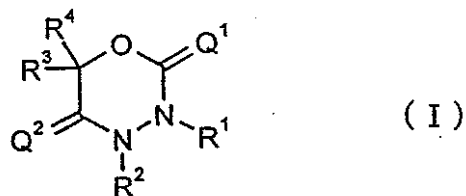
[式中、

R^{2-1} は上記で定義された通りであり、

Eは電子-吸引性脱離基を示す]

の化合物と、適宜希釈剤の存在下で及び適宜反応助剤の存在下で反応させ、

F) 式(I)

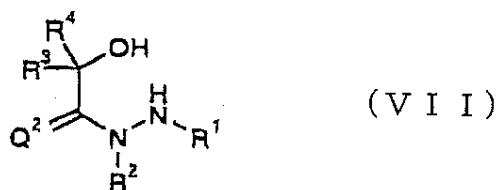


[式中、

$R^1 \sim R^4$ 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を製造する場合、式(VI)

I)



[式中、

R¹～R⁴及びQ²はそれぞれ上記で定義された通りである]

の化合物を式 (VII I)



[式中、

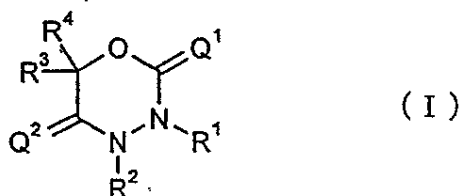
Y¹は塩素、トリクロロメトキシ、C₁～C₄-アルコキシ、場合により置換されていることができるフェノキシ、1-イミダゾリル又は1, 2, 4-トリアゾリルを示し、

Y²は塩素、トリクロロメトキシ、1-イミダゾリル又は1, 2, 4-トリアゾリルを示し、

Q¹は上記で定義された通りである]

の化合物と、適宜希釈剤の存在下で及び適宜反応助剤の存在下で反応させて縮合環化させ、

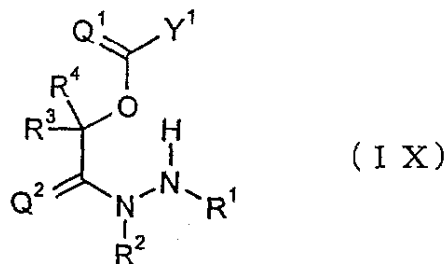
G) 式 (I)



[式中、

$R^1 \sim R^4$ 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を製造する場合、式(I X)

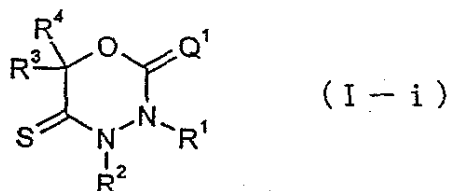


[式中、

$R^1 \sim R^4$ 、 Q^1 、 Q^2 及び Y^1 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の化合物を、適宜希釈剤の存在下で及び適宜反応助剤の存在下で縮合環化させ、

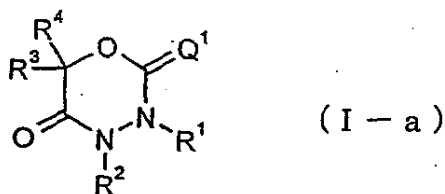
H) 式(I - i)



[式中、

$R^1 \sim R^4$ 及び Q^1 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体を製造する場合、式(I - a)



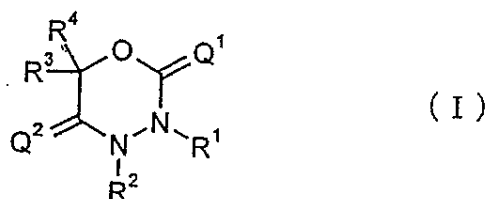
[式中、

$R^1 \sim R^4$ 及び Q^1 はそれぞれ上記で定義された通りである]

の(1, 3, 4)-オキサジアジン誘導体をチオニル化剤と、適宜希釈

剤の存在下で反応させる

ことを特徴とする請求の範囲第1項に記載の式 (I)

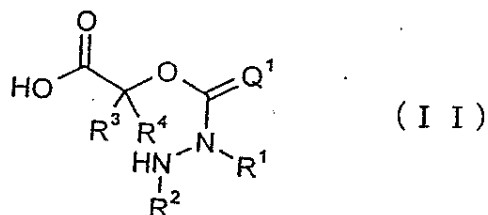


[式中、

$R^1 \sim R^4$ 、 Q^1 及び Q^2 はそれぞれ上記で定義された通りである]

のオキサジアジン誘導体の製造法。

3. 式 (II)

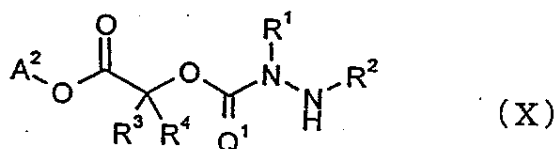


[式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び Q^1 はそれぞれ請求の範囲第2項で定義された通りである]

のカルバゼートであり、ただし、同時に R^2 及び R^4 がそれぞれ水素を示し、 R^1 が C_1-C_5 -アルキルを示し、 R^3 がメチル又はベンジルを示す式 (II) の化合物を除くカルバゼート。

4. a) 式 (X)



[式中、

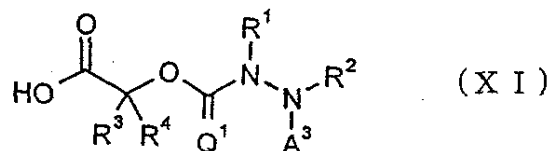
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び Q^1 はそれぞれ請求の範囲第3項で定義された

通りであり、

A^2 はC-末端保護基を示す]

のC-末端保護カルバゼートからそれ自体既知の方法で保護基 A^2 を開裂させるか、あるいは

b) 式 (X I)



[式中、

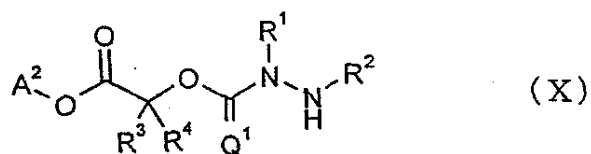
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び Q^1 はそれぞれ請求の範囲第3項で定義された通りであり、

A^3 はN-末端保護基を示す]

のN-末端保護カルバゼートからそれ自体既知の方法で保護基 A^3 を開裂させる

ことを特徴とする請求の範囲第3項に記載の式 (I I) のカルバゼートの製造法。

5. 式 (X)



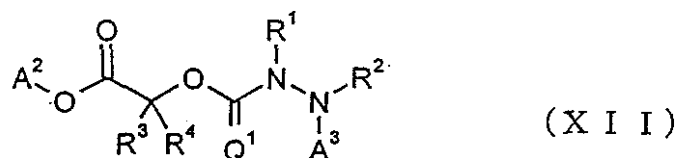
[式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び Q^1 はそれぞれ請求の範囲第3項で定義された通りであり、

A^2 はC-末端保護基を示す]

のC-末端保護カルバゼートであり、ただし、 R^2 、 R^4 がそれぞれ水素を示し、 R^1 が C_1-C_5 -アルキルを示し、 R^3 がメチル又はベンジルを示す化合物を除くC-末端保護カルバゼート。

6. 式 (X I I)



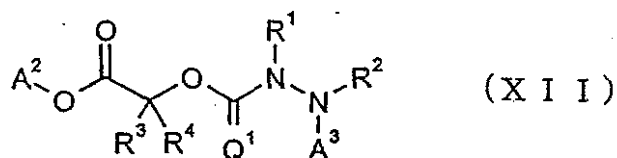
[式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Q^1 及び A^2 はそれぞれ請求の範囲第5項で定義された通りであり、

A^3 は請求の範囲第4項で定義された通りである]

のN-及びO-末端保護カルバゼートからそれ自体既知の方法でN-末端保護基 A^3 を開裂させることを特徴とする請求の範囲第5項に記載の式(X)のC-末端保護カルバゼートの製造法。

7. 式 (X I I)



[式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Q^1 及び A^2 はそれぞれ請求の範囲第5項で定義された通りであり、

A^3 は請求の範囲第4項で定義された通りである]

のN-及びC-末端保護カルバゼートであって、 R^2 、 R^4 がそれぞれ

水素を示し、 R^1 が C_{1-5} アルキルを示し、 R^2 がメチル又はベンジルを示す化合物を除くN-及びC-末端保護カルバゼート。

8. 請求の範囲第1項に記載の式(I)の1, 3, 4-オキサジアジン誘導体の少なくとも1種を含有することを特徴とする有害生物防除剤。

9. 請求の範囲第1項に記載の式(I)の1, 3, 4-オキサジアジン誘導体の有害生物及び内部寄生虫の抑制のための利用。