

(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2004-524310

(P2004-524310A)

(43) 公表日 平成16年8月12日(2004.8.12)

(51) Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード (参考)
C 07 D 401/04	C O 7 D 401/04	4 C O 6 3
A O 1 N 43/54	A O 1 N 43/54	C 4 H O 1 1
C 07 D 401/14	C O 7 D 401/14	4 H O 3 9
C 07 D 405/14	C O 7 D 405/14	
C 07 D 409/14	C O 7 D 409/14	
審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 437 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2002-567066 (P2002-567066)	(71) 出願人	302063961
(86) (22) 出願日	平成14年2月11日 (2002.2.11)		バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ ンゲゼルシャフト
(85) 翻訳文提出日	平成15年8月21日 (2003.8.21)		ドイツ40789モンハイム・アルフレー ト・ノペル・シュトラッセ50
(86) 国際出願番号	PCT/EP2002/001403		
(87) 国際公開番号	W02002/067684	(74) 代理人	100060782
(87) 国際公開日	平成14年9月6日 (2002.9.6)		弁理士 小田島 平吉
(31) 優先権主張番号	101 08 481.1	(72) 発明者	ブレチユナイダー, トマス
(32) 優先日	平成13年2月22日 (2001.2.22)		ドイツ53797ローマー・タルシュトラ ッセ29ベ
(33) 優先権主張国	ドイツ (DE)	(72) 発明者	エス・ザエド, マツエン
			ドイツ40764ランゲンフェルト・リカ ルダーフ・シュトラッセ36
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての使用のためのピリジルピリミジン類

(57) 【要約】

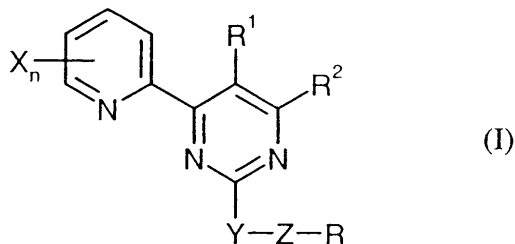
本発明は式 (I) の新規なピリジルピリミジンに関し、式中、 R^1 、 R^2 、X、n、Y、Z 及び R は記述中における通りに定義される。本発明はさらに、該物質の製造のためのいくつかの方法及び有害生物防除剤としてのそれらの使用ならびにそれらの製造のための新規な中間体及び方法に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

〔式中、

R^1 及び R^2 は互いに独立して水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、シクロアルキルを示すか；あるいは場合により置換されていることができるアリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示し、

20

R^1 及び R^2 はさらに一緒になってアルキレン又はアルケニレンを示し、ここで炭素鎖は窒素及び酸素よりなる群からの 1～3 個のヘテロ原子により中断されていることができ且つ生ずる環はそれ自身が場合によりハロゲン又はアルキルで置換されていることができ、 X はハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示すか；

30

あるいは n が 2、3 又は 4 を示す場合、2 個の隣接する基 X はさらに一緒になってアルキレン又はアルケニレンを示し、ここで炭素鎖は窒素及び酸素よりなる群からの 1 もしくは 2 個のヘテロ原子で中断されていることができ、

n は 0、1、2、3 又は 4 を示し、 n が 2、3 又は 4 を示す場合、 X は同一もしくは異なる基を示し、

Y は直接結合、酸素、 $-S(O)_p -$ 又は $-NR^9 -$ を示し、

p は 0、1 又は 2 を示し、

Z は $-(CH_2)_r -$ 、 $-(CH_2)_t - (CHR^{10}) - (CH_2)_w -$ 、 $-(CH_2)_r - C(O) - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - O - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - S(O)_p - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - N(R^{11}) - (CH_2)_t -$ 又は $-(CH_2)_t - C(R^{12}) = C(R^{13}) - (CH_2)_w -$ を示し、

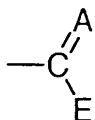
40

r は 1、2、3、4、5 又は 6 を示し、

t 及び w は互いに独立して 0、1、2、3 又は 4 を示し、

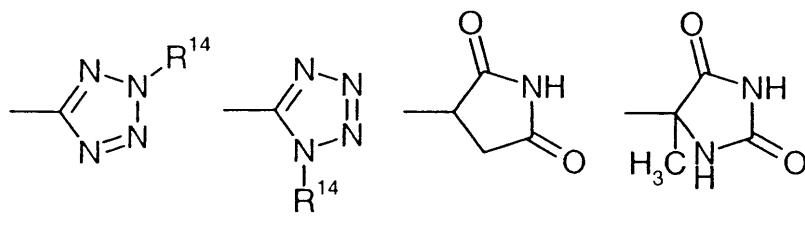
R は基

【化 2】



を示すか、
あるいは特に

【化 3】



10

よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター（酸模倣物）を示し、

Aは酸素、硫黄又は NR^{15} を示し、

Eは $-\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{SR}^{16}$ 、 $-\text{O}^-\text{M}$ 、 $-\text{S}^-\text{M}$ 又は $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ を示し、

Mは場合によりアルキル、アリール又はアリールアルキルで置換されていることができるアンモニウムを示すか、あるいはアルカリ金属イオンを示し、

Mはさらにアルカリ土類金属イオンを示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成し、

R^3 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲンー、アルキルー、ハロゲノアルキルー、アルコキシー、ハロゲノアルコキシー、アルキルチオー、ハロゲノアルキルチオー置換されていることができるアリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示し、

R^4 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル又はアルキルカルボニルを示し、

R^5 は水素、アミノ、ホルミル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、オキサモイルを示し、

R^4 及び R^5 はさらに一緒になってアルキリデンを示すか；あるいは場合によりハロゲンー、ニトロー、アルキルー、ハロゲノアルキルー置換されていることができるベンジリデンを示し；

R^4 及び R^5 はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にあって飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは場合によりさらなる窒素、酸素もしくは硫黄原子を含有していることができ且つそれは場合によりアルキルで置換されていることができ、

40

R^6 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル又はアリールアルキルを示し、

R^7 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール又はアリールアルキルを示し、

R^8 はアルキル又はハロゲノアルキルを示し、

R^9 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲンー、アルキルー、ハロゲノアルキルー、アルコキシー、ハロゲノアルコキシー、アルキルチオー、ハロゲノアルキルチオー置換されていることができるアリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示し、

50

R^{10} はハロゲン、アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルを示すか；あるいはアリール又はアリールアルキルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてハロゲン又はアルキルで置換されていることができ、

R^{11} は水素又はアルキルを示し、

R^{12} 及び R^{13} は互いに独立して水素、ヒドロキシル、アルキル又はアルコキシを示し、

R^{14} は水素、アルキル又はハロゲノアルキルを示し、

R^{15} は水素、アルキル、アルコキシ、シアノ又はジアルキルアミノを示し、

R^{16} は水素を示すか；それぞれ場合によりハロゲン-、アミノ-、ヒドロキシル-、シアノ-、ニトロ-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-、アルコキシカルボニル-、アルケニルオキシカルボニル-、アルキルカルボニルオキシ-、アルケニルカルボニルオキシ-、オキシアルキレンオキシ-、オキセタニル-、ジオキサニル-、オキサゾリジニル-、ジオキサソラニル-、アリールオキシ-、ハロゲノアリールオキシ-、 $-CONR^4R^5-$ 、 $-NR^4R^5-$ 、 $-ONR^4R^5-$ 、 $-C(R^{14})=N-OR^{14}-$ 置換されていることができるアルキル、アルケニル、アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン-、アルキル-、ハロゲノアルキル-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-、アルコキシカルボニル-、アルキルカルボニルオキシ- 置換されていることができるアリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示すか；あるいは $-NR^4R^5$ を示すか、あるいは基 Q の 1 つを示し、

R^{16} はさらにそれぞれ場合により置換されていることができるアリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示し、ここで置換基は上記で挙げたものの他にヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができ、

R^{17} は水素又はアルキルを示し、

R^{18} は水素、ヒドロキシル、アミノ、アルキル、アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン-、ヒドロキシル-、アルキル-、ハロゲノアルキル-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-、オキシアルキレンオキシ- 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、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有するヘテロアリール又はヘテロアリールアルキルを示すか；あるいは $-S(O)_pR^3$ 、 $-OR^{14}$ 又は $-NR^4R^5$ を示し、

R^{18} はさらにそれぞれハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルコキシカルボニル及びアルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基で置換されているアルキル又はアルケニルを示し、

R^{18} はさらに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、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有するヘテロアリール又はヘテロアリールアルキルを示し、ここで置換基は上記で挙げたものの他にニトロ及びアルコキシカルボニルよりなる群から選ばれることができ、

R^{17} 及び R^{18} はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に 5-もしくは 6-員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～2 個のさらなるヘテロ原子を含有していることができ且つそれは場合によりアルキルで置換されていることができ、

Q は下記の基の 1 つを示し、

10

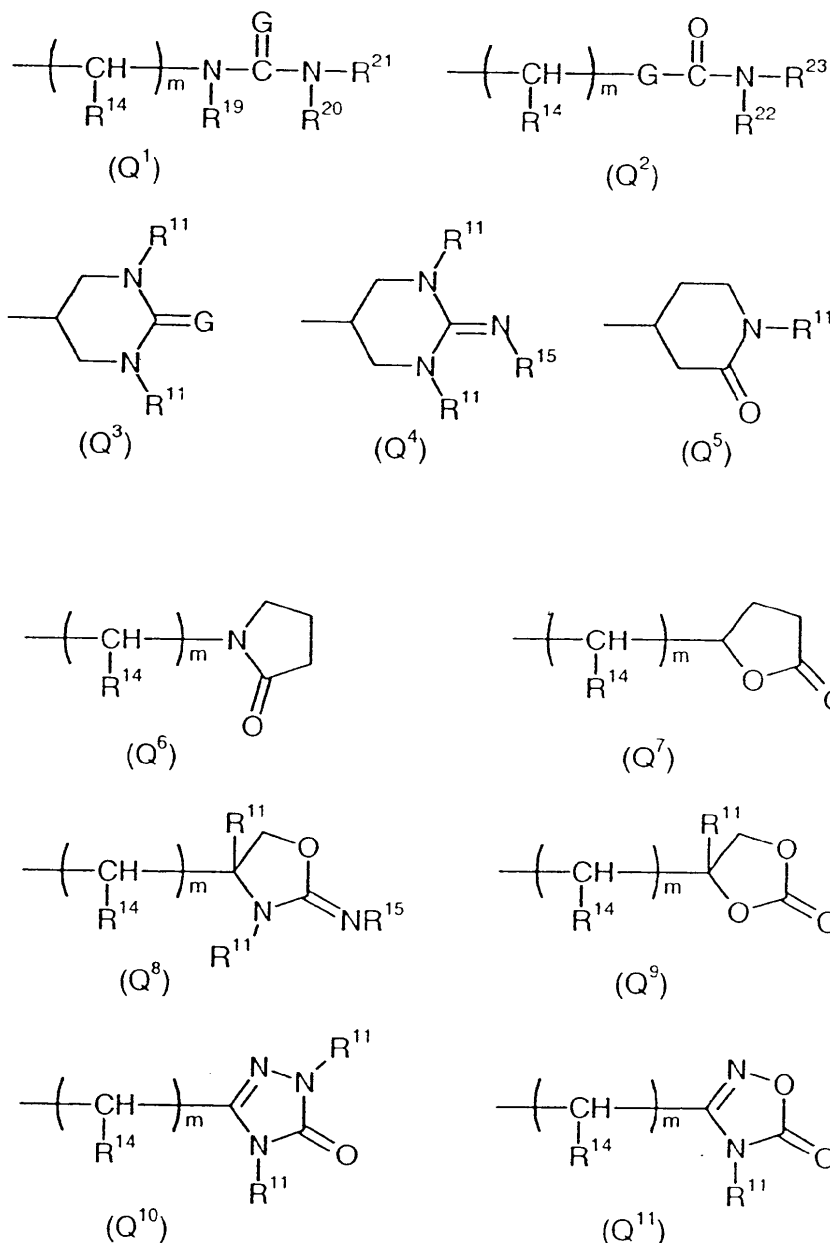
20

30

40

50

【化 4】



10

20

30

40

ここで基 R^{11} は、同じ複素環式基中に 2 個もしくはそれより多くが存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができ、

m は 0、1、2 又は 3 を示し、ここで m が 2 又は 3 を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰返し単位 $-(CHR^{14})-$ は同一もしくは異なる意味を有することができ、

G は酸素又は硫黄を示し、

R^{19} 及び R^{20} は互いに独立して水素、アルキルを示すか、あるいは一緒になってアルキレンを示し、

R^{21} は水素を示すか、場合によりアルキルカルボニルオキシもしくはアルコキシ置換されていることができるアルキルを示すか；あるいは場合によりハロゲン、シアノ、アルキル、ハロゲンアルキル、アルキルカルボニル、アルコシカルボニル、アルキレン置換されていることができるアリールを示し、

R^{22} は水素、アルキル又はアルコシアルキルを示し、

R^{23} は水素、アミノ、アルキル又はアルコシアルキルを示す]

のピリジルピリミジン類。

【請求項 2】

50

R^{1-6} が水素を示すか、それぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルコシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルケニルカルボニルオキシ、オキシアルキレンオキシ、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサニル、アリールオキシ、ハロゲノアリールオキシ、 $-CONR^4R^5-$ 、 $-NR^4R^5-$ 、 $-ONR^4R^5-$ 、 $-C(R^{1-4})=N-OR^{1-4}-$ 置換されていることができるアルキル、アルケニル、アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルコシカルボニル、アルキルカルボニルオキシ置換されていることができるアリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示すか；あるいは $-NR^4R^5$ を示すか、あるいは基 Q の 1 つを示し、

10

R^{1-8} が水素、ヒドロキシル、アミノ、アルキル、アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、ヒドロキシル、アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、オキシアルキレンオキシ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、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有するヘテロアリール又はヘテロアリールアルキルを示すか；あるいは $-S(O)_pR^3$ 、 $-OR^{1-4}$ 又は $-NR^4R^5$ を示す

20

請求項 1 に従う式 (I) のピリジルピリミジン類。

【請求項 3】

R^1 及び R^2 が互いに独立して水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキルチオ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_pR^3$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NHCO_2R^8$ 、 C_3-C_7 -シクロアルキルを示すか；あるいはアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル又は 0～3 個の窒素原子、0～2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0～2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 5-もしくは 6-員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示し、それらの基のそれぞれは場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ及び C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ-もしくはポリ置換されていることができ、

30

R^1 及び R^2 がさらに一緒になって C_3-C_5 -アルキレン又は C_3-C_4 -アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は 0～2 個の窒素原子及び／又は 0 もしくは 1 個の酸素原子を含む 1 もしくは 2 個のヘテロ原子により中断されていることができ且つここで生ずる環はそれ自身が場合によりハロゲン及び C_1-C_6 -アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ-もしくはポリ置換されていることができ、

40

X がハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキルチオ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_pR^3$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NHCO_2R^8$ 、 C_3-C_7 -シクロアルキル、アリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、0～4 個の窒素原子、0～2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0～2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 5-もしくは 6-員の飽和もしくは不飽和ヘテロ

50

シクリルを示すか；

あるいはnが2又は3を示す場合、2個の隣接する基Xがさらに一緒になってC₃－C₅－アルキレン又はC₃－C₄－アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は0～2個の窒素原子及び／又は0もしくは1個の酸素原子を含む1もしくは2個のヘテロ原子により中断されていることができ

nが0、1、2又は3を示し、nが2又は3を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示し、

Yが直接結合、酸素、－S(O)_p－又は－NR⁹－を示し、

pが0、1又は2を示し、

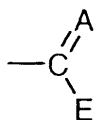
Zが－(CH₂)_r－、－(CH₂)_t－(CHR¹⁰)－(CH₂)_w－、－(CH₂)_r－C(O)－(CH₂)_t－、－(CH₂)_r－O－(CH₂)_t－、－(CH₂)_r－S(O)_p－(CH₂)_t－、－(CH₂)_r－N(R¹¹)－(CH₂)_t－又は－(CH₂)_t－C(R¹²)＝C(R¹³)－(CH₂)_w－を示し、

rが1、2、3、4、5又は6を示し、

t及びwが互いに独立して0、1、2、3又は4を示し、

Rが基

【化5】

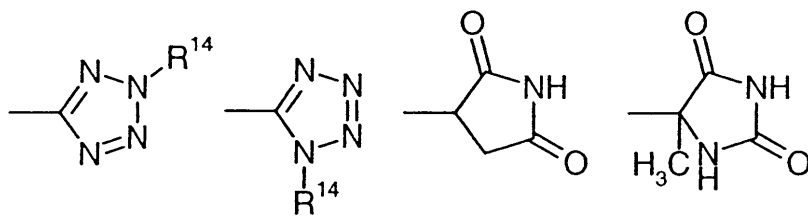


20

を示すか、

あるいは特に

【化6】



30

よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター（酸模倣物）を示し、

Aが酸素、硫黄又はNR¹⁵を示し、

Eが－OR¹⁶、－SR¹⁶、－O[－]M、－S[－]M又は－NR¹⁷R¹⁸を示し、

Mが場合によりC₁－C₆－アルキル、アリール及びアリール－C₁－C₆－アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるアンモニウムを示すか、あるいはリチウムカチオン（Li⁺）、ナトリウムカチオン（Na⁺）又はカリウムカチオン（K⁺）を示し、

Mがさらにマグネシウムカチオン（Mg²⁺）又はカルシウムカチオン（Ca²⁺）を示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成し、

R³が水素、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－ハロゲノアルキル、C₃－C₇－シクロアルキル、C₃－C₇－シクロアルキル－C₁－C₆－アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－ハロゲノアルキル、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₆－ハロゲノアルコキシ、C₁－C₆－アルキルチオ及びC₁－C₆－ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～もしくはポリ置換されていることができるアリール、アリール－C₁－C₆－アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル－C₁－C₆－アルキルを示し、

50

R^4 が水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルを示し、

R^5 が水素、アミノ、ホルミル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、オキサモイルを示し、

R^4 及び R^5 がさらに一緒になって $C_1 - C_6$ - アルキリデンを示すか；あるいは場合によりハロゲン、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルキル及び $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるベンジリデンを示し；

R^4 及び R^5 がさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5 - もしくは 6 - 員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは場合によりさらなる窒素、酸素もしくは硫黄原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なる $C_1 - C_6$ - アルキルでモノーもしくはポリ置換されていることができ、

R^6 が水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル又はアリール- $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、

R^7 が水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、アリール又はアリール- $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、

R^8 が $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルを示し、

R^9 が水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ及び $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ 0 ~ 4 個の窒素原子、0 ~ 2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0 ~ 2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 5 - もしくは 6 - 員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、

R^{10} がハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキルを示すか；あるいはアリール又はアリール- $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてハロゲン及び $C_1 - C_6$ - アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができ、

R^{11} が水素又は $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、

R^{12} 及び R^{13} が互いに独立して水素、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_1 - C_6$ - アルコキシを示し、

R^{14} が水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルを示し、

R^{15} が水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ又はジ ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノを示し、

R^{16} が水素を示すか；それぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルカルボニルオキシ、オキシ ($C_1 - C_6$ - アルキレン) オキシ、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサソラニル、アリールオキシ、ハロゲノアリールオキシ、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-ONR^4R^5$ 及び $-C(R^{14}) = N-OR^{14}$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる $C_1 - C_{16}$ - アルキル、 $C_2 - C_{10}$ - アルケニル、 $C_2 - C$

10

20

30

40

50

C_6 - アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル及び $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する4～6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_6$ - アルキルを示すか；あるいは $-NR^4R^5$ を示すか、あるいは基Qの1つを示し、

10

R^{16} がさらにアリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する4～6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、それらの基のそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができ、

R^{17} が水素又は $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、

R^{18} が水素、ヒドロキシル、アミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ及びオキシ($C_1 - C_6$ - アルキレン)オキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、アリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- $C_1 - C_6$ - アルキルを示すか；あるいは $-S(O)_pR^3$ 、 $-OR^{14}$ 又は $-NR^4R^5$ を示し、

20

R^{18} がさらにそれぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル及び $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_2 - C_6$ - アルケニルを示し、

30

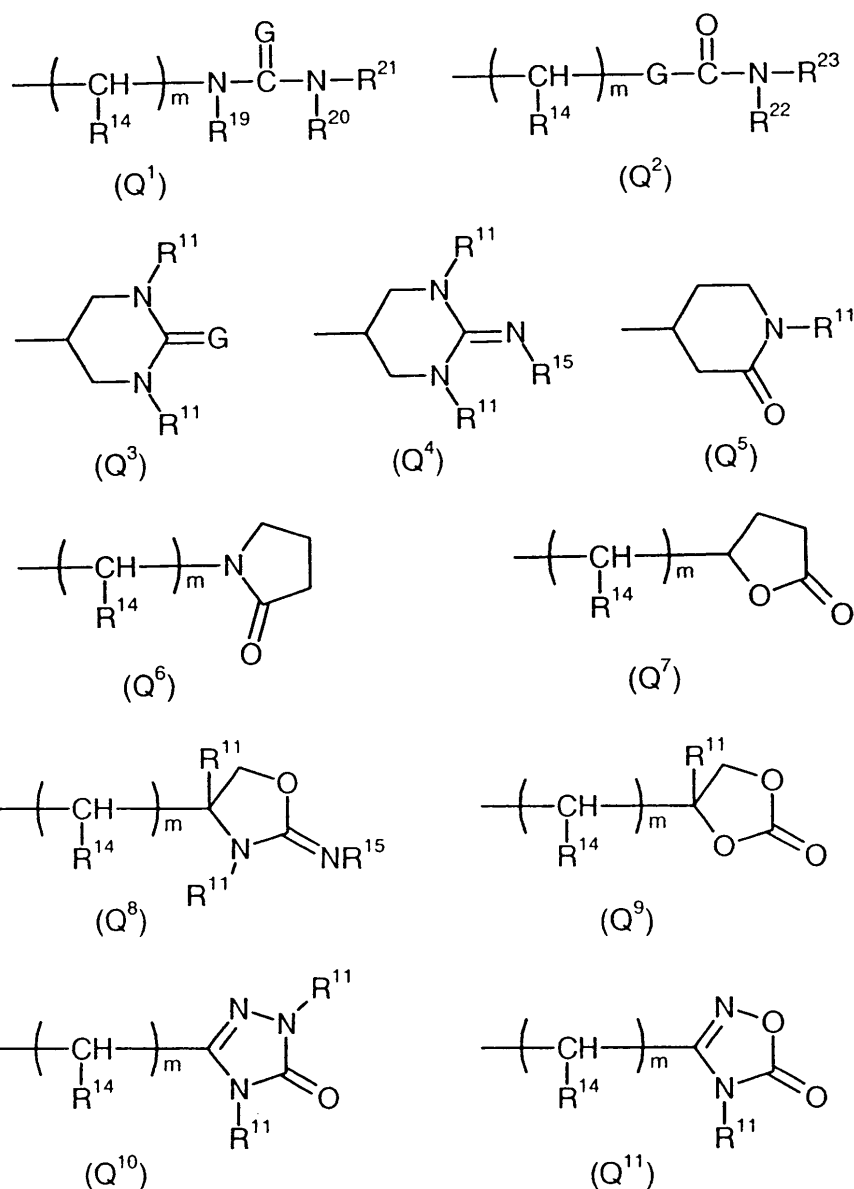
R^{18} がさらにそれぞれ場合により同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、アリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、ここで置換基は上記で挙げたものの他にニトロ及び $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルよりなる群から選ばれることができ、

40

R^{17} 及び R^{18} がさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5もしくは6員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは0～2個の窒素原子、0もしくは1個の酸素原子及び／又は0もしくは1個の硫黄原子を含む1もしくは2個のさらなるヘテロ原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なる $C_1 - C_6$ - アルキルでモノーもしくはポリ置換されていることができ、

Qが下記の基の1つを示し、

【化 7】



10

20

30

ここで基 R^{11} は、同じ複素環式基中に 2 個もしくはそれより多くが存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができ、

m が 0、1、2 又は 3 を示し、ここで m が 2 又は 3 を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰り返し単位 $\text{---}(\text{CH} \text{R}^{14})\text{---}$ は同一もしくは異なる意味を有することができ、

G が酸素又は硫黄を示し、

R^{19} 及び R^{20} が互いに独立して水素、 $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルキルを示すか、あるいは一緒になって $\text{C}_2\text{---C}_4$ -アルキレンを示し、

R^{21} が水素を示すか、場合により $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルキルカルボニルオキシ及び $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルキルを示すか；あるいは場合によりハロゲン、シアノ、 $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\text{---C}_6$ -ハロゲンアルキル、 $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルキルカルボニル、 $\text{C}_1\text{---C}_{10}$ -アルコキシカルボニル及び $\text{C}_3\text{---C}_5$ -アルキレンよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリールを示し、

R^{22} が水素、 $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルキル又は $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1\text{---C}_6$ -アルキルを示し、

50

$R^{2,3}$ が水素、アミノ、 C_1-C_6 -アルキル又は C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキルを示す

請求項 1 に従う式 (I) のピリジルピリミジン類。

【請求項 4】

$R^{1,6}$ が水素を示すか；それぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 -アルケニルカルボニルオキシ、オキシ (C_1-C_6 -アルキレン) オキシ、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサソラニル、アリールオキシ、ハロゲノアリールオキシ、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-ONR^4R^5$ 及び $-C(R^{1,4})=N-OR^{1,4}$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる C_1-C_{16} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、それぞれ 0~4 個の窒素原子、0~2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0~2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 4~6 員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルを示すか；あるいは $-NR^4R^5$ を示すか、あるいは基 Q の 1 つを示し、

$R^{1,8}$ が水素、ヒドロキシル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキルチオ及びオキシ (C_1-C_6 -アルキレン) オキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、アリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、それぞれ 0~4 個の窒素原子、0~2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0~2 個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキルを示すか；あるいは $-S(O)_pR^3$ 、 $-OR^{1,4}$ 又は $-NR^4R^5$ を示す

請求項 3 に従う式 (I) のピリジルピリミジン類。

【請求項 5】

R^1 及び R^2 が互いに独立して水素、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、1~9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、1~9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、1~9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキルチオ、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 $-S(O)_pR^3$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NHCO_2R^8$ 、 C_3-C_6 -シクロアルキルを示すか；あるいはアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキル、0~3 個の窒素原子、0~2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0~2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 5~6 員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示し、それらの基のそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、1~9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ及び 1~9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー~テトラ置換されていることができ、

R^1 及び R^2 がさらに一緒になって $C_3 - C_5$ - アルキレン又は $C_3 - C_4$ - アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は 0 ～ 2 個の窒素原子及び／又は 0 もしくは 1 個の酸素原子を含む 1 もしくは 2 個のヘテロ原子により中断されていることができ且つここで生ずる環はそれ自身が場合によりフッ素、塩素、臭素及び $C_1 - C_4$ - アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～テトラ置換されていることができ、

X がフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルキル、1 ～ 9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、1 ～ 9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、1 ～ 9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、アリール、アリール- $C_1 - C_4$ - アルキル、0 ～ 3 個の窒素原子、0 ～ 2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0 ～ 2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 5 - もしくは 6 - 員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示すか、

あるいは n が 2 を示す場合、2 個の隣接する基 X がさらに一緒になって $C_3 - C_4$ - アルキレン又は $C_3 - C_4$ - アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は 0 ～ 2 個の窒素原子及び／又は 0 もしくは 1 個の酸素原子を含む 1 もしくは 2 個のヘテロ原子により中断されていることができ、

n が 0、1 又は 2 を示し、n が 2 を示す場合、X は同一もしくは異なる基を示し、

Y が直接結合、酸素、 $-S(O)_p -$ 又は $-NR^9 -$ を示し、

p が 0、1 又は 2 を示し、

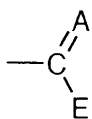
Z が $-(CH_2)_r -$ 、 $-(CH_2)_t - (CHR^{10}) - (CH_2)_w -$ 、 $-(CH_2)_r - C(O) - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - O - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - S(O)_p - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - N(R^{11}) - (CH_2)_t -$ 又は $-(CH_2)_t - C(R^{12}) = C(R^{13}) - (CH_2)_w -$ を示し、

r が 1、2、3 又は 4 を示し、

t 及び w が互いに独立して 0、1、2、3 又は 4 を示し、

R が基

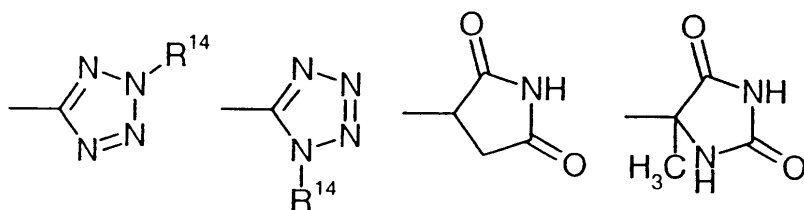
【化 8】



を示すか、

あるいは特に

【化 9】



よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター（酸模倣物）を示し、

A が酸素又は硫黄を示し、

E が $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 、 $-O^-M$ 、 $-S^-M$ 又は $-NR^{17} R^{18}$ を示し、

M が場合により $C_1 - C_4$ - アルキル、フェニル、ベンジル及びフェニルエチルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～テトラ置換されていることができるアンモ

10

20

30

40

50

ニウムを示すか、あるいはナトリウムカチオン (Na^+) 又はカリウムカチオン (K^+) を示し、

Mがさらにマグネシウムカチオン (Mg^{2+}) 又はカルシウムカチオン (Ca^{2+}) を示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成し、

R^3 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルチオ及び1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるアリール、アリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルを示し、

R^4 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルカルボニルを示し、

R^5 が水素、アミノ、ホルミル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_4$ -アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_4$ -アルキニル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルカルボニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルコキシカルボニル、オキサモイルを示し、

R^4 及び R^5 がさらに一緒になって $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキリデンを示すか；あるいは場合によりフッ素、塩素、臭素、ニトロ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル及び1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるベンジリデンを示し；

R^4 及び R^5 がさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは場合によりさらなる窒素、酸素もしくは硫黄原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なる $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルでモノ～テトラ置換されていることができ、

R^6 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル又はアリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルを示し、

R^7 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、アリール又はアリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルを示し、

R^8 が $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル又は1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

R^9 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキルチオ及び1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるアリール、アリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アル

キルを示し、

$R^{1\ 0}$ がフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか；あるいはアリール又はアリール- $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてフッ素、塩素、臭素及び $C_1 - C_4$ -アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができ、

$R^{1\ 1}$ が水素又は $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、

$R^{1\ 2}$ 及び $R^{1\ 3}$ が互いに独立して水素、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は $C_1 - C_4$ -アルコキシを示し、

$R^{1\ 4}$ が水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

$R^{1\ 5}$ が水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、シアノ又はジ ($C_1 - C_4$ -アルキル) アミノを示し、

$R^{1\ 6}$ が水素を示すか；それぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_4$ -アルケニルオキシカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_4$ -アルケニルカルボニルオキシ、オキシ ($C_1 - C_4$ -アルキレン) オキシ、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサニル、アリールオキシ、ハロゲノアリールオキシ、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-ONR^4 R^5$ 及び $-C(R^{1\ 4}) = N-OR^{1\ 4}$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができる $C_1 - C_6$ -アルキル、デシル、ドデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、デセニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル及び $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるアリール、アリール- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する4～6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか；あるいは基Qの1つを示し、

$R^{1\ 6}$ がさらに場合によりそれぞれフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは異なる置換基で可能な最高の数まで置換されていることができる $C_1 - C_6$ -アルキル、デシル、ドデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、デセニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニルを示し、

$R^{1\ 6}$ がさらにアリール、アリール- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する4～6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、それらの基のそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができ、

$R^{1\ 7}$ が水素又は $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、

$R^{1\ 8}$ が水素、ヒドロキシル、アミノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル

10

20

30

40

50

を示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲンアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲンアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲンアルキルチオ及びオキシ（ C_1-C_4 -アルキレン）オキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができる C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、アリール、アリール- C_1-C_4 -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキルを示すか；

10

あるいは $-S(O)_pR^3$ 、 $-OR^{1,4}$ 又は $-NR^4R^5$ を示し、 $R^{1,8}$ がさらにそれぞれフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲンアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲンアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル及び C_2-C_4 -アルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されている C_1-C_4 -アルキル又は C_2-C_4 -アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは異なる置換基で可能な最高の数まで置換されていることができる C_1-C_4 -アルキル又は C_2-C_4 -アルケニルを示し、

20

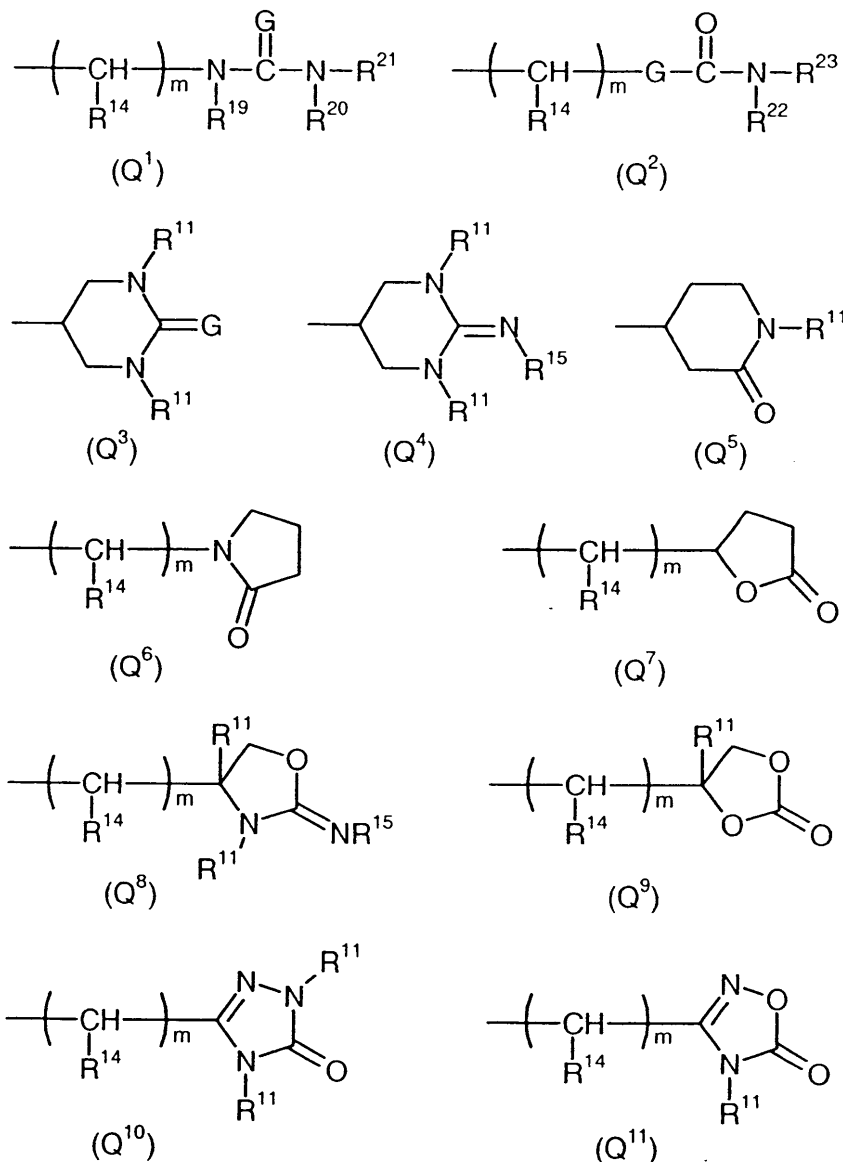
$R^{1,8}$ がさらにそれぞれ場合により同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができる C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、アリール、アリール- C_1-C_4 -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキルを示し、ここで置換基は挙げたものの他にニトロ及び C_1-C_6 -アルコキシカルボニルよりなる群から選ばれることができ、

$R^{1,7}$ 及び $R^{1,8}$ がさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5～もしくは6-員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは0～2個の窒素原子、0もしくは1個の酸素原子及び／又は0もしくは1個の硫黄原子を含む1もしくは2個のさらなるヘテロ原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なる C_1-C_4 -アルキルでモノ～トリ置換されていることができ、

30

Qが下記の基の1つを示し、

【化 10】



10

20

30

40

50

ここで基 R^{11} は、それらの 2 個もしくはそれより多くが同じ複素環式基中に存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができ、

m が 0、1、2 又は 3 を示し、ここで m が 2 又は 3 を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰返し単位 $\text{---}(\text{CH}(\text{R}^{14}))\text{---}$ は同一もしくは異なる意味を有することができ、

G が酸素又は硫黄を示し、

R^{19} 及び R^{20} が互いに独立して水素、 $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキルを示すか、あるいは一緒になって $\text{C}_2\text{---C}_3$ -アルキレンを示し、

R^{21} が水素を示すか、場合により $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキルカルボニルオキシ及び $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはジ置換されていることができる $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキルを示すか；あるいは場合によりフッ素、塩素、臭素、シアノ、 $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキル、1~9 個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $\text{C}_1\text{---C}_4$ -ハロゲンアルキル、 $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキルカルボニル、 $\text{C}_1\text{---C}_8$ -アルコシカルボニル及び $\text{C}_3\text{---C}_5$ -アルキレンよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー~テトラ置換されていることができるアリールを示し、

R^{22} が水素、 $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキル又は $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルコキシ- $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキルを示し、

R^{23} が水素、アミノ、 $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルキル又は $\text{C}_1\text{---C}_4$ -アルコキシ- $\text{C}_1\text{---C}_4$

20

30

40

50

は場合により塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシにより置換されていることができ、

R^1 及び R^2 がさらに一緒になってプロピレン、ブチレン、プロペニレン又はブタジエニレン、 $-(CH_2)_2-O-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-NH-CH_2-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 、 $-CH=CCl-CH=CH-$ を示し、

Xがフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CClF_2$ 、 $-CHCl_2$ 、 $-CF_2CHFCl$ 、 $-CF_2CH_2F$ 、 $-CF_2CCl_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CF_2CHFCF_3$ 、 $-CH_2CF_2H$ 、 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2H$ 、 $-CF_2CHFCF_3$ 、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-SCHF_2$ 、 $-SO_2Me$ 、 $-SO_2CHF_2$ 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SOCHF_2$ 、 $-SOCF_3$ 、 $-CH=CH_2$ 、 $-C\equiv CH$ 、アミノ、 $-NHMe$ 、 NMe_2 、 $-CHO$ 、 $-COMe$ 、 $-CO_2Me$ 、 $-CO_2Et$ 、 $-NHCOMe$ 、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアジルを示すか；あるいはnが2を示す場合、2個の隣接する基Xがさらに一緒になってプロピレン、ブチレン、プロペニレン又はブタジエニレン、 $-(CH_2)_2-O-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-NH-CH_2-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ を示し、

Xがさらにメチルチオ、エチルチオ、*n*-プロピルチオ、イソプロピルチオを示し、

nが0、1又は2を示し、nが2を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示し、

Yが直接結合、酸素、 $-S(O)_p-$ 又は $-NR^9-$ を示し、

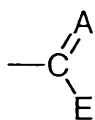
pが0、1又は2を示し、

Zが $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH_2)_4-$ 、 $-(CHR^{10})-$ 、 $-CH_2-C(O)-CH_2-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH=C(OH)-$ 、 $-CH=C(OMe)-$ 、 $-CH_2-C(OMe)=CH-$ を示し、

Zがさらに $-CH_2-C(OEt)=CH-$ を示し、

Rが基

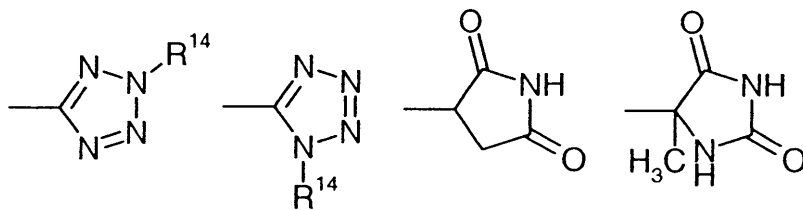
【化11】



を示すか、

あるいは特に

【化12】



よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター（酸模倣物）を示し、

Aが酸素又は硫黄を示し、

Eが $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 、 $-O^-M$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ を示し、

Mがテトラブチルアンモニウム、トリメチルベンジルアンモニウムを示すか、あるいはナ

10

20

30

40

50

トリウムカチオン (Na^+) 又はカリウムカチオン (K^+) を示し、
Mがさらにマグネシウムカチオン (Mg^{2+}) 又はカルシウムカチオン (Ca^{2+}) を示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成し、
 R^4 が水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-\text{COMe}$ を示し、
 R^5 が水素、アミノ、ホルミル、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、ビニル、プロパルギル、メトキシ、メトキシメチル、 $-\text{COMe}$ 、 $-\text{COEt}$ 、*tert*-ブトキシカルボニル、オキサモイルを示し、
 R^4 及び R^5 がさらに一緒になってエチリデン、イソプロピリデン、*sec*-ブチリデン、ニトロベンジリデンを示し、
 R^4 及び R^5 がさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にモルホリン、ピペリジン、チオモルホリン、ピロリジン、テトラヒドロピリジンよりなる群からの5-もしくは6-員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それらは場合によりメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチルによりモノ-もしくはジ置換されていることができ、
 R^8 がメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CClF}_2$ 、 $-\text{CHCl}_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ を示すか、あるいは $-\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$ を示し、
 R^9 が水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、シクロペンチル又はシクロヘキシルを示し、
 R^{10} がフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-\text{COMe}$ 、 $-\text{COEt}$ 、 $-\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{CO}_2\text{Et}$ 、シクロヘキシルを示すか；フェニル又はベンジルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ-〜テトラ置換されていることができ、
 R^{11} が水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチルを示し、
 R^{14} が水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル又は*tert*-ブチルを示し、
 R^{15} が水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル又はシアノを示し、
 R^{16} が水素を示すか；メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、シアミル、ヘキシル、*n*-デシル、*n*-ドデシル、*n*-テトラデシル、*n*-ヘキサデシル、ビニル、アリル、ブテニル、2-イソペンテニル、ヘキセニル、*n*-デセニル、エチニル、プロピニル、ブチニルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*tert*-ブトキシカルボニル、メチルカルボニルオキシ、ビニルカルボニルオキシ、 $-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-$ 、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサラニル、フェノキシ、フルオロフェノキシ、 $-\text{CONR}^4\text{R}^5$ 、 $-\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $-\text{ONR}^4\text{R}^5$ 及び $-\text{CH}=\text{N}-\text{OCH}_3$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ-〜トリ置換されていることができるか；あるいはフェニル、ベンジル、フェニルエチル、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、シクロヘキシルメチル、シクロブ

ロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、オキセタニル、オキサゾラニル、ジオキサニル、ジオキソラニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダゾリル、ピラジル、チアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアゾリル、テトラヒドロピラニル、チエタニル、チエタンジオキシド、オキセタニルメチル、オキサゾラニルメチル、ジオキサニルメチル、ジオキソラニルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、ピロリルメチル、オキサゾリルメチル、イソオキサジルメチル、イミダゾリルメチル、ピラジルメチル、チアゾリルメチル、ピリジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピリダジルメチル、トリアジニルメチル、トリアゾリルメチル、テトラヒドロピラニルメチル、チエタニルメチル、チエタンジオキシドメチル、オキセタニルエチル、オキサゾラニルエチル、ジオキサニルエチル、ジオキソラニルエチル、フリルエチル、チエニルエチル、ピロリルエチル、オキサゾリルエチル、イソオキサジルエチル、イミダゾリルエチル、ピラジルエチル、チアゾリルエチル、ピリジニルエチル、ピリミジニルエチル、ピリダジルエチル、トリアジニルエチル、トリアゾリルエチル、テトラヒドロピラニルエチル、チエタニルエチル、チエタンジオキシドエチルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CClF_2$ 、 $-CHCl_2$ 、 $-CF_2CHFCl$ 、 $-CF_2CH_2F$ 、 $-CF_2CCl_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CF_2CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2H$ 、 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2H$ 、 $-CF_2CH_2CF_3$ 、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、 $-CO_2Me$ 、 $-CO_2Et$ 、メチルカルボニルオキシ及びエチルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができるか；あるいは基Qの1つを示し、

R^{1-6} がさらにそれぞれ場合によりフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは異なる基で可能な最大数まで置換されていることができるメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、シアミル、ヘキシル、*n*-デシル、*n*-ドデシル、*n*-テトラデシル、*n*-ヘキサデシル、ビニル、アリル、ブテニル、2-イソペンテニル、ヘキセニル、*n*-デセニル、エチニル、プロピニル、ブチニルを示し、

R^{1-6} がさらにフェニル、ベンジル、フェニルエチル、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、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、オキセタニル、オキサゾラニル、ジオキサニル、ジオキソラニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダゾリル、ピラジル、チアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアゾリル、テトラヒドロピラニル、チエタニル、チエタンジオキシド、オキセタニルメチル、オキサゾラニルメチル、ジオキサニルメチル、ジオキソラニルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、ピロリルメチル、オキサゾリルメチル、イソオキサジルメチル、イミダゾリルメチル、ピラジルメチル、チアゾリルメチル、ピリジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピリダジルメチル、トリアジニルメチル、トリアゾリルメチル、テトラヒドロピラニルメチル、チエタニルメチル、チエタンジオキシドメチル、オキセタニルエチル、オキサゾラニルエチル、ジオキサニルエチル、ジオキソラニルエチル、フリルエチル、チエニルエチル、ピロリルエチル、オキサゾリルエチル、イソオキサジルエチル、イミダゾリルエチル、ピラジルエチル、チアゾリルエチル、ピリジニルエチル、ピリミジニルエチル、ピリダジルエチル、トリアジニルエチル、トリアゾリルエチル、テトラヒドロピラニルエチル、チエタニルエチル、チエタンジオキシドエチルを示し、それらのそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノー～テトラ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にまたヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができ、

10

20

30

40

50

$R^{1\ 7}$ が水素、メチル又はエチルを示し、

$R^{1\ 8}$ が水素、ヒドロキシル、アミノ、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、ビニル、アリルを示すか；あるいはシクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシル、フェニル、ペンジル、フェニルエチル、ピリジニル、ピリジニルメチル、ピリジニルエチル、フリル、フルフリルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、ヒドロキシル、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ及び $-O-CH_2-O-$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができるか；あるいは $-SO_2 Me$ 、 $-SO_2 Et$ 又は $-NR^4 R^5$ を示し、

10

$R^{1\ 8}$ がさらにメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、ビニル、アリルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、 $-OCH_2CF_3$ 、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル及び *tert*-ブトキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができるか；あるいはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、ビニル、アリルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは異なる置換基で可能な最大数まで置換されていることができ、

20

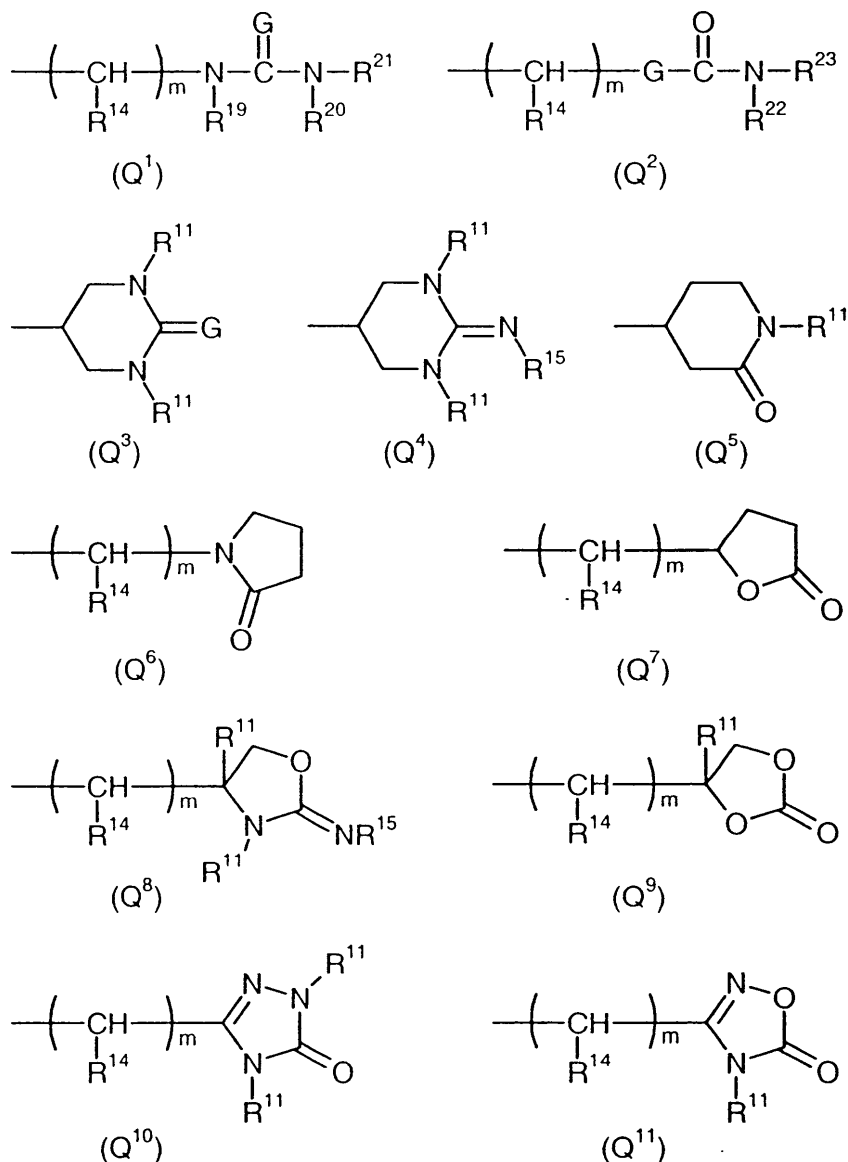
$R^{1\ 8}$ がさらにシクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシル、フェニル、ペンジル、フェニルエチル、ピリジニル、ピリジニルメチル、ピリジニルエチル、フリル、フルフリルを示し、それらのそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にまたニトロ、メトキシカルボニル及びエトキシカルボニルよりなる群から選ばれることができ、

$R^{1\ 7}$ 及び $R^{1\ 8}$ がさらにそれらが結合している窒素原子と一緒になってピペラジン、モルホリン、ピペリジン、ピロリジンよりなる群からの 5-もしくは 6-員の飽和複素環を示し、それらは場合によりメチル、エチル、*n*-プロピル及びイソプロピルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができ、

30

Q が下記の基の 1 つを示し、

【化 1 3】



10

20

30

ここで基 R^{1 1} は、それらの 2 個もしくはそれより多くが同じ複素環式基中に存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができ、

m が 0、1、2 又は 3 を示し、ここで m が 2 又は 3 を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰り返し単位 $\text{---}(\text{CH}(\text{R}^{1 4}))\text{---}$ は同一もしくは異なる意味を有することができ、

G が酸素又は硫黄を示し、

R^{1 9} 及び R^{2 0} が互いに独立して水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチルを示すか、あるいは一緒になって $\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$ 又は $\text{---}(\text{CH}_2)_3\text{---}$ を示し、

R^{2 1} が水素を示すか、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチルを示し、それらのそれぞれは場合により tert-ブチルカルボニルオキシ又はメトキシでモノ置換されていることができるか；あるいはフェニルを示し、それは場合により塩素、シアノ、メチル、エチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、sec-ブチルオキシカルボニル、tert-ブチルオキシカルボニル、n-オクチルオキシカルボニル及び $\text{---}(\text{CH}_2)_4\text{---}$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはジ置換されていることができ、

R^{2 2} が水素、メチル、エチル又はメトキシメチルを示し、

R^{2 3} が水素、アミノ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル又はメトキシメチ

40

50

ルを示す

請求項 1 に従う式 (I) のピリジルピリミジン類。

【請求項 8】

X がフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CClF_2$ 、 $-CHCl_2$ 、 $-CF_2CHFCl$ 、 $-CF_2CH_2F$ 、 $-CF_2CCl_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CF_2CHFCF_3$ 、 $-CH_2CF_2H$ 、 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2H$ 、 $-CF_2CHFCF_3$ 、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-SCHF_2$ 、 $-SO_2Me$ 、 $-SO_2CHF_2$ 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SOCHF_2$ 、 $-SOCF_3$ 、 $-CH=CH_2$ 、 $-C\equiv CH$ 、アミノ、 $-NHMe$ 、 NMe_2 、 $-CHO$ 、 $-COMe$ 、 $-CO_2Me$ 、 $-CO_2Et$ 、 $-NHCOMe$ 、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアジルを示すか；あるいは *n* が 2 を示す場合、2 個の隣接する基 X がさらに一緒になってプロピレン、ブチレン、プロペニレン又はブタジエニレン、 $-(CH_2)_2-O-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-NH-CH_2-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ を示し、

10

Z が $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH_2)_4-$ 、 $-(CHR^{10})-$ 、 $-CH_2-C(O)-CH_2-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH=C(OH)-$ 、 $-CH=C(OMe)-$ 、 $-CH_2-C(OMe)=CH-$ を示し、

20

R^{16} が水素を示すか；メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、シアミル、ヘキシル、*n*-デシル、*n*-ドデシル、*n*-テトラデシル、*n*-ヘキサデシル、ビニル、アリル、ブテニル、2-イソペンテニル、ヘキセニル、*n*-デセニル、エチニル、プロピニル、ブチニルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、 $-OCH_2CF_3$ 、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*tert*-ブトキシカルボニル、メチルカルボニルオキシ、ビニルカルボニルオキシ、 $-O-(CH_2)_2-O-$ 、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサソラニル、フェノキシ、フルオロフェノキシ、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-ONR^4R^5$ 及び $-CH=N-OCH_3$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ〜トリ置換されていることができるか；あるいはフェニル、ベンジル、フェニルエチル、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、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、オキセタニル、オキサゾラニル、ジオキサニル、ジオキサソラニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダゾリル、ピラジル、チアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアゾリル、テトラヒドロピラニル、チエタニル、チエタンジオキシド、オキセタニルメチル、オキサゾラニルメチル、ジオキサニルメチル、ジオキサソラニルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、ピロリルメチル、オキサゾリルメチル、イソオキサジルメチル、イミダゾリルメチル、ピラジルメチル、チアゾリルメチル、ピリジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピリダジルメチル、トリアジニルメチル、トリアゾリルメチル、テトラヒドロピラニルメチル、チエタニルメチル、チエタンジオキシドメチル、オキセタニルエチル、オキサゾラニルエチル、ジオキサニルエチル、ジオキサソラニルエチル、フリルエチル、チエニルエチル、ピロリルエチル、オキサゾリルエチル、イソオキサジルエチル、イミダゾリルエチル、ピラジルエチル、チアゾリルエチル、ピリジニルエチル、ピリミジニルエチル、ピリダジルエチル、トリアジニル

30

40

50

エチル、トリアゾリルエチル、テトラヒドロピラニルエチル、チエタニルエチル、チエタンジオキシドエチルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CClF}_2$ 、 $-\text{CHCl}_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、 $-\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{CO}_2\text{Et}$ 、メチルカルボニルオキシ及びエチルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー〜トリ置換されていることができるか；あるいは基Qの1つを示し、

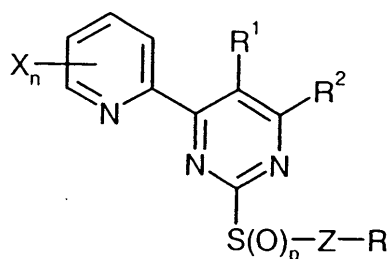
R^{1-8} が水素、ヒドロキシル、アミノ、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、ビニル、アリルを示すか；あるいはシクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、ピリジニル、ピリジニルメチル、ピリジニルエチル、フリル、フルフリルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、ヒドロキシル、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ及び $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー〜トリ置換されていることができるか；あるいは

請求項7に従う式(I)のピリジルピリミジン類。

【請求項9】

式(I-p)

【化14】



(I-p)

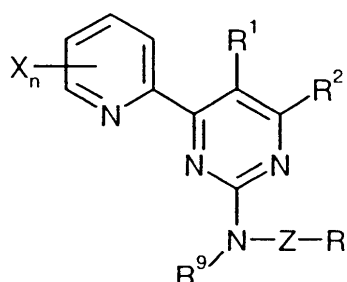
30

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、p、Z及びRは請求項1で示した意味を有する]
のピリジルピリミジン類。

【請求項10】

式(I-q)

【化15】



(I-q)

40

[式中、

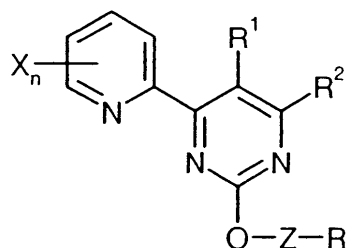
50

R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 、 R 及び R^9 は請求項 1 で示した意味を有する] のピリジルピリミジン類。

【請求項 11】

式 (I-r)

【化 16】



(I-r)

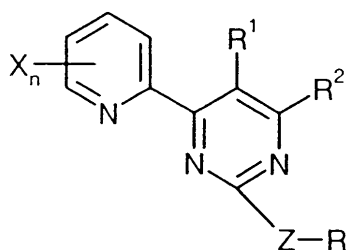
10

[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び R は請求項 1 で示した意味を有する] のピリジルピリミジン類。

【請求項 12】

式 (I-s)

【化 17】



(I-s)

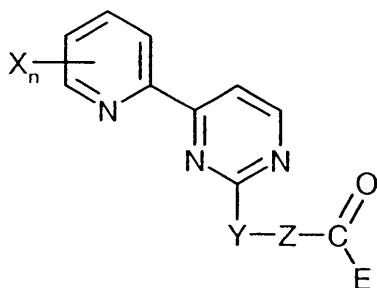
20

[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び R は請求項 1 で示した意味を有する] のピリジルピリミジン類。

【請求項 13】

式 (I-t)

【化 18】



(I-t)

40

[式中、
 X はメチル、エチル、塩素、臭素、 $-CF_3$ 、メトキシ又はトリフルオロメトキシを示し、
 n は 0、1 又は 2 を示し、 n が 2 を示す場合、 X は同一もしくは異なる基を示し、
 Y は $-S-$ 又は $-NR^9-$ を示し、
 Z は $-CH_2-$ 又は $-(CH_2)_2-$ を示し、
 E はヒドロキシル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、イソプロポキシ、 n -ブトキシ、イソブトキシ、 sec -ブトキシ、 $tert$ -ブトキシ、 $-NH-SO_2Me$ 又は-

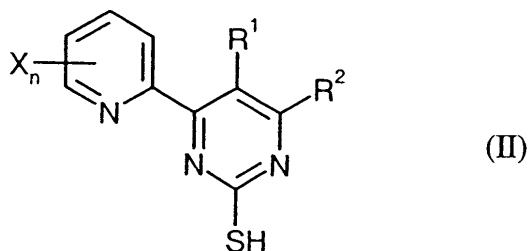
50

NH-SO₂-Etを示し、
R⁹は水素、メチル又はエチルを示す]
のピリジルピリミジン類。

【請求項14】

A) 式(I I)

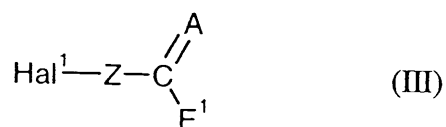
【化19】



10

[式中、
R¹、R²、X及びnは請求項1で示した意味を有する]
のチオールを式(I I I)

【化20】

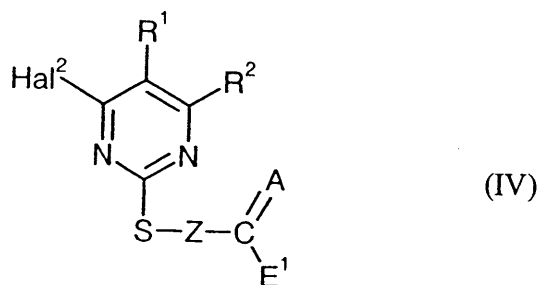


20

[式中、
Z及びAは請求項1で示した意味を有し、
E¹は-O R^{1 6}、-S R^{1 6}又は-N R^{1 7} R^{1 8}を示し、
H a l¹はハロゲンを示す]
のハロゲン化合物と、適宜希釈剤の存在下及び適宜酸結合剤の存在下で反応させるか、
あるいは

B) 式(I V)

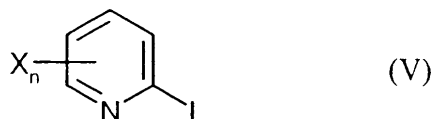
【化21】



40

[式中、
R¹、R²、Z及びAは請求項1で示した意味を有し、
E¹は上記で示した意味を有し、
H a l²はハロゲンを示す]
のハロゲノピリミジンを式(V)

【化 2 2】



〔式中、

X 及び n は請求項 1 で示した意味を有し、

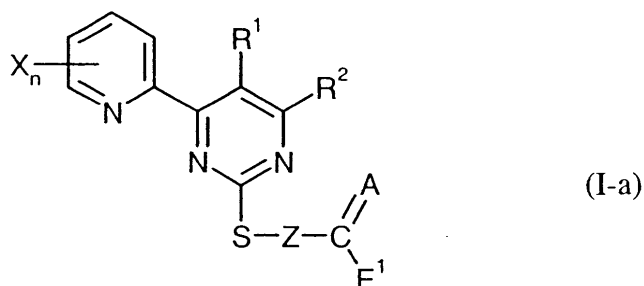
L は Sn (アルキル)₃、 Sn (アリール)₃、 ZnBr 又は ZnCl を示す]

のピリジン化合物と、適宜希釈剤の存在下及び適宜触媒の存在下で反応させる

ことにより式 (I-a)

10

【化 2 3】



20

〔式中、

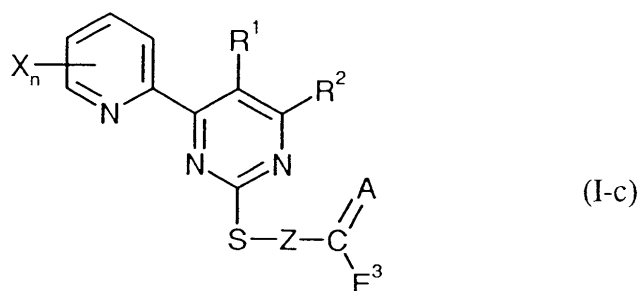
 R^1 、 R^2 、X、n、Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、 E^1 は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

C) 式 (I-c)

【化 2 4】



30

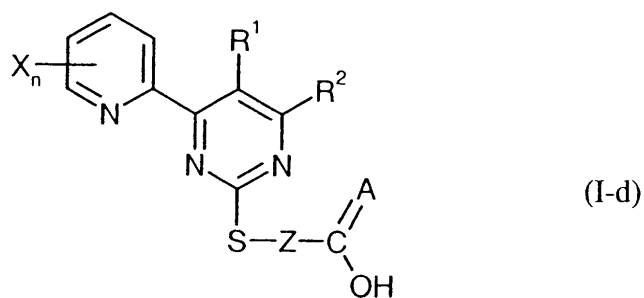
〔式中、

 R^1 、 R^2 、X、n、Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、 E^3 は $-\text{OR}^{16}$ を示し、ここで R^{16} は請求項 1 で示した意味を有する]

40

のピリジルピリミジンを、第 1 段階で適宜希釈剤の存在下で塩基を用いて処理し、得られる式 (I-d)

【化 2 5】



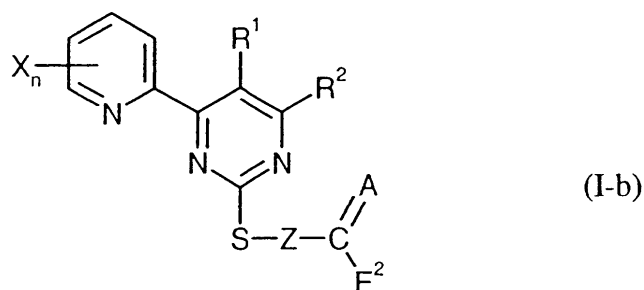
10

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは請求項1で示した意味を有する]
 の化合物を第2段階で式(VI)
 $\text{HN}R^{17}R^{18}$ (VI)

[式中、
 R^{17} 及び R^{18} は請求項1で示した意味を有する]
 のアミンと、適宜希釈剤の存在下及び適宜吸水性試薬の存在下で反応させる
 ことにより、
 式(I-b)

20

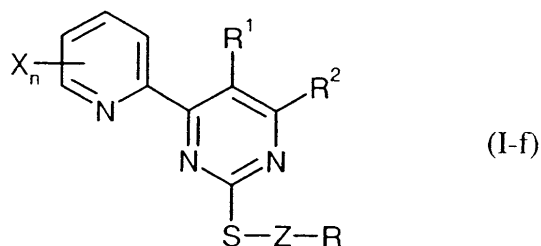
【化 2 6】



30

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは請求項1で示した意味を有し、
 E^2 は $-\text{NR}^{17}R^{18}$ を示す]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 D) 式(I-f)

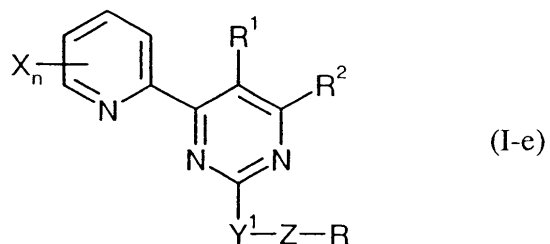
【化 2 7】



40

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びRは請求項1で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを、適宜希釈剤の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜触媒の存
 在下で酸化剤を用いて酸化する
 ことにより、式(I-e)

【化 2 8】



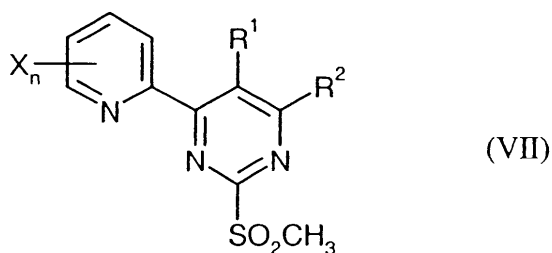
10

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z 及び R は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^1 は $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示す]

のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは

E) 式 (V I I)

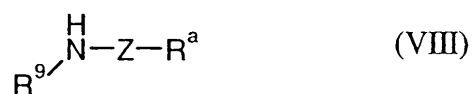
【化 2 9】



20

[式中、
 R^1 、 R^2 、X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
 のメチルスルホニルピリミジンを式 (V I I I)

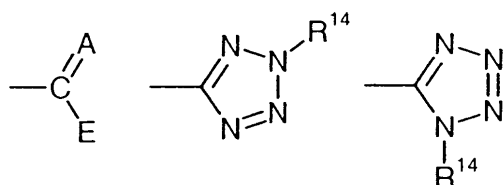
【化 3 0】



30

[式中、
 Z 及び R^9 は請求項 1 で示した意味を有し、
 R^a は下記の基

【化 3 1】



40

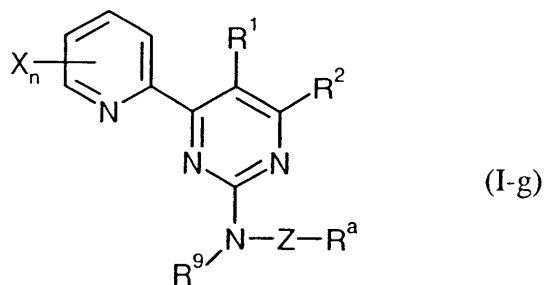
の 1 つを示し、

ここで

R^{14} は請求項 1 で示した意味を有する]

のアミンと、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させる
 ことにより、式 (I - g)

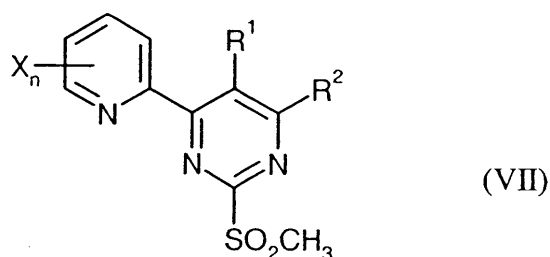
【化 3 2】



10

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z 及び R^9 は請求項 1 で示した意味を有し、
 R^a は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 F) 式 (V I I)

【化 3 3】



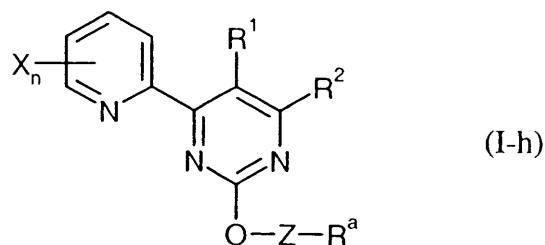
20

[式中、
 R^1 、 R^2 、X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
 のメチルスルホニルピリミジンを式 (I X)
 $HO-Z-R^a$ (I X)

30

[式中、
 Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 R^a は上記で示した意味を有する]
 のヒドロシル化合物と、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させる
 ことにより、式 (I - h)

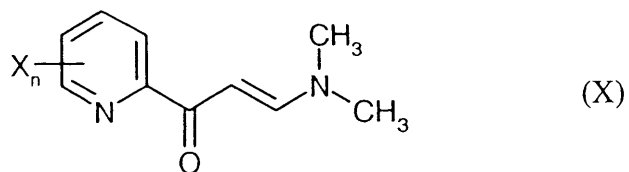
【化 3 4】



40

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 R^a は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 G) 式 (X)

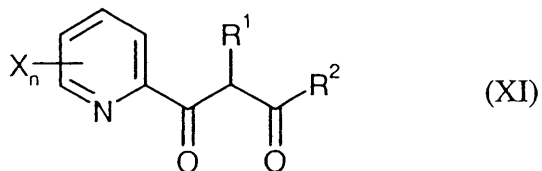
【化 3 5】



[式中、
X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
のピリジン誘導体又は式 (X I)

10

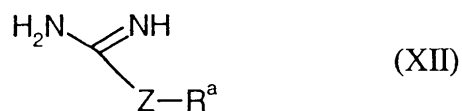
【化 3 6】



[式中、
R¹、R²、X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
のピリジン誘導体を式 (X I I)

20

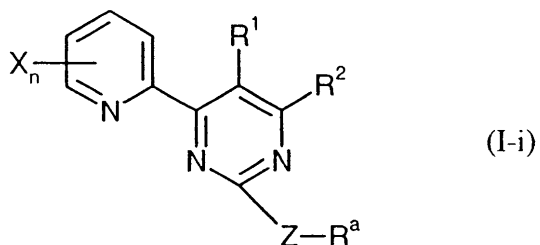
【化 3 7】



[式中、
Z は請求項 1 で示した意味を有し、
R^a は上記で示した意味を有する]
のアミジンと、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させる
ことにより、式 (I - i)

30

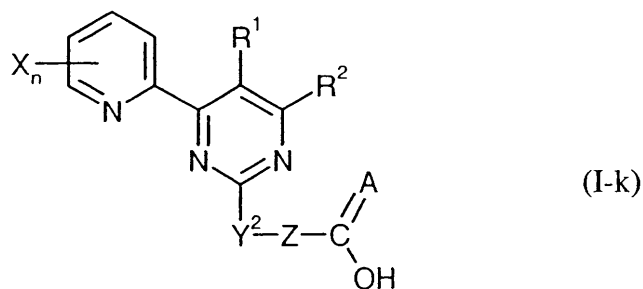
【化 3 8】



40

[式中、
R¹、R²、X、n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
R^a は上記で示した意味を有する]
のピリジルピリミジンを得るか、
あるいは
H) 式 (I - k)

【化 3 9】



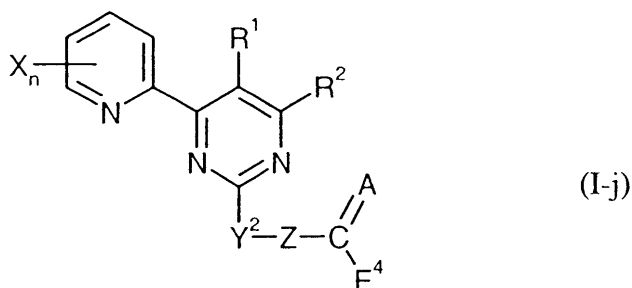
10

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは請求項1で示した意味を有し、
 Y^2 は直接結合、酸素、硫黄又は $-NR^9-$ を示す]
 のピリジルピリミジンを含む式 (X I I I)
 MOH^- (X I I I)

[式中、
 Mは請求項1で示した意味を有する]
 のヒドロキシドと、適宜希釈剤の存在下で反応させる
 ことにより、式 (I-j)

20

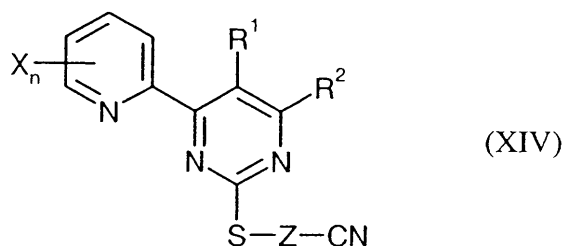
【化 4 0】



30

[式中、
 Y^2 は上記で示した意味を有し、
 E^4 は $-O-M$ 又は $-S-M$ を示し、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z、A及びMは請求項1で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 J) 式 (X I V)

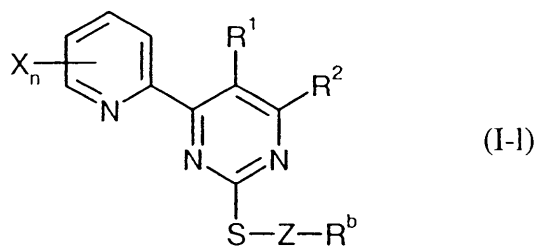
【化 4 1】



40

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n及びZは請求項1で示した意味を有する]
 のニトリルを適宜希釈剤の存在下でトリアルキル錫アジドと反応させる
 ことにより、式 (I-1)

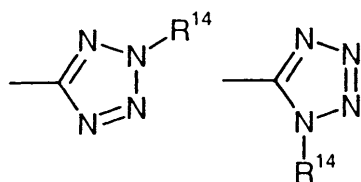
【化 4 2】



[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Y 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 R^b は下記の基

10

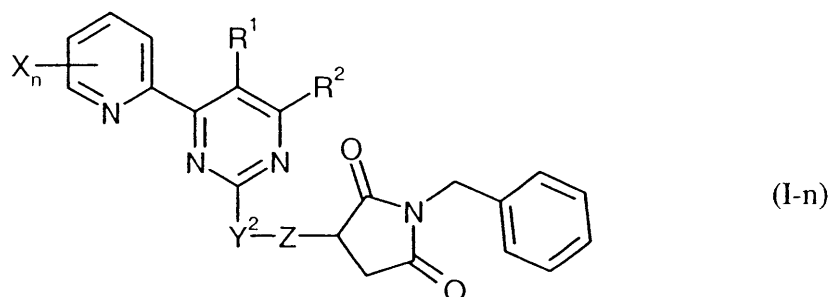
【化 4 3】



の 1 つを示し、
 ここで R^{1-4} は請求項 1 で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 K) 式 (I-n)

20

【化 4 4】

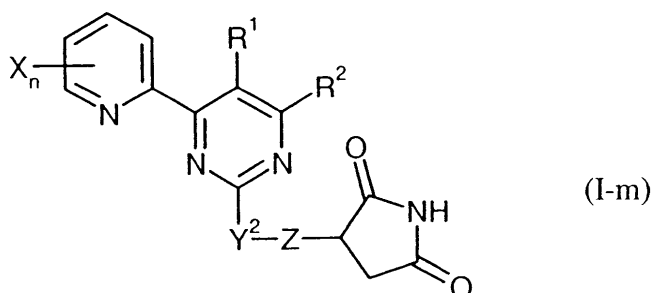


30

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^2 は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを適宜希釈剤の存在下及び適宜触媒の存在下で水素化する
 ことにより、式 (I-m)

40

【化 4 5】



[式中、

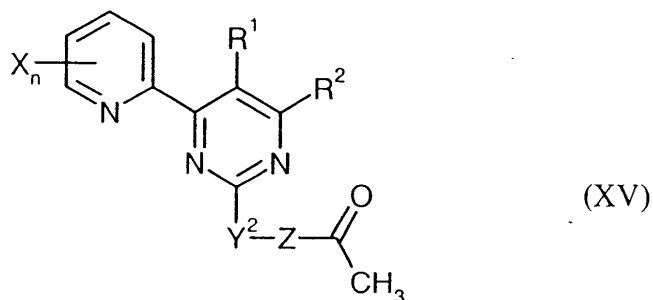
50

R^1 、 R^2 、X、n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^2 は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは

L) 式 (XV)

【化 4 6】



10

[式中、

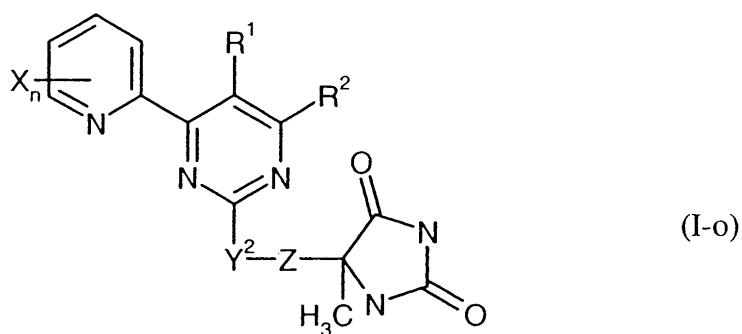
R^1 、 R^2 、X、n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^2 は上記で示した意味を有する]

のケト化合物を適宜希釈剤の存在下で炭酸アンモニウム及びシアン化カリウムと反応させる

20

ことにより、式 (I-o)

【化 4 7】



30

[式中、

R^1 、 R^2 、X、n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^2 は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを得る

ことを特徴とする請求項 1 に従う式 (I) の化合物の製造法。

【請求項 1 5】

伸展剤及び／又は界面活性剤に加えて請求項 1 に従う式 (I) の化合物の少なくとも 1 種を含むことを特徴とする有害生物防除剤。

40

【請求項 1 6】

有害生物の抑制のための請求項 1 に従う式 (I) の化合物の使用。

【請求項 1 7】

請求項 1 に従う式 (I) の化合物を有害生物及び／又はそれらの生息地に作用させることを特徴とする有害生物の抑制法。

【請求項 1 8】

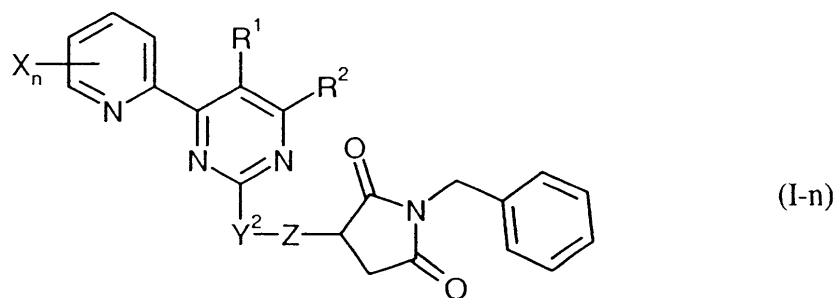
請求項 1 に従う式 (I) の化合物を伸展剤及び／又は界面活性剤と混合することを特徴とする有害生物防除剤の調製法。

【請求項 1 9】

式 (I-n)

50

【化 4 8】



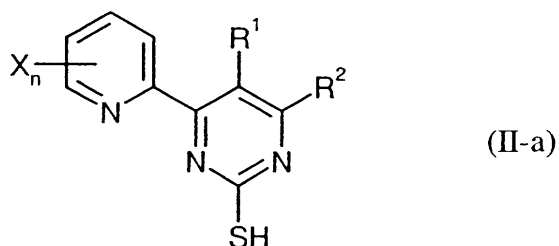
10

[式中、
 Y^2 は直接結合、酸素、硫黄又は $-NR^9$ を示し、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び R^9 は請求項 1 で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジン類。

【請求項 20】

式 (I I - a)

【化 4 9】



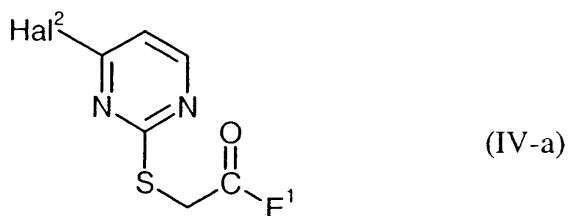
20

[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 及び n は請求項 1 で示した意味を有し、但し基 R^1 、 R^2 及び X の少なくとも 1 つは水素を示さない]
 のチオール類。

【請求項 21】

式 (I V - a)

【化 5 0】



30

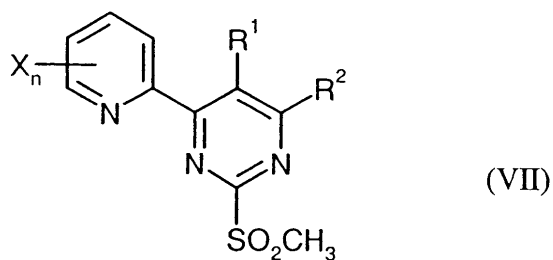
[式中、
 a) E^1 はメトキシ又はエトキシを示し、
 Hal^2 は臭素を示すか
 あるいは
 b) E^1 はメトキシを示し、
 Hal^2 は塩素を示す]
 のハロゲノピリミジン類。

40

【請求項 22】

式 (V I I)

【化 5 1】



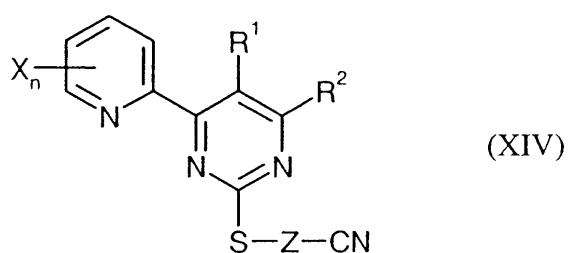
10

[式中、
 R^1 、 R^2 、X及びnは請求項1で示した意味を有する]
 のメチルスルホニルピリミジン類。

【請求項 2 3】

式 (X I V)

【化 5 2】



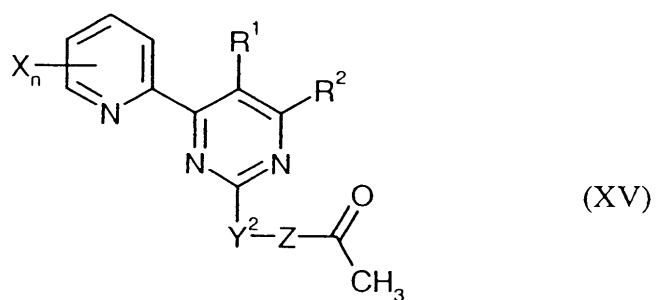
20

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n及びZは請求項1で示した意味を有する]
 のニトリル類。

【請求項 2 4】

式 (X V)

【化 5 3】



30

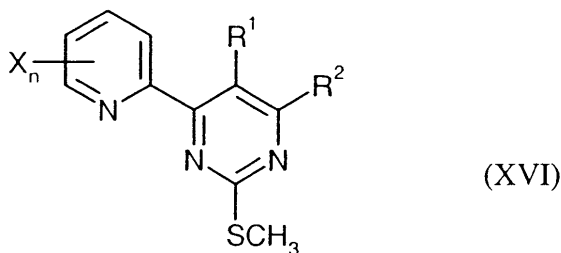
[式中、
 Y^2 は直接結合、酸素、硫黄又は $-NR^9-$ を示し、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及び R^9 は請求項1で示した意味を有する]
 のケト化合物。

40

【請求項 2 5】

式 (X V I)

【化 5 4】



10

[式中、
 R^1 、 R^2 、X及びnは請求項1で示した意味を有する]
 のメチルチオ誘導体。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は新規なピリジルピリミジン類、それらの製造のための複数の方法及び有害生物防除剤としてのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

ある種のピリジルピリミジン誘導体が製薬学的作用を有することは既知である（特許文献1参照）。この型の他の化合物が殺菌・殺カビ的に活性な化合物のための中間体として記載されている（特許文献2参照）。さらに別の誘導体は錯体リガンドとして既知であるか（非特許文献1、非特許文献2参照）、あるいは多環式複素環の合成のために用いられている（非特許文献3参照）。これまで殺虫的に活性なピリジルピリミジン類は開示されていない。

20

【特許文献1】

特開昭52-71481号公報

【特許文献2】

欧州特許第0471261 B1号明細書

【非特許文献1】

J. Chem. Soc., Dalton Trans., 1999, 3095-3101

30

【非特許文献2】

Tetrahedron Lett., 1999, 40, 4779-4782

【非特許文献3】

Eur. J. Org. Chem., 1998, 2907-2912

【発明の開示】

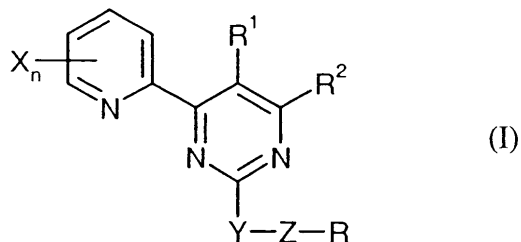
【0003】

今回、本発明は式(I)

【0004】

【化1】

40



【0005】

[式中、

50

R^1 及び R^2 は互いに独立して水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、シクロアルキルを示すか；あるいは場合により置換されていることができるアリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示し、

R^1 及び R^2 はさらに一緒になってアルキレン又はアルケニレンを示し、ここで炭素鎖は窒素及び酸素よりなる群からの 1～3 個のヘテロ原子により中断されていることができ且つ生ずる環はそれ自身が場合によりハロゲン又はアルキルで置換されていることができ、
X はハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの 1～4 個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示すか；

あるいは n が 2、3 又は 4 を示す場合、2 個の隣接する基 X はさらに一緒になってアルキレン又はアルケニレンを示し、ここで炭素鎖は窒素及び酸素よりなる群からの 1 もしくは 2 個のヘテロ原子で中断されていることができ、

n は 0、1、2、3 又は 4 を示し、n が 2、3 又は 4 を示す場合、X は同一もしくは異なる基を示し、

Y は直接結合、酸素、 $-S(O)_p -$ 又は $-NR^9 -$ を示し、

p は 0、1 又は 2 を示し、

Z は $-(CH_2)_r -$ 、 $-(CH_2)_t - (CHR^{10}) - (CH_2)_w -$ 、 $-(CH_2)_r - C(O) - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - O - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - S(O)_p - (CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - N(R^{11}) - (CH_2)_t -$ 又は $-(CH_2)_t - C(R^{12}) = C(R^{13}) - (CH_2)_w -$ を示し、

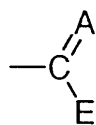
r は 1、2、3、4、5 又は 6 を示し、

t 及び w は互いに独立して 0、1、2、3 又は 4 を示し、

R は基

【0006】

【化2】



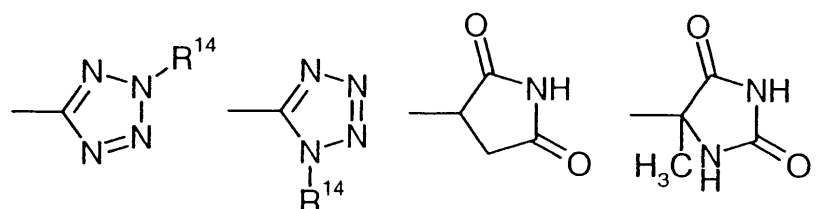
【0007】

を示すか、

あるいは特に

【0008】

【化3】



【0009】

よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター (bioisostere) (酸模倣物 (acidmimetic)) を示し、

Aは酸素、硫黄又は NR^{15} を示し、

Eは $-\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{SR}^{16}$ 、 $-\text{O}^-\text{M}$ 、 $-\text{S}^-\text{M}$ 又は $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ を示し、

Mは場合によりアルキル、アリール又はアリールアルキルで置換されていることができるアンモニウムを示すか、あるいはアルカリ金属イオンを示し、

Mはさらにアルカリ土類金属イオンを示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成し、

R^3 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン-、アルキル-、ハロゲノアルキル-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-置換されていることができるアリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示し、

R^4 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル又はアルキルカルボニルを示し、

R^5 は水素、アミノ、ホルミル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、オキサモイルを示し、

R^4 及び R^5 はさらに一緒になってアルキリデンを示すか；あるいは場合によりハロゲン-、ニトロ-、アルキル-、ハロゲノアルキル-置換されていることができるベンジリデンを示し；

R^4 及び R^5 はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは場合によりさらなる窒素、酸素もしくは硫黄原子を含有していることができ且つそれは場合によりアルキルで置換されていることができ、

R^6 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル又はアリールアルキルを示し、

R^7 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール又はアリールアルキルを示し、

R^8 はアルキル又はハロゲノアルキルを示し、

R^9 は水素、アルキル、ハロゲノアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン-、アルキル-、ハロゲノアルキル-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-置換されていることができるアリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示し、

R^{10} はハロゲン、アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルを示すか；あるいはアリール又はアリールアルキルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてハロゲン又はアルキルで置換されていることができ、

R^{11} は水素又はアルキルを示し、

R^{12} 及び R^{13} は互いに独立して水素、ヒドロキシル、アルキル又はアルコキシを示し、

R^{14} は水素、アルキル又はハロゲノアルキルを示し、

R^{15} は水素、アルキル、アルコキシ、シアノ又はジアルキルアミノを示し、

R^{16} は水素を示すか；それぞれ場合によりハロゲン-、アミノ-、ヒドロキシル-、シアノ-、ニトロ-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-、アルコキシカルボニル-、アルケニルオキシカルボニル-、アルキルカルボニルオキシ-、アルケニルカルボニルオキシ-、オキシアルキレンオキシ-、オキセタン-、ジオキサニル-、オキサゾリジニル-、ジオキサニル-、アリールオキシ-

10

20

30

40

50

ハロゲノアリールオキシ-、 $-\text{CONR}^4\text{R}^5-$ 、 $-\text{NR}^4\text{R}^5-$ 、 $-\text{ONR}^4\text{R}^5-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{1\ 4})=\text{N}-\text{OR}^{1\ 4}-$ 置換されていることができるアルキル、アルケニル、アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン-、アルキル-、ハロゲノアルキル-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-、アルコキシカルボニル-、アルキルカルボニルオキシ-置換されていることができるアリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示すか；あるいは $-\text{NR}^4\text{R}^5$ を示すか、あるいは基Qの1つを示し、

$\text{R}^{1\ 6}$ はさらにそれぞれ場合により置換されていることができるアリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリルアルキルを示し、ここで置換基は上記で挙げたものの他にヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができ、

$\text{R}^{1\ 7}$ は水素又はアルキルを示し、

$\text{R}^{1\ 8}$ は水素、ヒドロキシル、アミノ、アルキル、アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン-、ヒドロキシル-、アルキル-、ハロゲノアルキル-、アルコキシ-、ハロゲノアルコキシ-、アルキルチオ-、ハロゲノアルキルチオ-、オキシアルキレンオキシ-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、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有するヘテロアリール又はヘテロアリールアルキルを示すか；あるいは $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^3$ 、 $-\text{OR}^{1\ 4}$ 又は $-\text{NR}^4\text{R}^5$ を示し、

$\text{R}^{1\ 8}$ はさらにそれぞれハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルコキシカルボニル及びアルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基で置換されているアルキル又はアルケニルを示し、

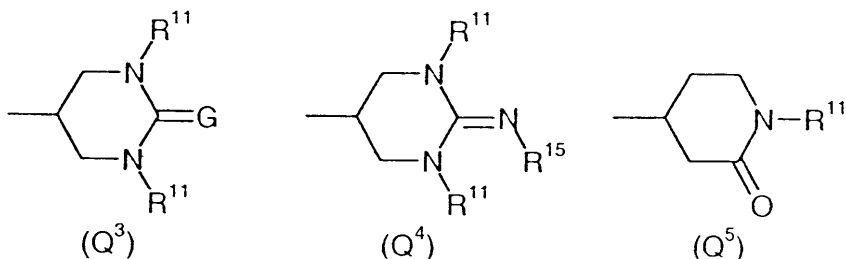
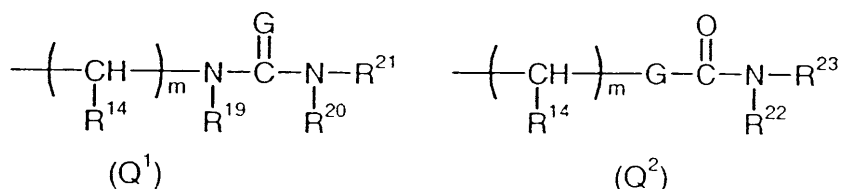
$\text{R}^{1\ 8}$ はさらにそれぞれ場合により置換されていることができるシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を有するヘテロアリール又はヘテロアリールアルキルを示し、ここで置換基は上記で挙げたものの他にニトロ及びアルコキシカルボニルよりなる群から選ばれることができ、

$\text{R}^{1\ 7}$ 及び $\text{R}^{1\ 8}$ はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5-もしくは6-員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは窒素、酸素及び硫黄よりなる群からの1～2個のさらなるヘテロ原子を含有していることができ且つそれは場合によりアルキルで置換されていることができ、

Qは下記の基の1つを示し、

【0010】

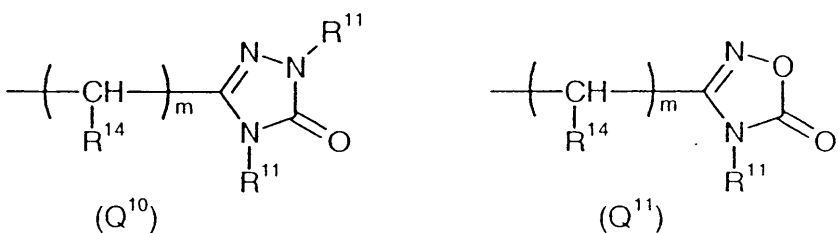
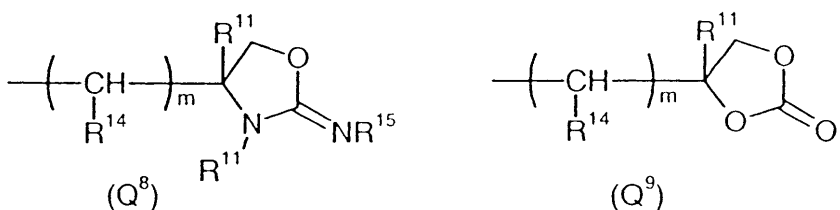
【化4】



10



20



30

【0011】

ここで基 R^{11} は、同じ複素環式基中に2個もしくはそれより多くが存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができ、

m は0、1、2又は3を示し、ここで m が2又は3を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰り返し単位 $\text{---}(\text{CHR}^{14})\text{---}$ は同一もしくは異なる意味を有することができ、

40

Gは酸素又は硫黄を示し、

R^{19} 及び R^{20} は互いに独立して水素、アルキルを示すか、あるいは一緒になってアルキレンを示し、

R^{21} は水素を示すか、場合によりアルキルカルボニルオキシもしくはアルコキシ置換されていることができるアルキルを示すか；あるいは場合によりハロゲン、シアノ、アルキル、ハロゲンアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキレン置換されていることができるアリールを示し、

R^{22} は水素、アルキル又はアルコシアルキルを示し、

R^{23} は水素、アミノ、アルキル又はアルコシアルキルを示す]

の新規な置換ピリジルピリミジン類を提供する。

50

【0012】

置換基の型及び数に依存して、式（I）の化合物は適宜幾何及び／又は光学異性体又は位置異性体あるいは種々の組成におけるそれらの異性体混合物として存在することができる。本発明により特許請求されているものは、純粋な異性体及び異性体混合物の両方である。さらに式（I）の化合物は、置換基の型及び数に依存して適宜種々の互変異性体として存在することができる。本発明により特許請求されているものは、すべての互変異性体である。

【0013】

本発明は、式（I）の化合物が形成することができるすべてのピリジン及び／又はピリミジンN-オキシドも特許請求する。さらに本発明は、例えば塩酸のような無機酸との式（I）の化合物のすべての塩を特許請求する。 10

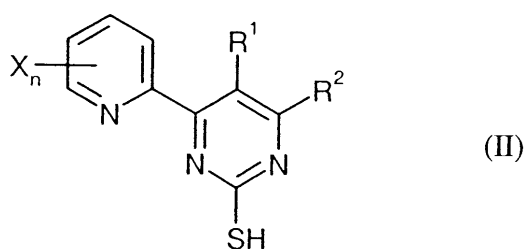
【0014】

さらに、

A) 式（II）

【0015】

【化5】



20

【0016】

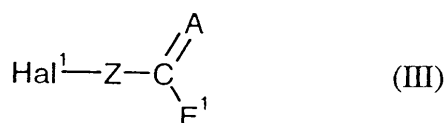
[式中、

R^1 、 R^2 、X及びnは上記で示した意味を有する]

のチオールを式（III）

【0017】

【化6】



30

【0018】

[式中、

Z及びAは上記で示した意味を有し、

E^1 は $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ を示し、

Hal¹はハロゲンを示す]

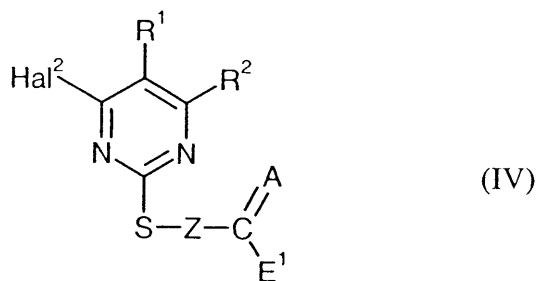
のハロゲン化合物と、適宜希釈剤の存在下及び適宜酸結合剤の存在下で反応させるか、あるいは

40

B) 式（IV）

【0019】

【化7】



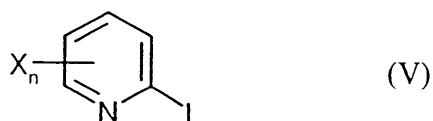
【0020】

10

[式中、
 R^1 、 R^2 、Z、A及び E^1 は上記で示した意味を有し、
 Hal^2 はハロゲンを示す]
 のハロゲンピリミジンに式(V)

【0021】

【化8】



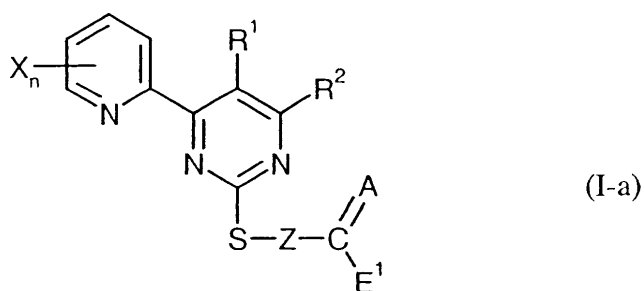
20

【0022】

[式中、
 X及びnは上記で示した意味を有し、
 Lは Sn (アルキル)₃、 Sn (アリール)₃、 $ZnBr$ 又は $ZnCl$ を示す]
 のピリジン化合物と、適宜希釈剤の存在下及び触媒の存在下で反応させる
 ことにより式(I-a)

【0023】

【化9】



30

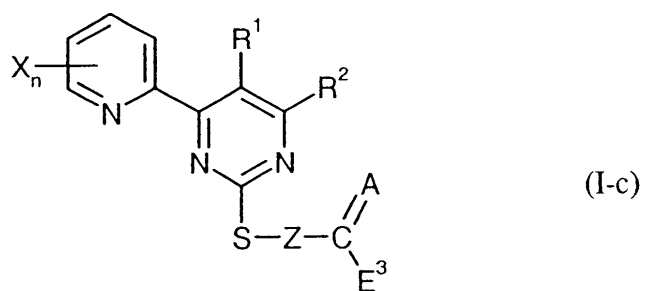
【0024】

40

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは上記で示した意味を有し、
 E^1 は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジン類が得られ、
 あるいは
 C) 式(I-c)

【0025】

【化10】



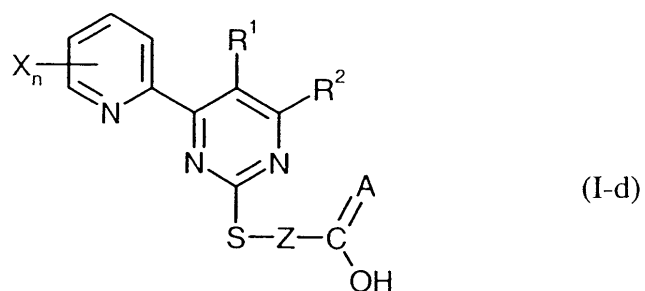
【0026】

10

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは上記で示した意味を有し、
 E^3 は $-OR^{16}$ を示し、ここで R^{16} は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを経第1段階で適宜希釈剤の存在下で塩基を用いて処理し、得られる
 式(I-d)

【0027】

【化11】



20

【0028】

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは上記で示した意味を有する]
 の化合物を経第2段階で式(VI)

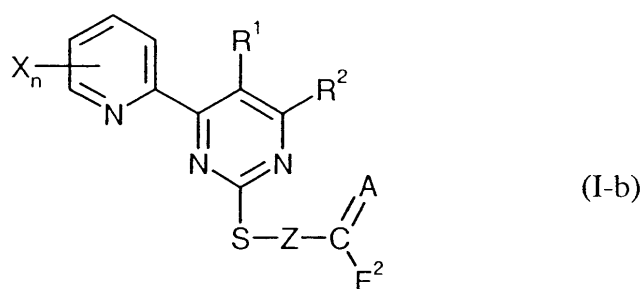
30

$HNR^{17}R^{18}$ (VI)

[式中、
 R^{17} 及び R^{18} は上記で示した意味を有する]
 のアミンと、適宜希釈剤の存在下及び吸水性試薬の存在下で反応させる
 ことにより、
 式(I-b)

【0029】

【化12】



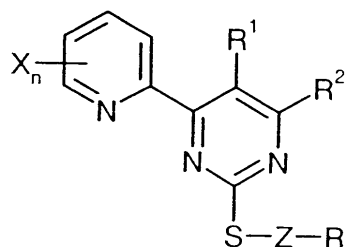
40

【0030】

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは上記で示した意味を有し、

50

E² は $-NR^{17}R^{18}$ を示す]
 のピリジルピリミジン類が得られ、
 あるいは
 D) 式 (I-f)
 【0031】
 【化13】



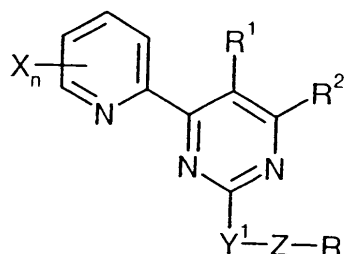
(I-f)

10

【0032】
 [式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びRは上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを、適宜希釈剤の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜触媒の存在下で酸化剤を用いて酸化することにより、式 (I-e)

20

【0033】
 【化14】

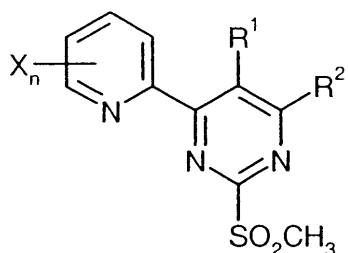


(I-e)

30

【0034】
 [式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びRは上記で示した意味を有し、
 Y^1 は $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示す]
 のピリジルピリミジン類が得られ、
 あるいは
 E) 式 (V I I)
 【0035】
 【化15】

40



(V I I)

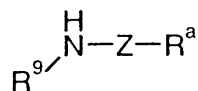
【0036】
 [式中、
 R^1 、 R^2 、X及びnは上記で示した意味を有する]

50

のメチルスルホニルピリミジンに式 (I I I)

【 0 0 3 7 】

【 化 1 6 】



(V I I I)

【 0 0 3 8 】

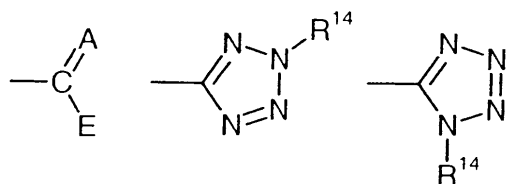
[式中、

Z 及び R^9 は上記で示した意味を有し、

R^a は下記の基

【 0 0 3 9 】

【 化 1 7 】



【 0 0 4 0 】

の 1 つを示し、

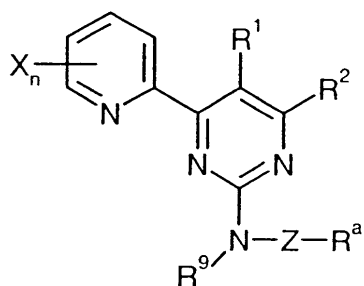
ここで

R^{14} は上記で示した意味を有する]

のアミンと、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させる
ことにより、式 (I - g)

【 0 0 4 1 】

【 化 1 8 】



(I - g)

【 0 0 4 2 】

[式中、

R^1 、 R^2 、X、n、Z 及び R^9 は上記で示した意味を有し、

R^a は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジン類が得られ、

あるいは

F) 式 (V I I)

【 0 0 4 3 】

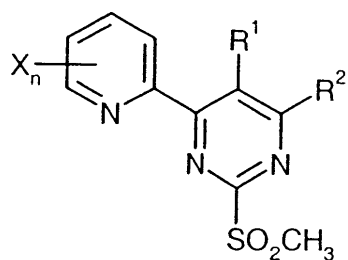
【 化 1 9 】

10

20

30

40



(V I I)

【 0 0 4 4 】

〔式中、

10

R¹、R²、X及びnは上記で示した意味を有する〕

のメチルスルホニルピリミジンを式 (I X)

HO-Z-R^a (I X)

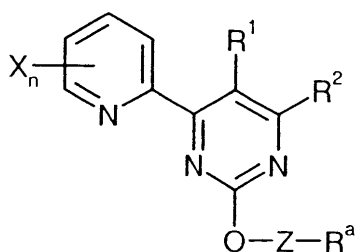
〔式中、

Z及びR^aは上記で示した意味を有する〕のヒドロキシル化合物と、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させる
ことにより、式 (I - h)

【 0 0 4 5 】

【化 2 0 】

20



(I - h)

【 0 0 4 6 】

〔式中、

30

R¹、R²、X、n、Z及びR^aは上記で示した意味を有する〕

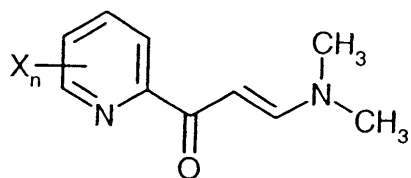
のピリジルピリミジン類が得られ、

あるいは

G) 式 (X)

【 0 0 4 7 】

【化 2 1 】



(X)

40

【 0 0 4 8 】

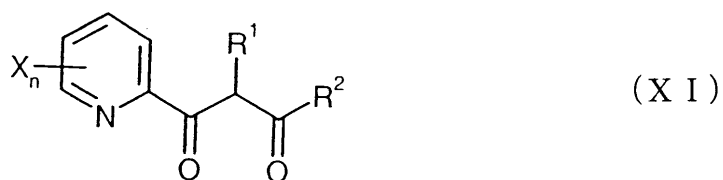
〔式中、

X及びnは上記で示した意味を有する〕

のピリジン誘導体又は式 (X I)

【 0 0 4 9 】

【化 2 2 】



【0050】

[式中、
 R^1 、 R^2 、X及びnは上記で示した意味を有する]
 のピリジン誘導体を式(XII)

10

【0051】

【化23】



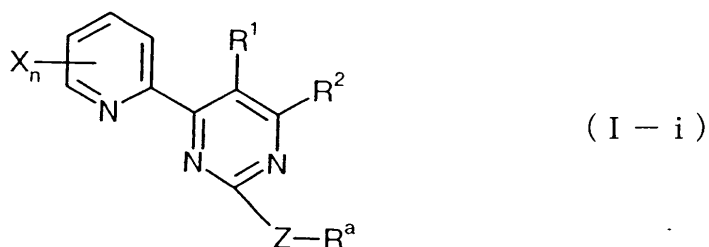
【0052】

[式中、
 Z及び R^a は上記で示した意味を有する]
 のアミジンと、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させる
 ことにより、式(I-i)

20

【0053】

【化24】



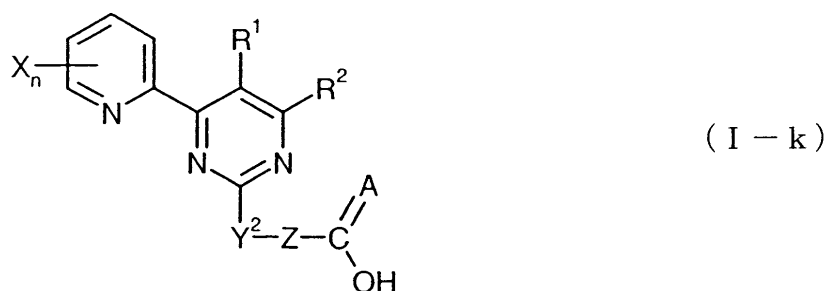
30

【0054】

[式中、
 R^1 、 R^2 、X、n、Z及び R^a は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジン類が得られ、
 あるいは
 H) 式(I-k)

【0055】

【化25】



40

【0056】

[式中、

50

R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び A は上記で示した意味を有し、
 Y^2 は直接結合、酸素、硫黄又は $-NR^9-$ を示す]

のピリジルピリミジンを式 (X I I I)

MOH^- (X I I I)

[式中、

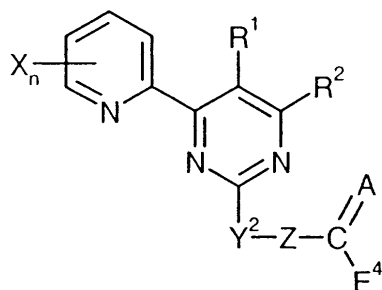
M は上記で示した意味を有する]

のヒドロキシドと、適宜希釈剤の存在下で反応させる

ことにより、式 (I - j)

【0057】

【化26】



(I - j)

10

【0058】

[式中、

20

Y^2 は上記で示した意味を有し、

E^4 は $-O^-M$ 又は $-S^-M$ を示し、

R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 、 A 及び M は上記で示した意味を有する]

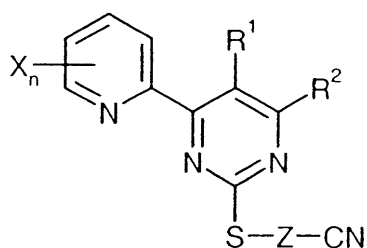
のピリジルピリミジン類が得られ、

あるいは

J) 式 (X I V)

【0059】

【化27】



(X I V)

30

【0060】

[式中、

40

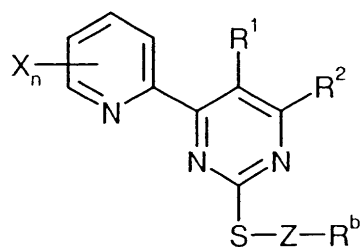
R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は上記で示した意味を有する]

のニトリルを適宜希釈剤の存在下でトリアルキル錫アジドと反応させる

ことにより、式 (I - l)

【0061】

【化28】



(I-1)

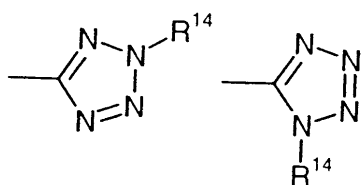
【0062】

〔式中、

R^1 、 R^2 、X、n、Y及びZは上記で示した意味を有し、
 R^b は下記の基

【0063】

【化29】



【0064】

の1つを示し、

ここで R^{14} は上記で示した意味を有する]

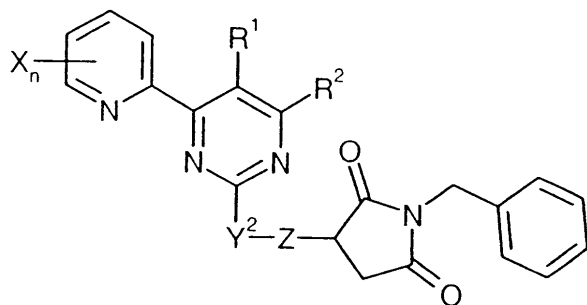
のピリジルピリミジン類が得られ、

あるいは

K) 式 (I-n)

【0065】

【化30】



(I-n)

【0066】

〔式中、

R^1 、 R^2 、X、n、 Y^2 及びZは上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを適宜希釈剤の存在下及び触媒の存在下で水素化することにより、式 (I-m)

【0067】

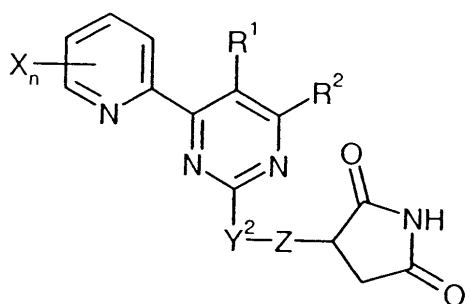
【化31】

10

20

30

40



(I-m)

10

【0068】

[式中、

 R^1 、 R^2 、X、n、 Y^2 及び Z は上記で示した意味を有する]

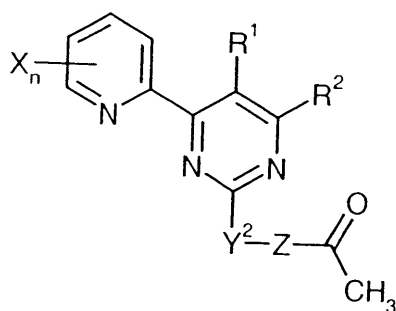
のピリジルピリジン類が得られ、

あるいは

L) 式 (XV)

【0069】

【化32】



(XV)

20

【0070】

[式中、

 R^1 、 R^2 、X、n、 Y^2 及び Z は上記で示した意味を有する]

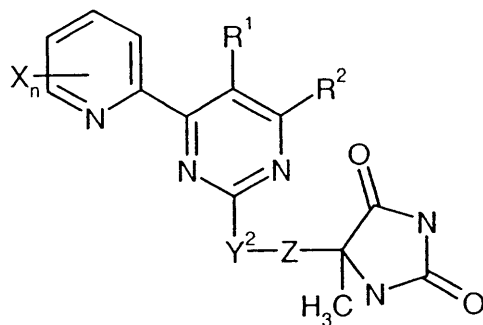
のケト化合物を適宜希釈剤の存在下で炭酸アンモニウム及びシアン化カリウムと反応させる

ことにより、式 (I-o)

30

【0071】

【化33】



(I-o)

40

【0072】

[式中、

 R^1 、 R^2 、X、n、 Y^2 及び Z は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジン類が得られる

ことが見出された。

50

【0073】

最後に、本発明に従う式（I）の化合物が非常に優れた殺虫性を有し、作物保護及び材料の保護の両方において、昆虫のような望ましくない有害動物の抑制のために用いられ得ることが見出された。先行技術ではこれまで、ピリジルピリミジンの殺虫活性について何も開示されたことがない。

【0074】

式（I）は本発明に従うピリジルピリミジンの一般的定義を与える。

【0075】

R^1 及び R^2 は互いに独立して 好ましくは 水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを示すか；あるいはアリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル又は0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示し、それらの基のそれぞれは場合によりハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ及び $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる。

【0076】

R^1 及び R^2 はさらに一緒になって、好ましくは $C_3 - C_5$ - アルキレン又は $C_3 - C_4$ - アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は0～2個の窒素原子及び／又は0もしくは1個の酸素原子を含む1もしくは2個のヘテロ原子により中断されていることができ且つここで得られる環はそれ自身が場合によりハロゲン及び $C_1 - C_6$ - アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる。

【0077】

Xは好ましくはハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルキニルオキシ、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、アリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示すか；

あるいはnが2又は3を示す場合、2個の隣接する基Xはさらに一緒になって、好ましくは $C_3 - C_5$ - アルキレン又は $C_3 - C_4$ - アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は0～2個の窒素原子及び／又は0もしくは1個の酸素原子を含む1もしくは2個のヘテロ原子により中断されていることができる。

【0078】

nは好ましくは0、1、2又は3を示し、nが2又は3を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示す。

【0079】

Yは好ましくは直接結合、酸素、 $-S(O)_p -$ 又は $-NR^9 -$ を示す。

【0080】

pは好ましくは0、1又は2を示す。

【0081】

Zは好ましくは $-(CH_2)_r-$ 、 $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-$ 、 $-(CH_2)_w-$ 、 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ 又は $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ を示す。

【0082】

rは好ましくは1、2、3、4、5又は6を示す。

【0083】

t及びwは互いに独立して好ましくは0、1、2、3又は4を示す。

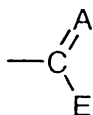
【0084】

Rは好ましくは基

10

【0085】

【化34】



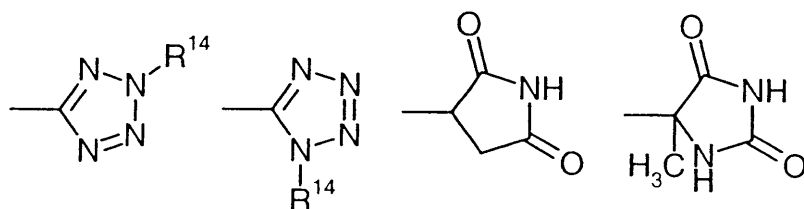
【0086】

を示すか、
あるいは特に

【0087】

20

【化35】



【0088】

よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター（酸模倣物）を示す。

30

【0089】

Aは好ましくは酸素、硫黄又は NR^{15} を示す。

【0090】

Eは好ましくは $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 、 $-O^-M$ 、 $-S^-M$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ を示す。

【0091】

Mは好ましくは場合により C_1-C_6 -アルキル、アリール及びアリール- C_1-C_6 -アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ〜テトラ置換されていることができるアンモニウムを示すか、あるいはリチウムカチオン(Li^+)、ナトリウムカチオン(Na^+)又はカリウムカチオン(K^+)を示す。

40

【0092】

Mはさらに好ましくはマグネシウムカチオン(Mg^{2+})又はカルシウムカチオン(Ca^{2+})を示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成する。

【0093】

R^3 は好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ及び C_1-C_6 -ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置

50

換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5ーもしくは6ー員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルを示す。

【0094】

R^4 は好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルを示す。

【0095】

R^5 は好ましくは水素、アミノ、ホルミル、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、オキサモイルを示す。

10

【0096】

R^4 及び R^5 はさらに一緒になって、好ましくは C_1-C_6 -アルキリデンを示すか；あるいは場合によりハロゲン、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル及び C_1-C_6 -ハロゲノアルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるベンジリデンを示す。

【0097】

R^4 及び R^5 はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に、好ましくは5ーもしくは6ー員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは場合によりさらなる窒素、酸素もしくは硫黄原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なる C_1-C_6 -アルキルでモノーもしくはポリ置換されていることができる。

20

【0098】

R^6 は好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル又はアリール- C_1-C_6 -アルキルを示す。

【0099】

R^7 は好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、アリール又はアリール- C_1-C_6 -アルキルを示す。

30

【0100】

R^8 は好ましくは C_1-C_6 -アルキル又は C_1-C_6 -ハロゲノアルキルを示す。

【0101】

R^9 は好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ及び C_1-C_6 -ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5ーもしくは6ー員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルを示す。

40

【0102】

R^{10} は好ましくはハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルを示すか；あるいはアリール又はアリール- C_1-C_6 -アルキルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてハロゲン及び C_1-C_6 -アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる。

【0103】

50

R^{11} は好ましくは水素又は $C_1 - C_6$ - アルキルを示す。

【0104】

R^{12} 及び R^{13} は互いに独立して好ましくは水素、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_1 - C_6$ - アルコキシを示す。

【0105】

R^{14} は好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルを示す。

【0106】

R^{15} は好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ又はジ ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノを示す。

【0107】

R^{16} は好ましくは水素を示すか；それぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルカルボニルオキシ、オキシ ($C_1 - C_6$ - アルキレン) オキシ、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサソラニル、アリールオキシ、ハロゲノアリールオキシ、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-ONR^4R^5$ 及び $-C(R^{14})=N-OR^{14}$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる $C_1 - C_{16}$ - アルキル、 $C_2 - C_{10}$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル及び $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ 0～4 個の窒素原子、0～2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0～2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 4～6 員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_6$ - アルキルを示すか；あるいは $-NR^4R^5$ を示すか、あるいは基 Q の 1 つを示す。

【0108】

R^{16} はさらに好ましくはアリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ 0～4 個の窒素原子、0～2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0～2 個の隣接していない硫黄原子を含有する 4～6 員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_6$ - アルキルを示し、それらの基のそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができる。

【0109】

R^{17} は好ましくは水素又は $C_1 - C_6$ - アルキルを示す。

【0110】

R^{18} は好ましくは水素、ヒドロキシル、アミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ及びオキシ ($C_1 - C_6$ - アルキレン) オキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル- $C_1 - C_6$ - アルキル、アリール、アリール- $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれ 0～4 個の窒素原子、0～2 個の隣接していない酸素原子及び／又は 0～2 個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- $C_1 - C_6$

10

20

30

40

50

－アルキルを示すか；あるいは－S(O)_pR³、－OR^{1 4}又は－NR⁴R⁵を示す。

【0111】

R^{1 8}はさらに好ましくはそれぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₆－ハロゲノアルコキシ、C₁－C₆－アルキルチオ、C₁－C₆－ハロゲノアルキルチオ、C₁－C₆－アルコキシカルボニル及びC₂－C₆－アルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるC₁－C₆－アルキル又はC₂－C₆－アルケニルを示す。

【0112】

R^{1 8}はさらに好ましくはそれぞれ場合により同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるC₃－C₇－シクロアルキル、C₃－C₇－シクロアルキル－C₁－C₆－アルキル、アリール、アリール－C₁－C₆－アルキル、それぞれ0～4個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール－C₁－C₆－アルキルを示し、ここで置換基は上記で挙げたものの他にニトロ及びC₁－C₆－アルコキシカルボニルよりなる群から選ばれることができる。

10

【0113】

R^{1 7}及びR^{1 8}はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に好ましくは5ーもしくは6ー員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは0～2個の窒素原子、0もしくは1個の酸素原子及び／又は0もしくは1個の硫黄原子を含む1もしくは2個のさらなるヘテロ原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なるC₁－C₆－アルキルでモノーもしくはポリ置換されていることができる。

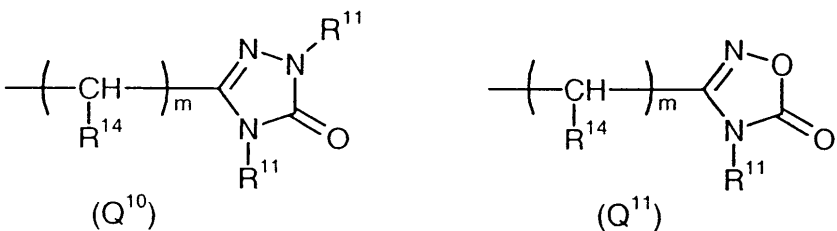
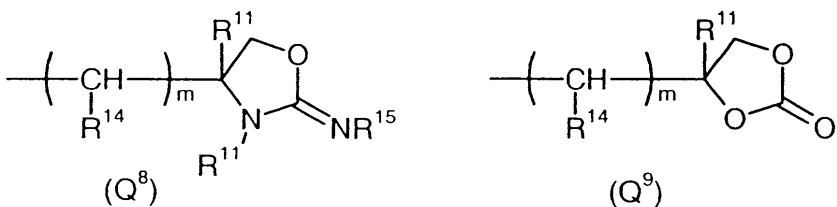
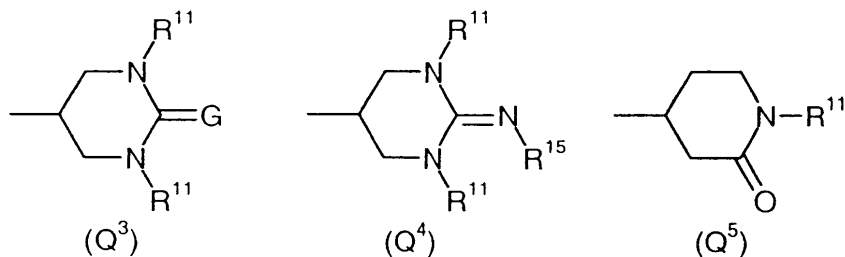
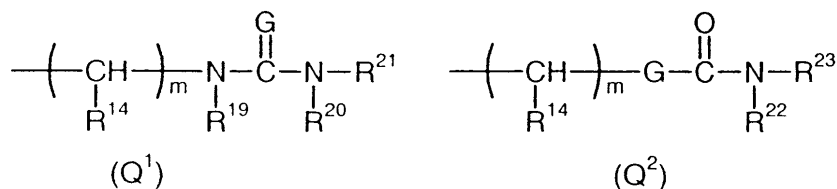
20

【0114】

Qは好ましくは下記の基の1つを示し、

【0115】

【化36】



10

20

30

【0116】

ここで基 R^{11} は、同じ複素環式基中に2個もしくはそれより多くが存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができる。

【0117】

m は好ましくは0、1、2又は3を示し、ここで m が2又は3を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰り返し単位 $\text{---} (\text{CH} \text{R}^{14}) \text{---}$ は同一もしくは異なる意味を有することができる。

【0118】

G は好ましくは酸素又は硫黄を示す。

【0119】

R^{19} 及び R^{20} は互いに独立して好ましくは水素、 C_1 - C_6 - アルキルを示すか、あるいは一緒になって C_2 - C_4 - アルキレンを示す。

【0120】

R^{21} は好ましくは水素を示すか、場合により C_1 - C_6 - アルキルカルボニルオキシ及び C_1 - C_6 - アルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができる C_1 - C_6 - アルキルを示すか；あるいは場合によりハロゲン、シアノ、 C_1 - C_6 - アルキル、 C_1 - C_6 - ハロゲノアルキル、 C_1 - C_6 - アルキルカルボニル、 C_1 - C_{10} - アルコキシカルボニル及び C_3 - C_5 - アルキレン

40

50

よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはポリ置換されていることができるアリールを示す。

【0121】

R^{22} は好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキルを示す。

【0122】

R^{23} は好ましくは水素、アミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキルを示す。

【0123】

R^1 及び R^2 は互いに独立して特に好ましくは水素、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルを示すか；あるいはアリール、アリール - $C_1 - C_4$ - アルキル、0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5－もしくは6－員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示し、それらの基のそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及び1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～テトラ置換されていることができる。

【0124】

R^1 及び R^2 はさらに一緒になって特に好ましくは $C_3 - C_5$ - アルキレン又は $C_3 - C_4$ - アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は0～2個の窒素原子及び／又は0もしくは1個の酸素原子を含む1もしくは2個のヘテロ原子により中断されていることができ且つここで得られる環はそれ自身が場合によりフッ素、塩素、臭素及び $C_1 - C_4$ - アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～テトラ置換されていることができる。

【0125】

Xは特に好ましくはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $-S(O)_p R^3$ 、 $-NR^4 R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2 R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4 R^5$ 、 $-NHCO_2 R^8$ 、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、アリール、アリール - $C_1 - C_4$ - アルキル、0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5－もしくは6－員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを示すか、

あるいはnが2を示す場合、2個の隣接する基Xはさらに一緒になって、特に好ましくは $C_3 - C_4$ - アルキレン又は $C_3 - C_4$ - アルケニレンを示し、ここで炭素鎖は0～2個の窒素原子及び／又は0もしくは1個の酸素原子を含む1もしくは2個のヘテロ原子により中断されていることができる。

【0126】

nは特に好ましくは0、1又は2を示し、nが2を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示す。

【0127】

Yは特に好ましくは直接結合、酸素、 $-S(O)_p -$ 又は $-NR^9 -$ を示す。

【0128】

pは特に好ましくは0、1又は2を示す。

【0129】

Zは特に好ましくは $-(CH_2)_r-$ 、 $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ 、 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ 又は $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ を示す。

【0130】

rは特に好ましくは1、2、3又は4を示す。

【0131】

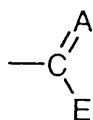
t及びwは互いに独立して特に好ましくは0、1、2、3又は4を示す。

【0132】

Rは特に好ましくは基

【0133】

【化37】



10

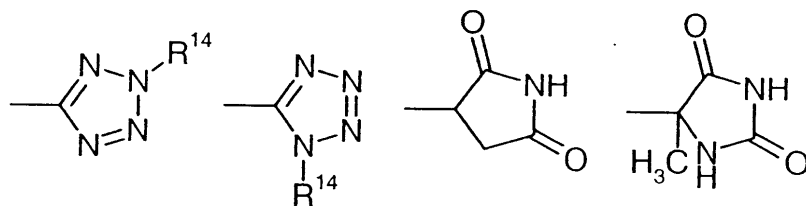
20

【0134】

を示すか、
あるいは特に

【0135】

【化38】



30

【0136】

よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター（酸模倣物）を示し、
Aは特に好ましくは酸素又は硫黄を示す。

【0137】

Eは特に好ましくは $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 、 $-O^-M$ 、 $-S^-M$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ を示す。

【0138】

Mは特に好ましくは場合により C_1-C_4 -アルキル、フェニル、ベンジル及びフェニルエチルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ〜テトラ置換されていることができるアンモニウムを示すか、あるいはナトリウムカチオン(Na^+)又はカリウムカチオン(K^+)を示す。

40

【0139】

Mはさらに特に好ましくはマグネシウムカチオン(Mg^{2+})又はカルシウムカチオン(Ca^{2+})を示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成する。

【0140】

R^3 は特に好ましくは水素、 C_1-C_4 -アルキル、1〜9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-

50

C₆－シクロアルキル－C₁－C₄－アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、C₁－C₄－アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキル、C₁－C₄－アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルコキシ、C₁－C₄－アルキルチオ及び1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるアリール、アリール－C₁－C₄－アルキル、0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル－C₁－C₄－アルキルを示す。

10

【0141】

R⁴ は特に好ましくは水素、C₁－C₄－アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₄－アルキルカルボニルを示す。

【0142】

R⁵ は特に好ましくは水素、アミノ、ホルミル、C₁－C₄－アルキル、C₂－C₄－アルケニル、C₂－C₄－アルキニル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルキルカルボニル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル、オキサモイルを示す。

20

【0143】

R⁴ 及びR⁵ はさらに一緒になって、特に好ましくはC₁－C₄－アルキリデンを示すか；あるいは場合によりフッ素、塩素、臭素、ニトロ、C₁－C₄－アルキル及び1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるベンジリデンを示す。

【0144】

R⁴ 及びR⁵ はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に、特に好ましくは5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは場合によりさらなる窒素、酸素もしくは硫黄原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なるC₁－C₄－アルキルでモノ～テトラ置換されていることができる。

30

【0145】

R⁶ は特に好ましくは水素、C₁－C₄－アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキル又はアリール－C₁－C₄－アルキルを示す。

【0146】

R⁷ は特に好ましくは水素、C₁－C₄－アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₄－アルキル、アリール又はアリール－C₁－C₄－アルキルを示す。

40

【0147】

R⁸ は特に好ましくはC₁－C₄－アルキル又は1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキルを示す。

【0148】

R⁹ は特に好ましくは水素、C₁－C₄－アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₄－アルキルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、C₁－C₄－アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルキル、C₁－C₄－アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁－C₄－ハロゲノアルコキシ、C₁－C₄－アルキ

50

ルチオ及び1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキルチオよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- C_1-C_4 -アルキルを示す。

【0149】

R^{10} は特に好ましくはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルを示すか；あるいはアリール又はアリール- C_1-C_4 -アルキルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてフッ素、塩素、臭素及び C_1-C_4 -アルキルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができる。

【0150】

R^{11} は特に好ましくは水素又は C_1-C_4 -アルキルを示す。

【0151】

R^{12} 及び R^{13} は互いに独立して特に好ましくは水素、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルキル又は C_1-C_4 -アルコキシを示す。

【0152】

R^{14} は特に好ましくは水素、 C_1-C_4 -アルキル又は1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキルを示す。

【0153】

R^{15} は特に好ましくは水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、シアノ又はジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノを示す。

【0154】

R^{16} は特に好ましくは水素を示すか；それぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_4 -アルケニルオキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_4 -アルケニルカルボニルオキシ、オキシ(C_1-C_4 -アルキレン)オキシ、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキサラニル、アリールオキシ、ハロゲノアリールオキシ、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-ONR^4R^5$ 及び $-C(R^{14})=N-OR^{14}$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができる C_1-C_6 -アルキル、デシル、ドデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、 C_2-C_6 -アルケニル、デセニル、 C_2-C_4 -アルキニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する C_1-C_4 -ハロゲノアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル及び C_1-C_4 -アルキルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができるアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する4～6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- C_1-C_4 -アルキルを示すか；あるいは基Qの1つを示す。

【0155】

R^{16} はさらに特に好ましくはそれぞれ場合によりフッ素、塩素及び臭素よりなる群から

の同一もしくは異なる置換基で可能な最高の数まで置換されていることができる $C_1 - C_6$ -アルキル、デシル、ドデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、デセニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニルを示す。

【0156】

R^{16} はさらに特に好ましくはアリール、アリール- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有する4～6員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、それらの基のそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができる。

【0157】

R^{17} は特に好ましくは水素又は $C_1 - C_4$ -アルキルを示す。

【0158】

R^{18} は特に好ましくは水素、ヒドロキシル、アミノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ及びオキシ($C_1 - C_4$ -アルキレン)オキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができる $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、アリール、アリール- $C_1 - C_4$ -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか；あるいは $-S(O)_p R^3$ 、 $-OR^{14}$ 又は $-NR^4 R^5$ を示す。

【0159】

R^{18} はさらに特に好ましくはそれぞれフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル及び $C_2 - C_4$ -アルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されている $C_1 - C_4$ -アルキル又は $C_2 - C_4$ -アルケニルを示すか；あるいはそれぞれ場合によりフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは異なる置換基で可能な最高の数まで置換されていることができる $C_1 - C_4$ -アルキル又は $C_2 - C_4$ -アルケニルを示す。

【0160】

R^{18} はさらに特に好ましくはそれぞれ場合により同一もしくは異なる置換基でモノ～テトラ置換されていることができる $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、アリール、アリール- $C_1 - C_4$ -アルキル、それぞれ0～3個の窒素原子、0～2個の隣接していない酸素原子及び／又は0～2個の隣接していない硫黄原子を含有するヘテロアリール又はヘテロアリール- $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、ここで置換基は挙げたものの他にニトロ及び $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニルよりなる群から選ばれることができる。

【0161】

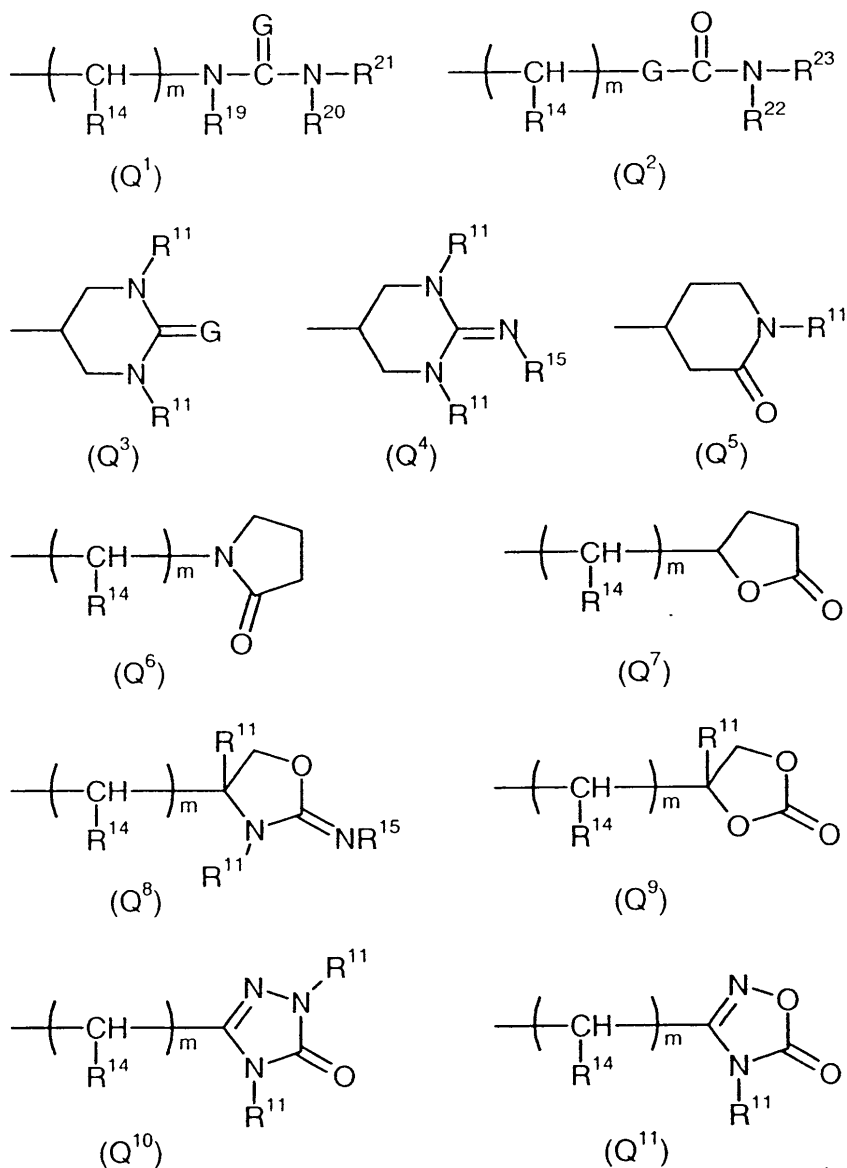
R^{17} 及び R^{18} はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に特に好ましくは5～もしくは6員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それは0～2個の窒素原子、0もしくは1個の酸素原子及び／又は0もしくは1個の硫黄原子を含む1もしくは2個のさらなるヘテロ原子を含有していることができ且つそれは場合により同一もしくは異なる $C_1 - C_4$ -アルキルでモノ～トリ置換されていることができる。

【0162】

Qは特に好ましくは下記の基の1つを示し、

【0163】

【化39】



10

20

30

【0164】

ここで基 R¹¹ は、それらの2個もしくはそれより多くが同じ複素環式基中に存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができる。

【0165】

mは特に好ましくは0、1、2又は3を示し、ここでmが2又は3を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰り返し単位 - (CH R¹⁴) - は同一もしくは異なる意味を有することができる。

40

【0166】

Gは特に好ましくは酸素又は硫黄を示す。

【0167】

R¹⁹ 及び R²⁰ は互いに独立して特に好ましくは水素、C₁ - C₄ - アルキルを示すか、あるいは一緒になって C₂ - C₃ - アルキレンを示す。

【0168】

R²¹ は特に好ましくは水素を示すか、場合により C₁ - C₄ - アルキルカルボニルオキ

50

シ及びC₁ - C₄ - アルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはジ置換されていることができるC₁ - C₄ - アルキルを示すか；あるいは場合によりフッ素、塩素、臭素、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1～9個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₄ - アルキルカルボニル、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル及びC₃ - C₅ - アルキレンよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～テトラ置換されていることができるアリールを示す。

【0169】

R^{2 2} は特に好ましくは水素、C₁ - C₄ - アルキル又はC₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキルを示す。

【0170】

R^{2 3} は特に好ましくは水素、アミノ、C₁ - C₄ - アルキル又はC₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキルを示す。

【0171】

R¹ 及びR² は互いに独立して特別に好ましくは水素、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、-CF₃、-CCl₃、-CHF₂、-CClF₂、-CHCl₂、-CF₂CHFCl、-CF₂CH₂F、-CF₂CCl₃、-CH₂CF₃、-CF₂CHF CF₃、-CH₂CF₂H、-CH₂CF₂CF₃、-CF₂CF₂H、-CF₂CHF CF₃、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、-OCH₂CF₃、-SCF₃、-SCHF₂、-SO₂Me、-SO₂CHF₂、-SO₂CF₃、-SOCHF₂、-SOCF₃、-COMe、-CO₂Me、-CO₂Et、アミノ、シクロペンチル、シクロヘキシルを示すか；フェニル、ベンジル、ピリジニル、フリル、フルフリルを示し、それらのそれぞれは場合により塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシにより置換されていることができる。

【0172】

R¹ 及びR² はさらに一緒になって、特別に好ましくはプロピレン、ブチレン、プロペニレン又はブタジエニレン、-(CH₂)₂-O-CH₂-、-(CH₂)₂-NH-CH₂-、-CH=CH-N=CH-、-CH=CCl-CH=CH-を示す。

【0173】

Xは特別に好ましくはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、-CF₃、-CCl₃、-CHF₂、-CClF₂、-CHCl₂、-CF₂CHFCl、-CF₂CH₂F、-CF₂CCl₃、-CH₂CF₃、-CF₂CHF CF₃、-CH₂CF₂H、-CH₂CF₂CF₃、-CF₂CF₂H、-CF₂CHF CF₃、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、-OCH₂CF₃、-SCF₃、-SCHF₂、-SO₂Me、-SO₂CHF₂、-SO₂CF₃、-SOCHF₂、-SOCF₃、-CH=CH₂、-C≡CH、アミノ、-NHMe、NMe₂、-CHO、-COMe、-CO₂Me、-CO₂Et、-NHCOMe、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアジルを示すか；あるいはnが2を示す場合、2個の隣接する基Xはさらに一緒になって、特別に好ましくはプロピレン、ブチレン、プロペニレン又はブタジエニレン、-(CH₂)₂-O-CH₂-、-(CH₂)₂-NH-CH₂-、-CH=CH-N=CH-を示す。

【0174】

Xはさらに特別に好ましくはメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオを示す。

【0175】

10

20

30

40

50

nは特別に好ましくは0、1又は2を示し、nが2を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示す。

【0176】

Yは特別に好ましくは直接結合、酸素、 $-S(O)_p-$ 又は $-NR^9-$ を示す。

【0177】

pは特別に好ましくは0、1又は2を示す。

【0178】

Zは特別に好ましくは $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH_2)_4-$ 、 $-(CHR^{10})-$ 、 $-CH_2-C(O)-CH_2-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH=C(OH)-$ 、 $-CH=C(OMe)-$ 、 $-CH_2-C(OMe)=CH-$ を示す。 10

【0179】

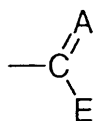
Zはさらに特別に好ましくは $-CH_2-C(OEt)=CH-$ を示す。

【0180】

Rは特別に好ましくは基

【0181】

【化40】



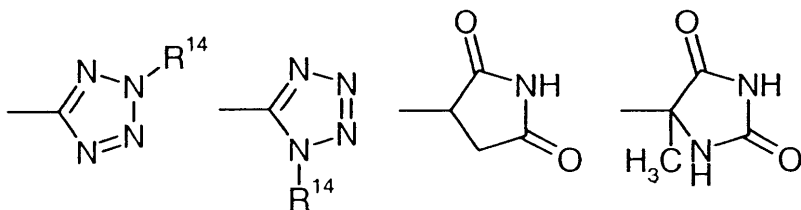
20

【0182】

を示すか、
あるいは特に

【0183】

【化41】



30

【0184】

よりなる群からのカルボン酸バイオアイソスター（酸模倣物）を示す。

【0185】

Aは特別に好ましくは酸素又は硫黄を示す。

【0186】

Eは特別に好ましくは $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 、 $-O^-M$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ を示す。 40

【0187】

Mは特別に好ましくはテトラブチルアンモニウム、トリメチルベンジルアンモニウムを示すか、あるいはナトリウムカチオン(Na^+)又はカリウムカチオン(K^+)を示す。

【0188】

Mはさらに特別に好ましくはマグネシウムカチオン(Mg^{2+})又はカルシウムカチオン(Ca^{2+})を示し、ここでそれぞれの場合に化合物の2個の分子がそのようなイオンと塩を形成する。

【0189】

R^4 は特別に好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、 $-COMe$ を示す。

50

【0190】

R⁵ は特別に好ましくは水素、アミノ、ホルミル、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ビニル、プロパルギル、メトキシ、メトキシメチル、-COMe、-COEt、tert-ブトキシカルボニル、オキサモイルを示す。

【0191】

R⁴ 及び R⁵ はさらに一緒になって、特別に好ましくはエチリデン、イソプロピリデン、sec-ブチリデン、ニトロベンジリデンを示す。

【0192】

R⁴ 及び R⁵ はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に、特別に好ましくは 10
 モルホリン、ピペリジン、チオモルホリン、ピロリジン、テトラヒドロピリジンよりなる群からの5-もしくは6-員の飽和もしくは不飽和複素環を示し、それらは場合によりメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチルによりモノ-もしくはジ置換されていることができる。

【0193】

R⁸ は特別に好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、-CF₃、-CCl₃、-CHF₂、-CClF₂、-CHCl₂、-CF₂CHFCl、-CF₂CH₂F、-CF₂CCl₃、-CH₂CF₃、-CF₂CHF₂CF₃、-CH₂CF₂H、-CH₂CF₂CF₃、-CF₂CF₂Hを示すか、あるいは-CF₂CHF₂CF₃を示す。 20

【0194】

R⁹ は特別に好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、-CH₂CF₃、-CH₂CF₂H、-CH₂CF₂CF₃、シクロプロピル、シクロペンチル又はシクロヘキシルを示す。

【0195】

R¹⁰ は特別に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、-COMe、-COEt、-CO₂Me、-CO₂Et、シクロヘキシルを示すか；フェニル又はベンジルを示し、それらはそれら自身がアリール部分においてフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ-〜テトラ置換されていることができる。 30

【0196】

R¹¹ は特別に好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチルを示す。

【0197】

R¹⁴ は特別に好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル又はtert-ブチルを示す。

【0198】

R¹⁵ は特別に好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル又はシアノを示す。 40

【0199】

R¹⁶ は特別に好ましくは水素を示すか；メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、シアミル、ヘキシル、n-デシル、n-ドデシル、n-テトラデシル、n-ヘキサデシル、ビニル、アリル、ブテニル、2-イソペンテニル、ヘキセニル、n-デセニル、エチニル、プロピニル、ブチニルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、-OCH₂CF₃、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イ 50

ソプロボキシカルボニル、*tert*-ブトキシカルボニル、メチルカルボニルオキシ、ビニルカルボニルオキシ、 $-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-$ 、オキセタニル、ジオキサニル、オキサゾリジニル、ジオキソラニル、フェノキシ、フルオロフェノキシ、 $-\text{CONR}^4\text{R}^5$ 、 $-\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $-\text{ONR}^4\text{R}^5$ 及び $-\text{CH}=\text{N}-\text{OCH}_3$ よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー〜トリ置換されていることができるか；あるいはフェニル、ベンジル、フェニルエチル、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、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、オキセタニル、オキサゾラニル、ジオキサニル、ジオキソラニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダゾリル、ピラジル、チアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアゾリル、テトラヒドロピラニル、チエタニル、チエタンジオキシド、オキセタニルメチル、オキサゾラニルメチル、ジオキサニルメチル、ジオキソラニルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、ピロリルメチル、オキサゾリルメチル、イソオキサジルメチル、イミダゾリルメチル、ピラジルメチル、チアゾリルメチル、ピリジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピリダジルメチル、トリアジニルメチル、トリアゾリルメチル、テトラヒドロピラニルメチル、チエタニルメチル、チエタンジオキシドメチル、オキセタニルエチル、オキサゾラニルエチル、ジオキサニルエチル、ジオキソラニルエチル、フリルエチル、チエニルエチル、ピロリルエチル、オキサゾリルエチル、イソオキサジルエチル、イミダゾリルエチル、ピラジルエチル、チアゾリルエチル、ピリジニルエチル、ピリミジニルエチル、ピリダジルエチル、トリアジニルエチル、トリアゾリルエチル、テトラヒドロピラニルエチル、チエタニルエチル、チエタンジオキシドエチルを示し；それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CClF}_2$ 、 $-\text{CHCl}_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCF}_3$ 、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、 $-\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{CO}_2\text{Et}$ 、メチルカルボニルオキシ及びエチルカルボニルオキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー〜トリ置換されていることができるか；あるいは基Qの1つを示す。

10

20

30

【0200】

R^{1-6} はさらに特別に好ましくはそれぞれ場合によりフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは異なる基で可能な最大数まで置換されていることができるメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、シアミル、ヘキシル、*n*-デシル、*n*-ドデシル、*n*-テトラデシル、*n*-ヘキサデシル、ビニル、アリル、ブテニル、2-イソペンテニル、ヘキセニル、*n*-デセニル、エチニル、プロピニル、ブチニルを示す。

【0201】

R^{1-6} はさらに特別に好ましくはフェニル、ベンジル、フェニルエチル、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、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、オキセタニル、オキサゾラニル、ジオキサニル、ジオキソラニル、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサジル、イミダゾリル、ピラジル、チアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアゾリル、テトラヒドロピラニル、チエタニル、チエタンジオキシド、オキセタニルメチル、オキサゾラニルメチル、ジオキサニルメチル、ジオキソラニルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、ピロリルメチル、オキサゾリルメチル、イソオキサジルメチル、イミダゾリルメチル、ピラジルメチル、チアゾリルメチル、ピリジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピリダジルメチル、トリアジニルメチル、トリ

40

50

アゾリルメチル、テトラヒドロピラニルメチル、チエタニルメチル、チエタンジオキシドメチル、オキセタニルエチル、オキサゾラニルエチル、ジオキサニルエチル、ジオキソラニルエチル、フリルエチル、チエニルエチル、ピロリルエチル、オキサゾリルエチル、イソオキサジルエチル、イミダゾリルエチル、ピラジルエチル、チアゾリルエチル、ピリジニルエチル、ピリミジニルエチル、ピリダジルエチル、トリアジニルエチル、トリアゾリルエチル、テトラヒドロピラニルエチル、チエタニルエチル、チエタンジオキシドエチルを示し、それらのそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノー～テトラ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にまたヒドロキシル及びニトロよりなる群から選ばれることができる。

【0202】

10

R¹⁻⁷ は特別に好ましくは水素、メチル又はエチルを示す。

【0203】

R¹⁻⁸ は特別に好ましくは水素、ヒドロキシル、アミノ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ビニル、アリルを示すか；あるいはシクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、ピリジニル、ピリジニルメチル、ピリジニルエチル、フリル、フルフリルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、ヒドロキシル、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ及び-O-CH₂-O-よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができるか；あるいは-SO₂Me、-SO₂Et又は-NR⁴R⁵を示す。

20

【0204】

R¹⁻⁸ はさらに特別に好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ビニル、アリルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素、臭素、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、-OCH₂CF₃、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル及びtert-ブトキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができるか；あるいはメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ビニル、アリルを示し、それらのそれぞれは場合によりフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは異なる置換基で可能な最大数まで置換されていることができる。

30

【0205】

R¹⁻⁸ はさらに特別に好ましくはシクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、ピリジニル、ピリジニルメチル、ピリジニルエチル、フリル、フルフリルを示し、それらのそれぞれは場合により同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができ、ここで置換基は上記で挙げたものの他にまたニトロ、メトキシカルボニル及びエトキシカルボニルよりなる群から選ばれることができる。

40

【0206】

R¹⁻⁷ 及び R¹⁻⁸ はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒に特別に好ましくはピペラジン、モルホリン、ピペリジン、ピロリジンよりなる群からの5-もしくは6-員の飽和複素環を示し、それらは場合によりメチル、エチル、n-プロピル及びイソプロピルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノー～トリ置換されていることができる。

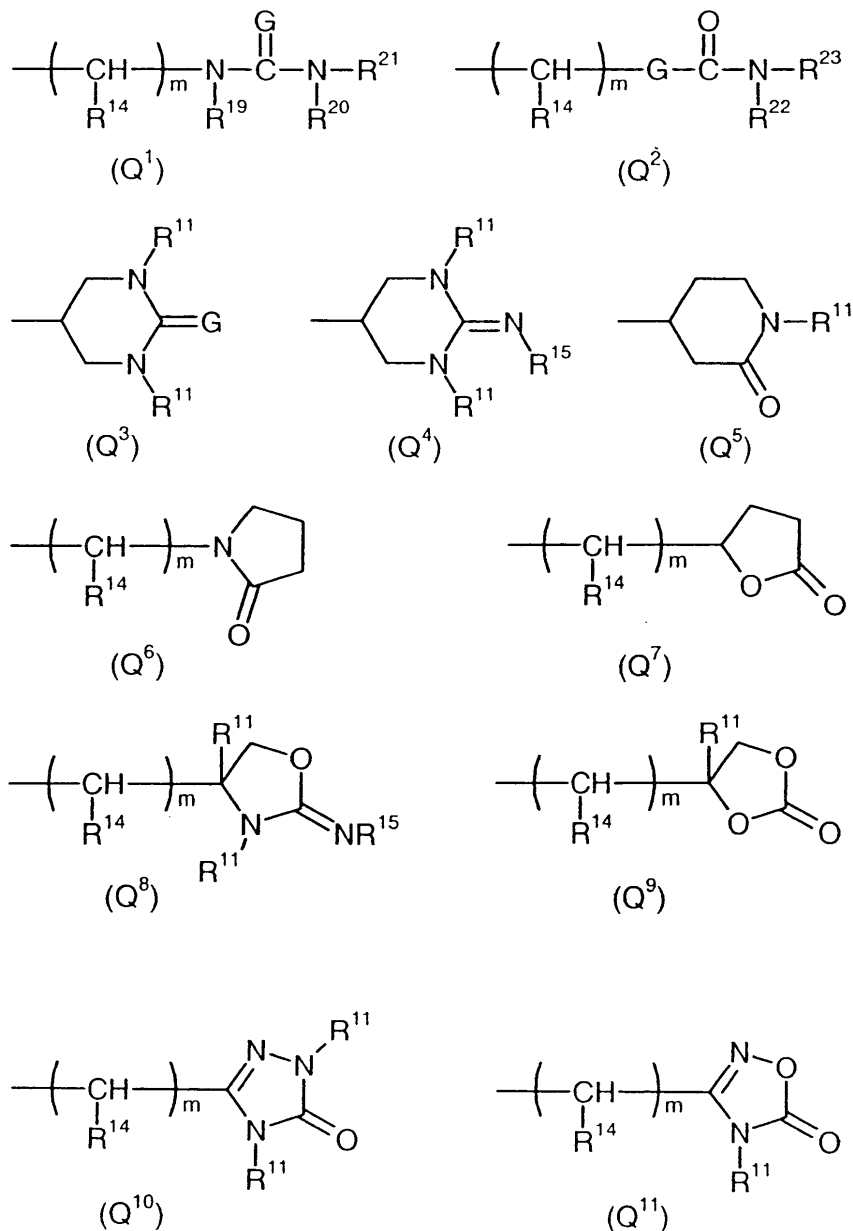
【0207】

Qは特別に好ましくは下記の基の1つを示し、

【0208】

50

【化 4 2】



10

20

30

【0209】

ここで基 R^{11} は、それらの2個もしくはそれより多くが同じ複素環式基中に存在する場合、同一もしくは異なる意味を有することができる。

【0210】

m は特別に好ましくは0、1、2又は3を示し、ここで m が2又は3を示す場合、複素環式基の側鎖中の繰り返し単位 $\text{-(CH(R}^{14}\text{))}_m\text{-}$ は同一もしくは異なる意味を有することができる。

40

【0211】

G は特別に好ましくは酸素又は硫黄を示す。

【0212】

R^{19} 及び R^{20} は互いに独立して特別に好ましくは水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチル、 $tert$ -ブチルを示すか、あるいは一緒になって $\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-}$ 又は $\text{-(CH}_2\text{)}_3\text{-}$ を示す。

【0213】

R^{21} は特別に好ましくは水素を示すか、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル

50

、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチルを示し、それらのそれぞれは場合により *tert*-ブチルカルボニルオキシ又はメトキシでモノ置換されていることができるか；あるいはフェニルを示し、それは場合により塩素、シアノ、メチル、エチル、*tert*-ブチル、トリフルオロメチル、*sec*-ブチルオキシカルボニル、*tert*-ブチルオキシカルボニル、*n*-オクチルオキシカルボニル及び $-(CH_2)_4-$ による群からの同一もしくは異なる置換基でモノーもしくはジ置換されていることができる。

【0214】

R^{22} は特別に好ましくは水素、メチル、エチル又はメトキシメチルを示す。

【0215】

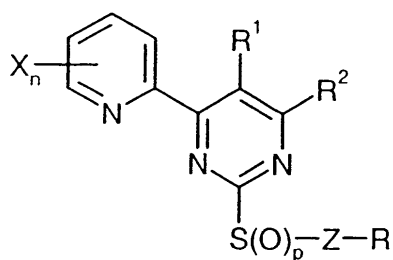
R^{23} は特別に好ましくは水素、アミノ、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル又はメトキシメチルを示す。

【0216】

式 (I-p)

【0217】

【化43】



(I-p)

【0218】

[式中、

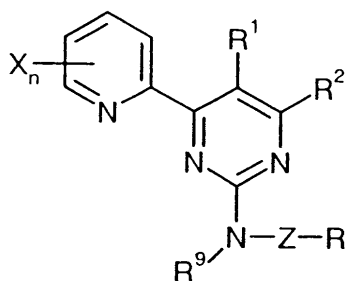
R^1 、 R^2 、X、*n*、*p*、Z及びRは上記で示した意味を有する]のピリジルピリミジン類が格別に好ましい。

【0219】

式 (I-q)

【0220】

【化44】



(I-q)

【0221】

[式中、

R^1 、 R^2 、X、*n*、Z、R及び R^9 は上記で示した意味を有する]のピリジルピリミジン類が格別に好ましい。

【0222】

式 (I-r)

【0223】

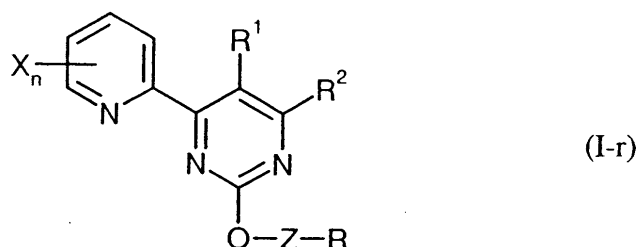
【化45】

10

20

30

40



【0224】

〔式中、

R^1 、 R^2 、X、n、Z及びRは上記で示した意味を有する〕
 のピリジルピリミジン類が格別に好ましい。

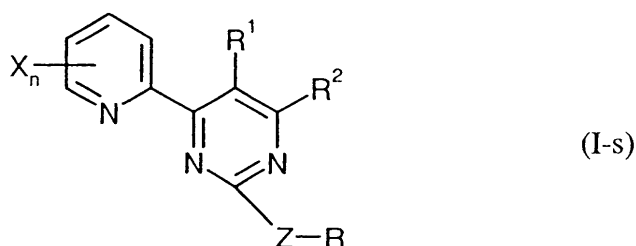
10

【0225】

式 (I-s)

【0226】

【化46】



20

【0227】

〔式中、

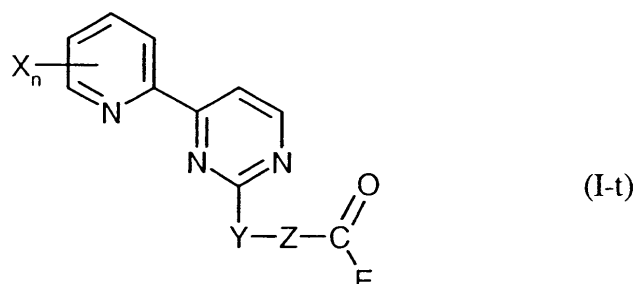
R^1 、 R^2 、X、n、Z及びRは上記で示した意味を有する〕
 のピリジルピリミジン類が格別に好ましい。

【0228】

式 (I-t)

【0229】

【化47】



40

【0230】

〔式中、

Xはメチル、エチル、塩素、臭素、 $-CF_3$ 、メトキシ又はトリフルオロメトキシを示し、

、

nは0、1又は2を示し、nが2を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示し、

Yは $-S-$ 又は $-NR^9-$ を示し、

Zは $-CH_2-$ 又は $-(CH_2)_2-$ を示し、

Eはヒドロキシル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、 $-NH-SO_2Me$ 又は $-NH-SO_2Et$ を示し、

50

R⁹ は水素、メチル又はエチルを示す]
のピリジルピリミジン類が格別に好ましい。

【0231】

アルキルのような飽和炭化水素基は、例えばアルコキシにおけるようにヘテロ原子と組み合わされた場合を含んで、それぞれの場合に直鎖又はこれが可能な限り分枝鎖であることができる。

【0232】

しかしながら、上記の一般的もしくは好ましい基の定義又は例示を所望通り、すなわちそれぞれの範囲及び好ましい範囲の間で、互いに組み合わせることもできる。定義は最終的生成物ならびに対応して前駆体及び中間体の両方に適用される。

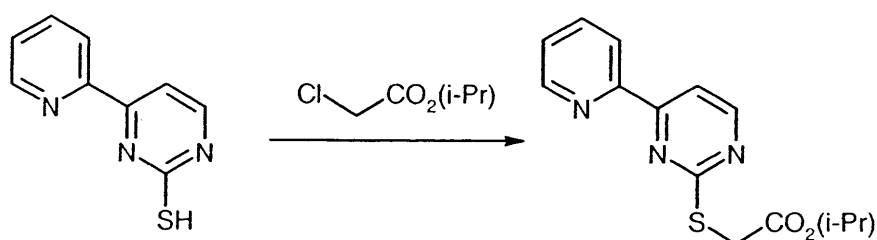
10

【0233】

4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニルチオール及び2-クロロ酢酸イソプロピルを出発材料として用い、本発明に従う方法(A)の経路を下記の式により例示することができる。

【0234】

【化48】



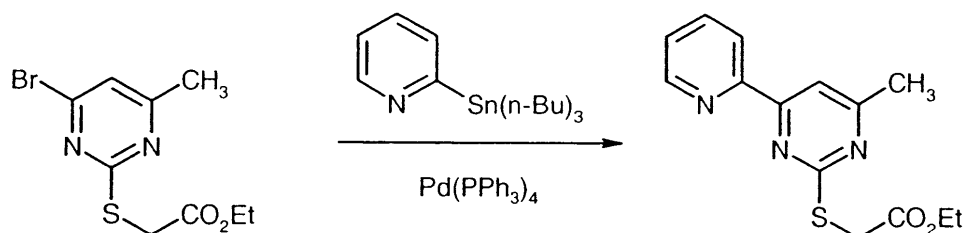
20

【0235】

[(4-ブロモ-6-メチル-2-ピリミジニル)チオ]酢酸エチル、2-(トリブチルスタンニル)-ピリジン及びパラジウム触媒を出発材料として用い、本発明に従う方法(B)の経路を下記の式により例示することができる。

【0236】

【化49】



30

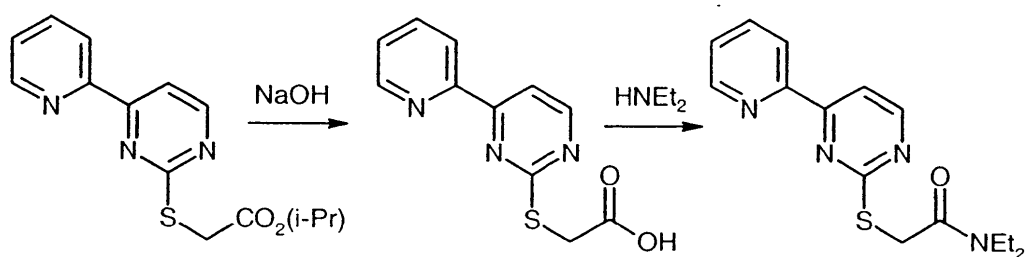
【0237】

{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]チオ}酢酸イソプロピルを出発材料として、ならびに水酸化ナトリウム水溶液及びトリエチルアミンを反応助剤として用い、本発明に従う方法(C)の経路を下記の式により例示することができる。

40

【0238】

【化50】



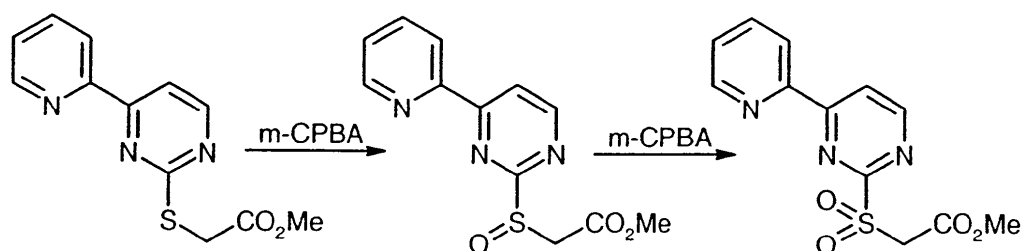
【0239】

10

{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]チオ}酢酸メチルを出発材料として、及びメタークロロ過安息香酸 (m-CPBA) を酸化剤として用い、本発明に従う方法 (D) の経路を下記の式により例示することができる。

【0240】

【化51】



20

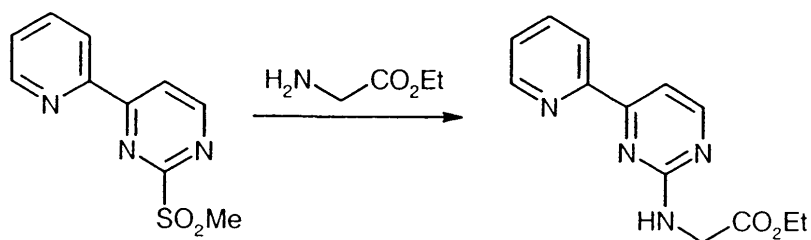
【0241】

2-(メチルスルホニル)-4-(2-ピリジニル)ピリミジン及びグリシン酸エチルを出発材料として用い、本発明に従う方法 (E) の経路を下記の式により例示することができる。

【0242】

【化52】

30



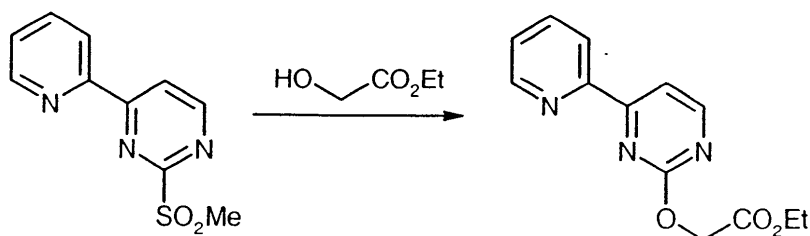
【0243】

40

2-(メチルスルホニル)-4-(2-ピリジニル)ピリミジン及びグリコール酸エチルを出発材料として用い、本発明に従う方法 (F) の経路を下記の式により例示することができる。

【0244】

【化53】

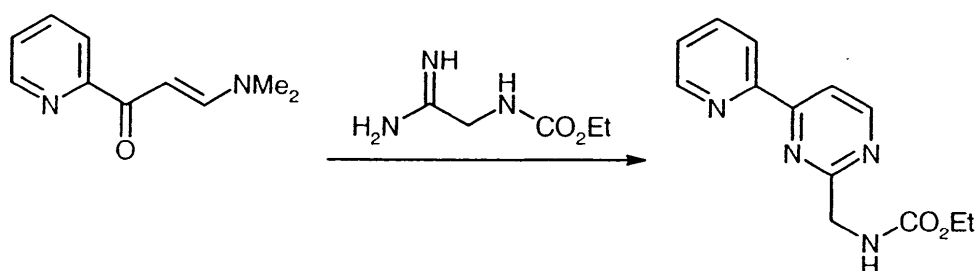


【0245】

3-(ジメチルアミノ)-1-(2-ピリジニル)-2-プロペン-1-オン及び2-アミノ-2-イミノエチルカルバミン酸メチルを出発材料として用い、本発明に従う方法（G）の経路を下記の式により例示することができる。

【0246】

【化54】



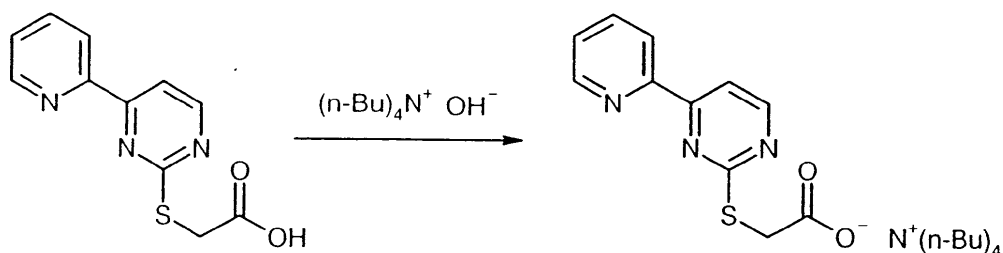
20

【0247】

{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]チオ}酢酸及びテトラブチルアンモニウムヒドロキシドを出発材料として用い、本発明に従う方法（H）の経路を下記の式により例示することができる。

【0248】

【化55】



30

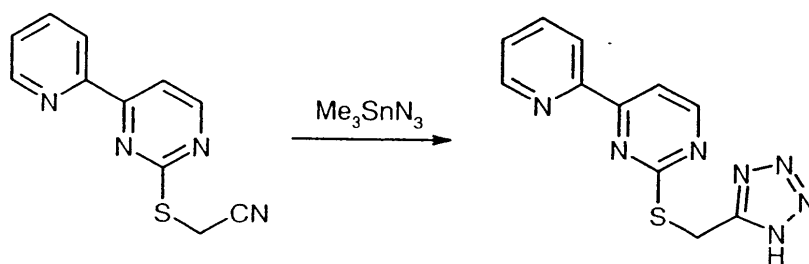
【0249】

{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]チオ}アセトニトリル及びトリメチル錫アジドを出発材料として用い、本発明に従う方法（J）の経路を下記の式により例示することができる。

【0250】

【化56】

40



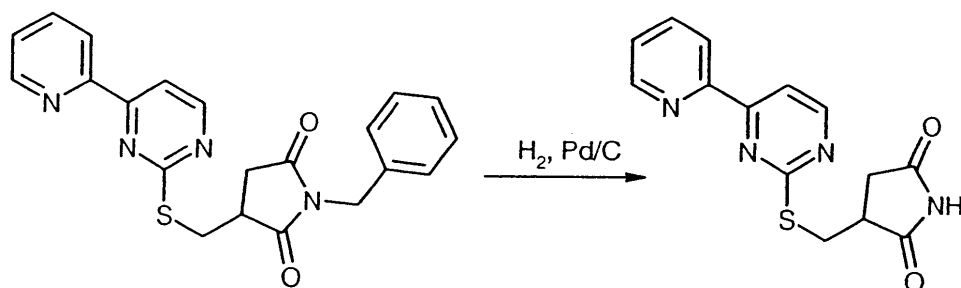
【0251】

10

1-ベンジル-3-({ [4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル] チオ } メチル)-2,5-ピロリジンジオン及び水素を出発材料として、ならびにパラジウム／活性炭を触媒として用い、本発明に従う方法 (K) の経路を下記の式により例示することができる。

【0252】

【化57】



20

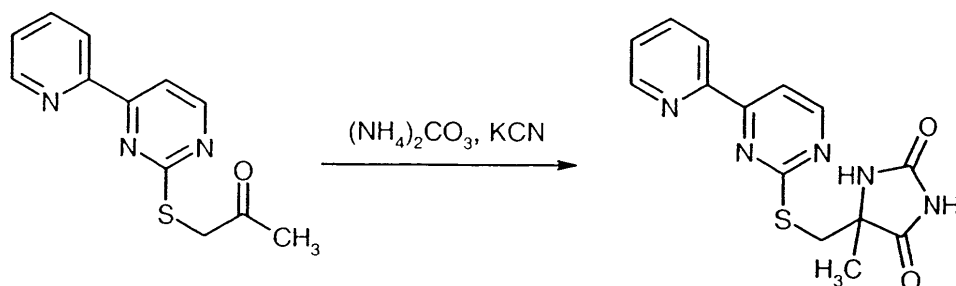
【0253】

1- { [4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル] チオ } アセトン、シアン化カリウム及び炭酸アンモニウムを出発材料として用い、本発明に従う方法 (L) の経路を下記の式図により例示することができる。

【0254】

30

【化58】



40

【0255】

方法及び中間体の説明

方法 (A)

式 (I I) は、本発明に従う方法 (A) を行なうために出発材料として必要なチオールの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X及びnは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

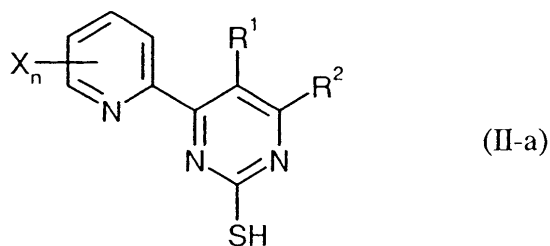
【0256】

式 (I I-a)

【0257】

50

【化 5 9】



【0 2 5 8】

10

〔式中、

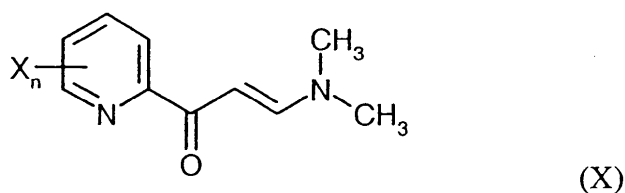
R^1 、 R^2 、 X 及び n は上記で示した意味を有し、但し基 R^1 、 R^2 及び X の少なくとも 1 つは水素を示さない〕

のチオールは新規である。それらは

a) 式 (X)

【0 2 5 9】

【化 6 0】



20

【0 2 6 0】

〔式中、

X 及び n は上記で示した意味を有する〕

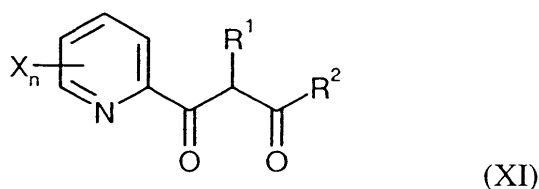
のピリジン誘導体を適宜希釈剤（例えばメタノール、水）の存在下及び適宜塩基（例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムエトキシド）の存在下でチオウレアと反応させるか、あるいは

30

b) 式 (XI)

【0 2 6 1】

【化 6 1】



【0 2 6 2】

40

〔式中、

R^1 、 R^2 、 X 及び n は上記で示した意味を有する〕

のピリジン誘導体を適宜希釈剤（例えばメタノール、水）の存在下及び適宜塩基（例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムエトキシド）又は酸（例えば塩酸又はトリフルオロ酢酸）の存在下でチオウレアと反応させることにより製造することができる。

【0 2 6 3】

式 (X) 及び (XI) は方法 (a) 及び (b) を行なうために出発材料として必要なピリジン誘導体の一般的定義を与えている。これらの式において、 R^1 、 R^2 、 X 及び n は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述

50

と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0264】

式(X)及び(XI)のピリジン誘導体は既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる(J. Chem. Soc., Dalton Trans. 1999, 3095、J. Amer. Chem. Soc. 1951, 73, 5614を参照されたい)。

【0265】

式(III)は、本発明に従う方法(A)を行なうために出発材料として必要なハロゲン化合物の一般的定義を与えている。この式において、Z及びAは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 E^1 は好ましくは $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ 、特に好ましくは $-OR^{16}$ 又は $-SR^{16}$ を示し、ここで R^{16} 、 R^{17} 及び R^{18} はそれぞれ好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 Hal^1 は好ましくは塩素、臭素又はヨウ素、特に好ましくは塩素又は臭素を示す。

10

【0266】

式(III)のハロゲン化合物は既知であり、既知の方法により製造することができる。

【0267】

本発明に従う方法(A)を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。場合によりハロゲン化されていることができる脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素、例えば石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン又はトリクロロエタン；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、メチルtert-ブチルエーテル、エチルtert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン又はアニソール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；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-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチル；スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシド；あるいはスルホン類、例えばスルホランを用いるのが好ましい。アセトニトリル又はジメチルホルムアミドを用いるのが特に好ましい。

20

30

【0268】

本発明に従う方法(A)を行なうために適した酸結合剤は、それぞれの場合にそのような反応に通例であるすべての無機及び有機塩基である。アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウムあるいはまた水酸化アンモニウム、アルカリ金属水素化物、例えば水素化ナトリウム、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属酢酸塩、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムならびにまた第3級アミン類、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)又はジアザビシクロウンデセン(DBU)を用いるのが好ましい。アルカリ金属炭酸塩もしくは水素化物を用いるのが特に好ましく、炭酸カリウムが特別に好ましい。

40

【0269】

本発明に従う方法(A)を行なう場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は -20°C ~ 200°C 、好ましくは 0°C ~ 150°C 、特

50

別に好ましくは $20^{\circ}\text{C} \sim 100^{\circ}\text{C}$ の温度で行なわれる。

【0270】

本発明に従う方法 (A) を行なう場合、一般に式 (I I) の化合物のモル当たり 1 モル又はわずかに過剰の式 (I I I) の化合物及び 1 ~ 10 モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

方法 (B)

式 (I V) は、本発明に従う方法 (B) を行なうために出発材料として必要なハロゲノピリミジンの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、Z 及び A は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 E^1 は好ましくは $-\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{SR}^{16}$ 又は $-\text{NR}^{17} \text{R}^{18}$ 、特に好ましくは $-\text{OR}^{16}$ 又は $-\text{SR}^{16}$ を示し、ここで R^{16} 、 R^{17} 及び R^{18} はそれぞれ好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 Hal^2 は好ましくはフッ素、塩素、臭素又はヨウ素、特に好ましくは塩素、臭素又はヨウ素、特別に好ましくは塩素又は臭素を示す。

10

20

【0271】

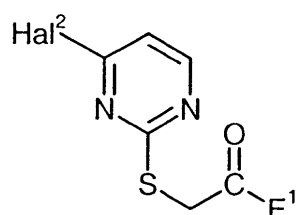
式 (I V) のハロゲノピリミジンのいくつかは既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる (米国特許第 3, 910, 910 号明細書を参照されたい)。

【0272】

式 (I V-a)

【0273】

【化 6 2】



(IV-a)

30

【0274】

[式中、

a) E^1 はメトキシ又はエトキシを示し、

Hal^2 は臭素を示すか

あるいは

b) E^1 はメトキシを示し、

Hal^2 は塩素を示す]

40

のハロゲノピリミジンは新規である。

【0275】

式 (V) は、本発明に従う方法 (B) を行なうために出発材料として必要なピリジン化合物の一般的定義を与えている。この式において、X 及び n は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。L は好ましくは $\text{Sn} (n-\text{Bu})_3$ 、 $\text{Sn} (\text{Me})_3$ 、 $\text{Sn} (\text{フェニル})_3$ 、 ZnBr 又は ZnCl 、特に好ましくは $\text{Sn} (n-\text{Bu})_3$ 、 $\text{Sn} (\text{Me})_3$ 、 $\text{Sn} (\text{フェニル})_3$ 又は ZnBr 、特別に好ましくは $\text{Sn} (n-\text{Bu})_3$ 、 $\text{Sn} (\text{Me})_3$ 又は ZnBr を示す。

【0276】

50

式 (V) のピリジン化合物は既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる。

【0277】

本発明に従う方法 (B) を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。場合によりハロゲン化されていることができる脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素、例えば石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン又はトリクロロエタン；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、メチル tert-ブチルエーテル、メチル tert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタン又はアニソール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；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-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミドを用いるのが好ましい。芳香族炭化水素を用いるのが特に好ましく、ベンゼン、トルエン又はキシレンが特別に好ましい。

10

【0278】

本発明に従う方法 (B) を行なう場合、一般にパラジウム触媒を用い、その一部として (for its part) さらに別のリガンドを添加して又は添加しないで用いることができる。用いられる触媒は好ましくは $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ [$\text{dppf} = 1, 1'$ -ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ 、 $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ 、 $\text{PdCl}_2(\text{CH}_3\text{CN})_2$ 、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ [$\text{dba} = \text{ジベンジリデンアセトン}$] 又は $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ 、特に好ましくは $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ 、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ 、 $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ 又は $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ 、特別に好ましくは $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ 又は $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ である。

20

【0279】

適したリガンドはトリアリールホスフィン類、トリアルキルホスフィン類又はアルシン類である。 dppf 、 PPh_3 、 $\text{P}(\text{t-Bu})_3$ 、 Pcy_3 又は AsPh_3 を用いるのが好ましく、 dppf を用いるのが特に好ましい。

【0280】

本発明に従う方法 (B) を行なう場合、反応温度は比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は $-20^\circ\text{C} \sim 200^\circ\text{C}$ 、好ましくは $0^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ の温度で行なわれる。

30

【0281】

本発明に従う方法 (B) を行なう場合、一般に式 (IV) の化合物のモル当たり 1 モル又はわずかに過剰の式 (V) の化合物及び 1～5 モル% の触媒が用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、粗生成物からクロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法を用いて、存在し得る不純物を除去する。

方法 (C)

式 (I-c) は、本発明に従う方法 (C) を行なうために出発材料として必要なピリジルピリミジンの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X、n、Z 及び A は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 E^3 は好ましくは $-\text{OR}^{16}$ を示し、ここで R^{16} は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

40

【0282】

式 (I-c) のピリジルピリミジンは、本発明に従う式 (I) の化合物の定義の下に含まれ、方法 (A) 又は (B) の 1 つにより製造される。

50

【0283】

式(I-d)は、本発明に従う方法(C)を行なう場合に中間体として生成するピリジルピリミジンの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0284】

式(VI)は、本発明に従う方法(C)を行なうために出発材料として必要なアミンの一般的定義を与えている。この式において、 R^{17} 及び R^{18} は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

10

【0285】

式(VI)のアミンは既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる。

【0286】

本発明に従う方法(C)を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常のプロトン性溶媒である。水又はアルコール類、例えばメタノール、エタノール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチルを用いるのが好ましい。水又はアルコール類を用いるのが特に好ましく、メタノール又はエタノールが特別に好ましい。

20

【0287】

本発明に従う方法(C)を行なうために適した吸水性試薬は、それぞれの場合にすべての通常の水脱剤である。カルボジイミド類を用いるのが好ましい。ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)又はN-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド(EDC)を用いるのが特に好ましい。

【0288】

本発明に従う方法(C)を行なうために適した塩基は、そのような反応に通例のすべての無機及び有機塩基である。アルカリ土類金属又はアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウムあるいはまた水酸化アンモニウムが好ましい。

30

【0289】

本発明に従う方法(C)を行なう場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は -20°C ～ 200°C 、好ましくは 0°C ～ 150°C 、特別に好ましくは 20°C ～ 100°C の温度で行なわれる。

【0290】

本発明に従う方法(C)を行なう場合、一般に1モルの式(I-c)の化合物を第1段階で最初に塩基を用いて処理し、第2段階で1モル又はわずかに過剰の式(VI)の化合物及び1～1.5モル%の吸水性試薬を用いて処理する。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、粗生成物からクロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法を用いて、存在し得る不純物を除去する。

40

方法(D)

式(I-f)は、本発明に従う方法(D)を行なうために出発材料として必要なピリジルピリミジンの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びRは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

式(I-f)のピリジルピリミジンは、本発明に従う式(I)の化合物の定義の下に含まれ、例えば方法(A)又は(B)の1つにより製造される。

【0291】

50

本発明に従う方法（D）を行なうために適した酸化剤は、硫黄を酸化するために用いられ得るすべての通常の酸化剤である。過酸化水素、有機過酸、例えば過酢酸、m-クロロ過安息香酸、p-ニトロ過安息香酸又は大気酸素が特に適している。

【0292】

本発明に従う方法（D）を行なうために適した希釈剤は同様に不活性有機溶媒である。炭化水素、例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、ヘキサン又は石油エーテル；塩素化炭化水素、例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素又はクロロベンゼン；エーテル類、例えばジエチルエーテル、ジオキサン又はテトラヒドロフラン；カルボン酸、例えば酢酸又はプロピオン酸；双極性非プロトン性溶媒、例えばアセトニトリル、アセトン、酢酸エチル又はジメチルホルムアミドを用いるのが好ましい。

10

【0293】

適宜、本発明に従う方法（D）を酸結合剤の存在下で行なうことができる。適した酸結合剤は、通常用いられるすべての有機及び無機酸結合剤である。アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、酢酸塩又は炭酸塩、例えば水酸化カルシウム、水酸化ナトリウム、酢酸ナトリウム又は炭酸ナトリウムを用いるのが好ましい。

【0294】

適宜、本発明に従う方法（D）に適した触媒の存在下で行なうことができる。適した触媒は、そのような硫黄の酸化のために通常用いられるすべての金属塩触媒である。これに関し、モリブデン酸アンモニウム及びタングステン酸ナトリウムを例として挙げるができる。

20

【0295】

本発明に従う方法（D）を行なう場合、反応温度は比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は -20°C ～ $+70^{\circ}\text{C}$ の温度、好ましくは 0°C ～ $+50^{\circ}\text{C}$ の温度で行なわれる。

【0296】

本発明に従う方法（D）を行なうために、硫黄の酸化をスルホキシド段階で止めるべき場合には、一般に式（I-f）の化合物のモル当たり0.8～1.2モル、好ましくは等モル量の酸化剤が用いられる。スルホンへの酸化のためには、一般に式（I-f）の化合物のモル当たり1.8～3.0モル、好ましくは2倍モル量の酸化剤が用いられる。反応の実施、仕上げ及び最終的生成物の単離は通常の方法により行なわれる。

30

方法（E）

式（V I I）は、本発明に従う方法（E）を行なうために出発材料として必要なメチルスルホニルピリミジンの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X及びnは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

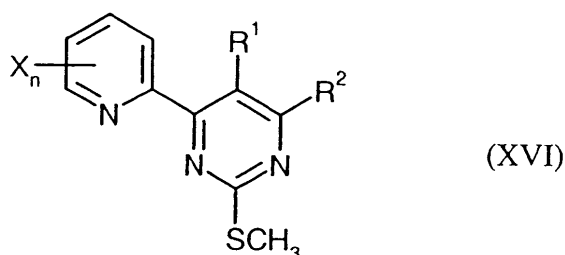
【0297】

式（V I I）のメチルスルホニルピリミジンは新規である。それらは、
c) 式（X V I）

【0298】

40

【化63】



【0299】

50

[式中、

R^1 、 R^2 、X及びnは上記で示した意味を有する]

のメチルチオ誘導体を酸化剤（例えばm-クロロ過安息香酸）と、適宜希釈剤（例えばジクロロメタン）の存在下で反応させる

ことにより製造することができる。

【0300】

式(XVI)は、方法(c)を行なうために出発材料として必要なメチルチオ誘導体の一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X及びnは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

10

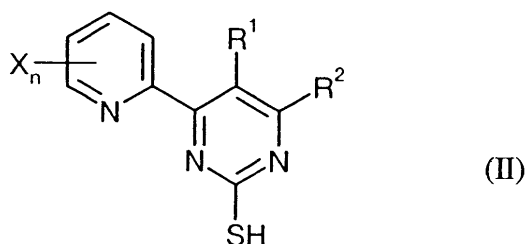
【0301】

式(XVI)のメチルチオ誘導体は新規である。それらは、

d) 式(II)

【0302】

【化64】



20

【0303】

[式中、

R^1 、 R^2 、X及びnは上記で示した意味を有する]

のチオールをメチル化剤（例えばヨードメタン）と、適宜希釈剤（例えばアセトニトリル）の存在下及び適宜酸結合剤（例えば炭酸カリウム）の存在下で反応させる

ことにより製造することができる。

【0304】

式(II)のチオールは、本発明に従う方法(A)の記述と関連してすでに記載されている。

30

【0305】

式(VIII)は、本発明に従う方法(E)を行なうために出発材料として必要なアミンの一般的定義を与えている。この式において、Z及び R^9 は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0306】

式(VIII)のアミンは既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる。

40

【0307】

本発明に従う方法(E)を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；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-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；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、メチルtert-ブチルエーテル、メチルtert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン又はアニソール；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチル；スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシド；あるいはスルホン類、例えばスルホランを用いるのが

50

好ましい。ニトリル類、アミド類又はスルホキシド類を用いるのが特に好ましく、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジメチルスルホキシドが特別に好ましい。

【0308】

本発明に従う方法（E）を行なうために適した塩基は、それぞれの場合にそのような反応に通例であるすべての無機及び有機塩基である。アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウムあるいはまた水酸化アンモニウム、アルカリ金属水素化物、例えば水素化ナトリウム、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属酢酸塩、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムならびにまた第3級アミン類、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N，N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N，N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン（DABCO）、ジアザビシクロノネン（DBN）又はジアザビシクロウンデセン（DBU）を用いるのが好ましい。アルカリ金属炭酸塩もしくは水素化物を用いるのが特に好ましく、炭酸カリウム又は水素化ナトリウムが特別に好ましい。

10

【0309】

本発明に従う方法（E）を行なう場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は-20℃～200℃、好ましくは0℃～150℃、特別に好ましくは20℃～100℃の温度で行なわれる。

20

【0310】

本発明に従う方法（E）を行なう場合、一般に式（VII）の化合物のモル当たり1モル又はわずかに過剰の式（VIII）の化合物及び0.1～5モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

方法（F）

本発明に従う方法（F）を行なうために出発材料として必要な式（VII）のメチルスルホニルピリミジンは、方法（E）の説明と関連してすでに記載されている。

30

【0311】

式（IX）は本発明に従う方法（F）を行なうために出発材料として必要なヒドロキシル化合物の一般的定義を与えている。この式において、Zは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0312】

式（IX）のヒドロキシル化合物は既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる。

【0313】

本発明に従う方法（F）を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；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-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチル；スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシド；あるいはスルホン類、例えばスルホランを用いるのが好ましい。ニトリル類、アミド類又はスルホキシド類を用いるのが特に好ましく、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド又はジメチルスルホキシドが特別に好ましい。

40

【0314】

本発明に従う方法（F）を行なうために適した塩基は、それぞれの場合にそのような反応

50

に通例であるすべての無機及び有機塩基である。アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウムあるいはまた水酸化アンモニウム、アルカリ金属水素化物、例えば水素化ナトリウム、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属酢酸塩、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムならびにまた第3級アミン類、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N，N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N，N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビスクロオクタン（DABCO）、ジアザビスクロノネン（DBN）又はジアザビスクロウンデセン（DBU）を用いるのが好ましい。アルカリ金属炭酸塩もしくは水素化物を用いるのが特に好ましく、炭酸カリウム又は水素化ナトリウムが特別に好ましい。

10

【0315】

本発明に従う方法（F）を行なう場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は -20°C ～ 200°C 、好ましくは 0°C ～ 150°C 、特に好ましくは 20°C ～ 100°C の温度で行なわれる。

【0316】

本発明に従う方法（F）を行なう場合、一般に式（VII）の化合物のモル当たり1モル又はわずかに過剰の式（IX）の化合物及び0.1～5モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

20

方法（G）

本発明に従う方法（G）を行なうために出発材料として必要な式（X）及び（XI）のピリジン誘導体は、方法（A）の説明と関連してすでに記載されている。

【0317】

式（XI）は、本発明に従う方法（G）を行なうために出発材料として必要なアミジンの一般的定義を与えている。この式において、Zは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

30

【0318】

式（XI）のアミジンは既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる。

【0319】

本発明に従う方法（G）を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常のプロトン性溶媒である。水又はアルコール類、例えばメタノール、エタノール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチルを用いるのが好ましい。水又はアルコール類を用いるのが特に好ましく、メタノール又はエタノールが特別に好ましい。

40

【0320】

本発明に従う方法（G）を行なうために適した塩基は、それぞれの場合にそのような反応に通例であるすべての無機及び有機塩基である。アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウム又は水酸化アンモニウム、アルカリ金属水素化物、例えば水素化ナトリウム、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属酢酸塩、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、アルカリ金属アルコキシド類、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドを用いるのが好ましい。アルカリ金属アルコキシド類を用いるのが特に好ましく、ナトリウムメトキシドが特別に好ましい。

50

【0321】

本発明に従う方法（G）を行なう場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は -20°C ～ 200°C 、好ましくは 0°C ～ 150°C 、特に好ましくは 20°C ～ 100°C の温度で行なわれる。

【0322】

本発明に従う方法（G）を行なう場合、一般に式（X）または（X I）の化合物のモル当たり1モル又はわずかに過剰の式（X I I）の化合物及び0.1～5モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

10

方法（H）

式（I-k）は、本発明に従う方法（H）を行なうために出発材料として必要なピリジルピリミジンの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X、n、Z及びAは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 Y^2 は好ましくは直接結合、硫黄、酸素又は NR^9 を示す。

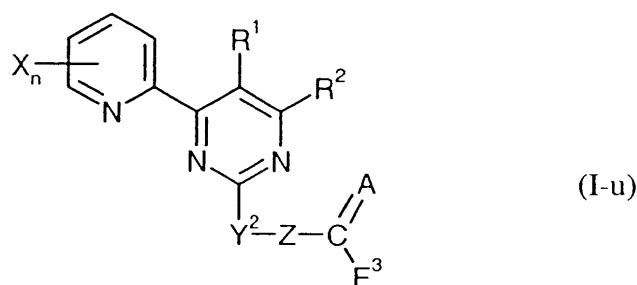
【0323】

式（I-k）のピリジルピリミジンは同様に本発明に従う化合物であり；それらは例えばe）式（I-u）

20

【0324】

【化65】



30

【0325】

[式中、

R^1 、 R^2 、X、n、 Y^2 、A及び E^3 は上記で示した意味を有する]

のエステルを、適宜希釈剤（例えばメタノール）の存在下で塩基（例えば水酸化ナトリウム）を用いて処理する

ことにより製造することができる。

【0326】

式（I-u）のピリジルピリミジンも本発明の主題の一部を成し、方法（A）又は（B）により製造することができる。

40

【0327】

式（X I I I）は、本発明に従う方法（H）を行なうために出発材料として必要なヒドロキシドの一般的定義を与えている。この式において、Mは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0328】

式（X I I I）のヒドロキシドは既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる。

【0329】

本発明に従う方法（H）を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常

50

のプロトン性溶媒である。水又はアルコール類、例えばメタノール、エタノール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、*n*-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリルを用いるのが好ましい。水又はアルコール類を用いるのが特に好ましい。

【0330】

本発明に従う方法（H）を行なう場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は0℃～200℃、好ましくは0℃～150℃、特別に好ましくは20℃～100℃の温度で行なわれる。

【0331】

本発明に従う方法（H）を行なう場合、一般に式（I-k）の化合物のモル当たり1モル又はわずかに過剰の式（X I I I）の化合物が用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

10

方法（J）

式（X I V）は、本発明に従う方法（J）を行なうために出発材料として必要なニトリルの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X、*n*、Y及びZは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

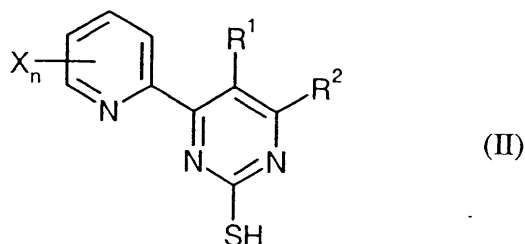
20

【0332】

式（X I V）のニトリルは新規である。それらは
f) 式（I I）

【0333】

【化66】



30

【0334】

[式中、
 R^1 、 R^2 、X及び*n*は上記で示した意味を有する]
のチオールを式（X V I I）
 $C1-Z-CN$ (X V I I)

[式中、
Zは上記で示した意味を有する]

40

の塩素化ニトリルと、適宜希釈剤（例えばトルエン）の存在下及び適宜酸結合剤（例えば水酸化ナトリウム）の存在下で反応させることにより製造することができる。

【0335】

方法（f）を行なうために出発材料として必要な式（I I）の化合物は、本発明に従う方法（A）の記述と関連してすでに記載されている。

【0336】

式（X V I I）は、方法（f）を行なうために出発材料として必要な塩素化ニトリルの一般的定義を与えている。この式において、Zは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい

50

、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0337】

式(XVII)の塩素化ニトリルは既知である。

【0338】

本発明に従う方法(J)を行なうために必要なトリアルキル錫アジドは既知である。トリメチル錫アジド又はトリ(n-ブチル)錫アジドを用いるのが好ましい。

【0339】

本発明に従う方法(J)を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。場合によりハロゲン化されていることができる脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素、例えば石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン又はトリクロロエタン；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、メチルtert-ブチルエーテル、メチルtert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン又はアニソール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；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-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチル；スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシド；あるいはスルホン類、例えばスルホランを用いるのが好ましい。トルエンを用いるのが特に好ましい。

10

20

【0340】

本発明に従う方法(J)を行なう場合、一般に式(XIV)の化合物のモル当たり1モル又はわずかに過剰のトリアルキル錫アジドが用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

方法(K)

式(I-n)は、本発明に従う方法(K)を行なうために出発材料として必要なピリジルピリミジンの一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X、n及びZは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式(I)の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 Y^2 は好ましくは直接結合、硫黄、酸素又は NR^9 を示す。

30

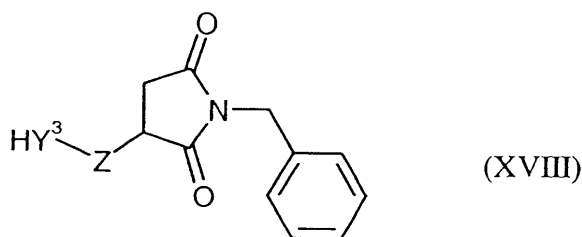
【0341】

式(I-n)のピリジルピリミジンは新規である。それらは

g) 式(XVII)

【0342】

【化67】



40

【0343】

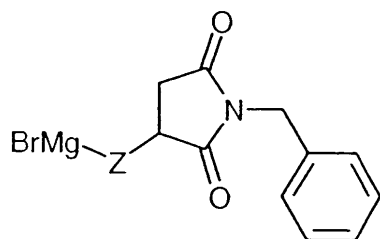
[式中、

Zは上記で示した意味を有し、

Y^3 は酸素、硫黄又は $-NR^9-$ を示し、ここで R^9 は上記で示した意味を有する]

50

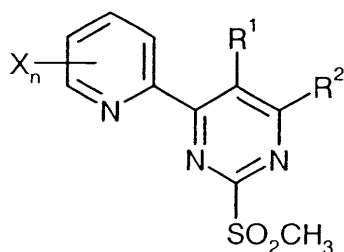
の化合物
あるいは
式 (X I X)
【 0 3 4 4 】
【 化 6 8 】



(XIX)

10

【 0 3 4 5 】
[式中、
Z は上記で示した意味を有する]
のグリニャル試薬を式 (V I I)
【 0 3 4 6 】
【 化 6 9 】



(VII)

20

【 0 3 4 7 】
[式中、
R¹、R²、X 及び n は上記で示した意味を有する]
のメチルスルホニルピリミジンと、適宜希釈剤（例えばテトラヒドロフラン）の存在下及び適宜酸結合剤（例えばトリエチルアミン）の存在下で反応させることにより製造することができる。

30

【 0 3 4 8 】
式 (X V I I I) 及び (X I X) は、方法 (g) を行なうために出発材料として必要な化合物の一般的定義を与えている。これらの式において、Z は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【 0 3 4 9 】
式 (X V I I I) の化合物及び式 (X I X) のグリニャル試薬は、既知の方法により製造することができる。

40

【 0 3 5 0 】
式 (V I I) の化合物は、方法 (E) の記述と関連して上記にすでに記載されている。

【 0 3 5 1 】
本発明に従う方法 (K) を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；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-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；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、メチル t e r t -ブチルエーテル、メチル t e r t -アミルエー

50

テル、ジオキサソ、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタン又はアニソール；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチル；スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシド；あるいはスルホン類、例えばスルホランを用いるのが好ましい。ニトリル類、アミド類又はスルホキシド類を用いるのが特に好ましく、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジメチルスルホキシドが特別に好ましい。

【0352】

本発明に従う方法（K）を行なうために適した触媒は、水素化反応に適したすべての触媒である。パラジウム又は白金触媒を用いるのが好ましく、パラジウム／活性炭を用いるのが特に好ましい。

10

【0353】

本発明に従う方法（K）を行なう場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は -20°C ～ 200°C 、好ましくは 0°C ～ 150°C の温度で行なわれる。

【0354】

本発明に従う方法（K）を行なう場合、一般に式（I-n）の化合物のモル当たり1～10モル％の触媒が用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

20

方法（L）

式（XV）は、本発明に従う方法（L）を行なうために出発材料として必要なケト化合物の一般的定義を与えている。この式において、 R^1 、 R^2 、X、n及びZは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式（I）の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。 Y^2 は好ましくは直接結合、硫黄、酸素又は NR^9 を示す。

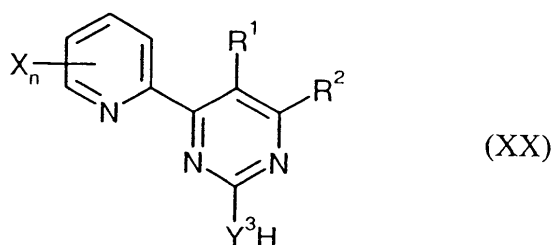
【0355】

式（XV）のケト化合物は新規である。それらは

h) 式（XX）

【0356】

【化70】



【0357】

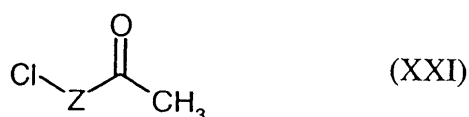
[式中、

R^1 、 R^2 、X、n及び Y^3 は上記で示した意味を有する]

の化合物を式（XXI）

【0358】

【化71】



40

50

【0359】

〔式中、

Zは上記で示した意味を有する〕

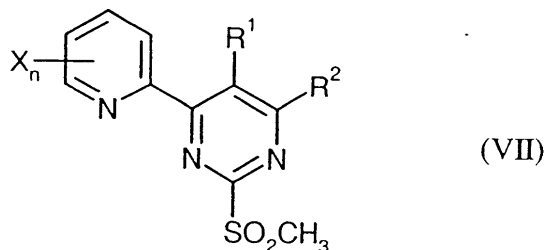
のメチルトケンと、適宜希釈剤（例えばテトラヒドロフラン）の存在下及び適宜酸結合剤（例えばトリエチルアミン）の存在下で反応させるか、

あるいは

i) 式 (VII)

【0360】

【化72】



10

【0361】

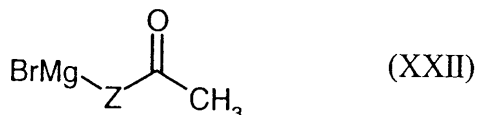
〔式中、

R¹、R²、X及びnは上記で示した意味を有する〕

のメチルスルホニルピリミジンに式 (XXI)

【0362】

【化73】



20

【0363】

〔式中、

Zは上記で示した意味を有する〕

のグリニャル試薬と、適宜希釈剤（例えばテトラヒドロフラン）の存在下及び適宜酸結合剤（例えばトリエチルアミン）の存在下で反応させることにより製造することができる。

30

【0364】

式 (XX) は、方法 (h) を行なうために出発材料として必要な化合物の一般的定義を与えている。この式において、R¹、R²、X及びnは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。Y³ は好ましくは硫黄、酸素又はNR⁹を示す。

【0365】

式 (XX) の化合物のいくつかは既知であり、及び／又は既知の方法により製造することができる。

40

【0366】

式 (XXI) は、方法 (h) を行なうために出発材料として必要なメチルケトンの一般的定義を与えている。この式において、Zは好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0367】

式 (XXI) のメチルケトンは既知である。

【0368】

50

方法 (i) を行なうために出発材料として必要な式 (V I I) のメチルスルホニルピリミジンは、方法 (E) の説明と関連してすでに記載されている。

【0369】

式 (X X I I) は、方法 (i) を行なうために出発材料として必要なグリニヤル試薬の一般的定義を与えている。この式において、Z は好ましくは、特に好ましくは及び特別に好ましくは、本発明に従う式 (I) の化合物の記述と関連して、これらの基として好ましい、特に好ましいなどとしてすでに挙げられている意味を有する。

【0370】

式 (X X I I) のグリニヤル試薬は既知である。

【0371】

本発明に従う方法 (L) を行なうために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。場合によりハロゲン化されていることができる脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素、例えば石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン又はトリクロロエタン；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、メチル tert-ブチルエーテル、メチル tert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタン又はアニソール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはイソブチロニトリル又はベンゾニトリル；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-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチル；スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシド；あるいはスルホン類、例えばスルホランを用いるのが好ましい。

【0372】

本発明に従う方法 (L) を行なう場合、一般に式 (X V) の化合物のモル当たり1モル又はわずかに過剰の炭酸アンモニウム及び1モル又はわずかに過剰のシアン化カリウムが用いられる。しかしながら反応成分を別の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行なわれる。一般に反応混合物を濃縮し、抽出し、有機相を洗浄し、乾燥し、濾過し、濃縮する。必要なら通常の方法、例えばクロマトグラフィー又は再結晶を用い、残留物からまだ存在し得る不純物を除去する。

【0373】

本発明に従うすべての方法は一般に大気圧下で行なわれる。しかしながら、それぞれの場合に加圧又は減圧下で反応させることも可能である。

【0374】

本発明に従う活性化合物は、農業において、森林において、保存製品及び材料の保護において、ならびに衛生部門において遭遇する有害動物、特に昆虫、クモ形類及び線虫類の抑制に適しており、且つ優れた植物許容性及び好ましい温血動物に対する毒性を有している。それらを植物保護剤として好適に用いることができる。それらは正常に感受性の及び耐性の種に対して、ならびに発育のすべてのもしくはいくつかの段階に対して活性である。

上記の有害生物には：

等脚類 (Isopoda) の目から、例えばオニスクス・アセルス (Oniscus asellus)、アルマジリジウム・ブルガレ (Armadillidium vulgare) 及びポルセリオ・スカベル (Porcellio scaber)、

倍脚類 (Diplopoda) の目から、例えばプラニウルス・グルラツス (Blaniulus guttulatus)、

唇脚類 (Chilopoda) の目から、例えばゲオフィルス・カルポファグス (Geophilus carpophagus) 及びスクチゲラ種 (Scutigera spec.)、

結合類 (Symphyla) の目から、例えばスクチゲレラ・イマクラタ (Scutigerebella immaculata)、

10

20

30

40

50

シミ類 (*Thysanura*) の目から、例えばレピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)、
 トビムシ類 (*Collembola*) の目から、例えばオニチウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)、
 直翅類 (*Orthoptera*) の目から、例えばアケタ・ドメスチクス (*Achetia domesticus*)、グリロタルパ種 (*Gryllotalpa* spp.)、ロ
 クスタ・ミグラトリア・ミグラトリオイデス (*Locusta migratoria migratpropodes*)、メラノプルス種 (*Melanoplus* spp.)
 及びシストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*)、
 ゴキブリ類 (*Blattaria*) の目から、例えばブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ロイコファエア・マデラエ (*Leucophaea made* 10
rae) 及びブラテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、
 ハサミムシ類 (*Dermaptera*) の目から、例えばフォルフィクラ・アウリクラリ
 ア (*Forficula auricularia*)、
 シロアリ類 (*Isoptera*) の目から、例えばレチクリテルメス種 (*Reticulitermes* spp.)、
 シラミ類 (*Phthiraptera*) の目から、例えばペディクルス・ヒューマヌス
 ・コルボリス (*pediculus humanus corporis*)、ハエマトピ
 ヌス種 (*Haematopinus* spp.)、リノグナツス種 (*Linognathus* spp.)、トリコデクテス種 (*Trichodectes* spp.) 及びダマ
 リニア種 (*Damalinia* spp.)、
 アザミウマ類 (*Thysanoptera*) の目から、例えばヘルシノツリプス・フェモ
 ラリス (*Hercinothrips femoralis*)、ツリプス・タバチ (*Thrips tabaci*)、ツリプス・パルミ (*Thrips palmi*) 及びフラン
 クリニエラ・アクシデンタリス (*Frankliniella accidentalis*)、
 異翅類 (*Heteroptera*) の目から、例えばエウリガステル種 (*Euriga* *ster* spp.)、ジスデルクス・インテルメジウス (*Dysdercus inter* 30
medius)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、シメク
 ス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、ロドニウス・プロリクス
 (*Rhodnius prolixus*) 及びトリアトマ種 (*Triatoma* spp.)、
 同翅類 (*Homoptera*) の目から、例えばアレウロデス・ブラシカエ (*Aleurodes brassicae*)、ベミシア・タバチ (*Bemisia tabaci*)
 、トリアレウロデス・バポラリオルム (*Trialeurodes vaporariorum*)、アフイス・ゴシピイ (*Aphis gossypii*)、ブレビコリネ・ブラ
 シカエ (*Bravicornyne brassicae*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、アフイス・ファバエ (*Aphis fabae*)
 、アフイス・ポミ (*Aphis pomi*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus* 40
arundinis)、フィロクセラ・バスタツリクス (*Phylloxera vastatrix*)、ペムフィグス種 (*Pemphigus* spp.)、マクロシフム・ア
 ベナエ (*Macrosiphus avenae*)、ミズス種 (*Myzus* spp.)
 、フォロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、エンポアスカ種 (*Empoasca* spp.)
 、エウセルリス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、ネフォテティク
 ス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、レカニウム・
 コルニ (*Lecanium corni*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、ラオデルファクス・ストリアテルス (*Laodelphax stri* 50

atellus)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、
 アオニジエラ・アウランチイ (*Aonidiella aurantii*)、アスピジ
 オツス・ヘデラエ (*Aspidiotus hederiae*)、シュードコックス種 (*Pseudococcus* spp.) 及びプシラ種 (*Psylla* spp.)、
 鱗翅類 (*Lepidoptera*) の目から、例えばベクチノフォラ・ゴシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ケイマトビア・ブルマタ (*Cheimatobia brumata*)、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、ブルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*)、マラコソ
 マ・ネウスツリア (*Malacosoma neustria*)、エウプロクチス・クリ
 ソルホエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、リマンツリア種 (*Lymantria* spp.)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、アグロチス種 (*Agrotis* spp.)、エウクソア種
 (*Euxoa* spp.)、フェルチア種 (*Feltia* spp.)、エアリアス・イン
 スラナ (*Earias insulana*)、ヘリオチス種 (*Heliothis* spp.)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、パノリス
 ・フラメア (*Panolis flammea*)、スポドプテラ種 (*Spodoptera* spp.)、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、カルポカ
 ブサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、ピエリス種 (*Pieris* spp.)、チロ種 (*Chilo* spp.)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyr
 austa nubilalis*)、エフェスチア・クエニエラ (*Ephestia kuehniella*)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、チネオラ・ビセリラレ (*Tineola bisselliella*)、チネア・ペ
 リオネラ (*Tinea pellionella*)、ホフマノフィラ・シュードスプレテ
 ラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、カコエシア・ポ
 ダナ (*Cacoecia podana*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、コリストネウラ・フミフェラナ (*Choristoneura fum
 iferana*)、クリシア・アンビグエラ (*Clysia ambiguella*)、
 ホモナ・マグナニマ (*Homona magnanima*)、トルトリクス・ビリダナ (*Tortrix viridana*)、クナファロセルス種 (*Cnaphalocerus* spp.) 及びオウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、
 甲虫類 (*Coleoptera*) の目から、例えばアノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dom
 inica*)、ブルキジウス・オブテクツス (*Bruchidius obtectus*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、ヒロツルベス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、アゲ
 ラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、レプチノタルサ・デセムリネア
 タ (*Leptinotarsa decemlineata*)、ファエドン・コクレアリ
 アエ (*Phaedon cochleariae*)、ディアブロチカ種 (*Diabrotica* spp.)、プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chry
 socephala*)、エピラクナ・バリベチス (*Epilachna varivestis*)、アトマリア種 (*Atomaria* spp.)、オリザエフィルス・スリナネ
 ンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、アントノムス種 (*Anthonomus* spp.)、シトフィルス種 (*Sitophilus* spp.)、
 オチオリンクス・スルカツス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、セウトリ
 ンクス・アシミリス (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ヒペラ
 ・ポストカ (*Hypera postica*)、デルメステス種 (*Dermestes*

spp.)、トロゴデルマ種 (Trogoderma spp.)、アントレヌス種 (Anthrenus spp.)、アタゲヌス種 (Attagenus spp.)、リクツス種 (Lycetus spp.)、メリゲテス・アエネウス (Meligethes aeneus)、プチヌス種 (Ptinus spp.)、ニプツス・ホロレウクス (Niptus hololeucus)、ギビウム・プシロイデス (Gibbium psylloides)、トリボリウム種 (Tribolium spp.)、テネブリオ・モリトル (Tenebrio molitor)、アグリオテス種 (Agriotes spp.)、コノデルス種 (Conoderus spp.)、メロロンタ・メロロンタ (Melolontha melolontha)、アンフィマロン・ソルシチチアリス (Amphimallon solstitialis)、コステリツラ・ゼアランジカ (Costelytra zealandica) 及びリゾルホプツルス・オリゾフィルス (Lissorhopterus oryzophilus)、

膜翅類 (Hymenoptera) の目から、例えばジプリオン種 (Diprion spp.)、ホプロカンパ種 (Hopllocampa spp.)、ラシウス種 (Lasius spp.)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis) 及びベスパ種 (Vespa spp.)、

双翅類 (Diptera) の目から、例えばアエデス種 (Aedes spp.)、アノフェレス種 (Anopheles spp.)、クレクス種 (Culex spp.)、ドロソフィラ・メラノガステル (Drosophila melanogaster)、ムスカ種 (Musca spp.)、ファニア種 (Fannia spp.)、カリフォラ・エリスロセファラ (Calliphora erythrocephala)、ルシリア種 (Lucilia spp.)、クリソミア種 (Chrysomya spp.)、クテレブラ種 (Cuterebra spp.)、ガストロフィルス種 (Gastrophilus spp.)、ヒポボスカ種 (Hypobosca spp.)、ストモクシス種 (Stomoxys spp.)、オエスツルス種 (Oestrus spp.)、ヒポデルマ種 (Hypoderma spp.)、タバヌス種 (Tabanus spp.)、タニア種 (Tannia spp.)、ビビオ・ホルツラヌス (Bibio hortulanus)、オシネラ・フリト (Oscinella frit)、フォルビア種 (Phorbia spp.)、ペゴミア・ヒオシアミ (Pegomyia hyoscyami)、セラチチス・カピタタ (Ceratitis capitata)、ダクス・オレアエ (Dacus oleae)、チプラ・パルドサ (Tipula paludosa)、ヒレミイア種 (Hylemyia spp.) 及びリリオミザ種 (Liriomyza spp.)、

ノミ類 (Siphonaptera) の目から、例えばキセノプシラ・ケオピス (Xenopsylla cheopis) 及びセラトフィルス種 (Ceratophyllus spp.)、

クモ形類 (Arachnida) の綱から、例えばスコルピオ・マウルス (Scorpio maurus)、ラトロデクツス・マクタンズ (Lagrodectus mactans)、アカルス・シロ (Acarus siro)、アルガス種 (Argas spp.)、オルニトドロス種 (Ornithodoros spp.)、デルマニスス・ガリナエ (Dermanyssus gallinae)、エリオフィエス・リビス (Eriophyes ribis)、フィロコプツルタ・オレイボラ (Phyllocoptuta oleivora)、ボオフィルス種 (Boophylus spp.)、リピセファルス種 (Rhipicephalus spp.)、アンブリオマ種 (Amblyomma spp.)、ヒアロマ種 (Hyalomma spp.)、イクソデス種 (Ixodes spp.)、プソロプテス種 (Psoroptes spp.)、コリオプテス種 (Chorioptes spp.)、サルコプテス種 (Sarcoptes spp.)、タルソネムス種 (Tarsonemus spp.)、ブリオビア・プラエチオサ (Bryobia praetiosa)、パノニクス種 (Panonychus spp.)、テトラニクス種 (Tetranychus spp.)、ヘミタルソネム

ス種 (*Hemitarsonemus* spp.) 及びブレビパルプス種 (*Brevipalpus* spp.)

が含まれる。

【0375】

植物－寄生性線虫類には、例えばプラチレンクス種 (*Pratylenchus* spp.)、ラドフォルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、チレンクルス・セミペネツランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、ヘテロデラ種 (*Heterodera* spp.)、グロボデラ種 (*Globodera* spp.)、メロイドジネ種 (*Meloidogyne* spp.)、アフエレンコイデス種 (*Aphelenchoides* spp.)、ロンギドルス種 (*Longidorus* spp.)、クシフィネマ種 (*Xiphinema* spp.)、トリコドルス種 (*Trichodorus* spp.) 及びブルサフェレンクス種 (*Bursaphelenchus* spp.) が含まれる。

【0376】

特に本発明に従う式 (I) の化合物は毛虫類、甲虫類の幼虫、ハダニ、アブラムシ及びハモグリバエ科 (leaf-mining flies) に対して優れた活性を有する。

【0377】

適宜、ある濃度又は適用率において、本発明に従う化合物を除草剤又は殺微生物剤 (microbicides)、例えば殺菌・殺カビ剤 (fungicides)、抗真菌剤 (antimycotics) 及び殺バクテリア剤 (bactericides) として用いることもできる。適宜それらを他の活性化化合物の合成のために中間体又は前駆体として用いることもできる。

【0378】

本発明に従い、植物全体及び植物の一部を処理することができる。本明細書に関し、植物は、望まれている及び望まれていない野生植物もしくは作物植物 (天然に存在する作物植物を含む) のようなすべての植物及び植物集団を意味すると理解されるべきである。作物植物は通常の植物育種及び最適化法により、あるいは生物工学的方法及び組換え法により、あるいはこれらの方法の組み合わせにより得られ得る植物であることができ、形質転換植物を含み且つ植物育種者の権利により保護され得るか、又はされ得ない植物品種を含む。植物の一部は地上及び地下の植物のすべての部分及び器官、例えば苗条、葉、花及び根を意味すると理解されるべきであり、挙げることができる例は葉、針、茎、幹、花、子実体、果実、種子、根、塊茎及び根茎である。植物の一部は収穫された材料ならびに栄養及び有性増殖材料、例えば切穂、塊茎、根茎、分枝及び種子も含む。

【0379】

活性化化合物を用いる本発明に従う植物及び植物の一部の処理は通常の処理法により、例えば浸漬、スプレー噴霧、蒸発、噴霧、散布、はけ塗りにより、ならびに増殖材料の場合、特に種子の場合にはまた1つもしくはそれより多い被覆の適用によって、直接又は回り、環境もしくは保存空間に化合物を作用させることにより行われる。

【0380】

本発明に従う活性化化合物を通常の調剤、例えば溶液、乳剤、水和性粉剤、懸濁剤、粉剤、微粉剤、ペースト剤、可溶性粉剤、顆粒剤、懸濁剤－乳剤濃厚液、活性化化合物が含浸された天然及び合成材料ならびにポリマー性物質中にマイクロカプセル封入された形態に転換することができる。

【0381】

これらの調剤は既知の方法で、例えば本発明に従う活性化化合物を伸展剤、すなわち液体溶媒及び／又は固体担体と、場合により界面活性剤、すなわち乳化剤及び／又は分散剤及び／又は発泡剤を使用して混合することにより調製される。

【0382】

用いられる伸展剤が水の場合、例えば補助溶媒として有機溶媒を用いることもできる。本

質的に適した液体溶媒は：芳香族化合物、例えばキシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物及び塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサン又はパラフィン類、例えば石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えばブタノール又はグリコールならびにまたそれら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又はシクロヘキサノン、強力に極性の溶媒、例えばジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシドならびにまた水である。

【0383】

適した固体担体は：

例えばアンモニウム塩及びカオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モントモリロナイト又はケイソウ土のような粉碎された天然鉱石ならびに高分散シリカ、アルミナ及びケイ酸塩のような粉碎された合成鉱石であり；顆粒剤のための適した固体担体は：例えば方解石、大理石、軽石、海泡石及び白雲石のような粉碎されて分別された天然岩石ならびにまた無機及び有機粉末の合成顆粒ならびにおが屑、ココヤシの殻、とうもろこしの穂軸及びタバコの茎のような有機材料の顆粒であり；

適した乳化剤及び／又は発泡剤は：例えば非イ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類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルサルフェート、アリアルスルホネートならびにまたタンパク質加水分解産物であり；

適した分散剤は：例えばリグノサルファイト廃液及びメチルセルロースである。

【0384】

粘着付与剤、例えばカルボキシメチルセルロースならびに粉末、顆粒もしくはラテックスの形態の天然及び合成ポリマー、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニルならびにセファリン及びレシチンのような天然リン脂質及び合成リン脂質を調剤中で用いることができる。他の添加剤は鉱油及び植物油であることができる。

【0385】

着色料、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルーならびにアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料のような有機染料ならびに鉄、マンガン、ほう素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩のような微量栄養素を使用することができる。

【0386】

調剤は一般に0.1～95重量%の活性化合物、好ましくは0.5～90%の活性化合物を含む。

【0387】

本発明に従う活性化合物はその商業的に入手可能な調剤において、及びこれらの調剤から調製される使用形態において、他の活性化合物、例えば殺虫剤 (insecticides)、誘引剤、不妊化剤、殺バクテリア剤、殺ダニ剤 (acaricides)、殺線虫剤 (nematicides)、殺菌・殺カビ剤、成長調節物質又は除草剤との混合物として存在することができる。殺虫剤には中でも例えばリン酸エステル類、カルバメート類、カルボキシレート類、塩素化炭化水素、フェニルウレア類及び微生物により生産される物質が含まれる。

【0388】

特に適した共成分は、例えば以下の化合物である：

殺菌・殺カビ剤：

アルジモルフ (aldimorph)、アンプロピルフォス (ampropylfos)、アンプロピルフォスーカリウム、アンドプリム (andoprime)、アニラジン (anilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アズキシストロビン (azoxystrobin)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ベンザマクリル (benzamacril)、ベンザマクリルーイソ

10

20

30

40

50

ブチル、ビアラフォス (bialaphos)、ビナパクリル (binapacryl)、
 ビフェニル (biphenyl)、ビテルタノル (biterتانول)、プラスチック
 ジン-S (blasticidin-S)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、
 ブピリメート (bupirimate)、ブチオベート (butthiobate)、
 カルシウムポリスルフィド、カプシマイシン (capsimycin)、カプタフォル (captafol)、
 カプタン (captan)、カルベンダジン (carbendazim)、カルボキシ (carboxin)、カルボン (carvon)、キノメチオネ
 ート (quinomethionate)、クロベンチアゾン (chlobenthiazine)、クロルフェナゾール (chlorfenazole)、クロロネブ (chl
 oroneb)、クロロピクリン (chloropicrin)、クロロタロニル (chl
 orothalonil)、クロゾリネート (chlozolinatate)、クロジラ
 コン (clozylacon)、クフラネブ (cufraneb)、シモキサニル (cy
 moxanil)、シプロコナゾール (ciproconazole)、シプロジニル (cy
 prodinil)、シプロフラム (ciprofuram)、
 デバカルブ (debacarb)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジク
 ロブトラゾール (diclobutrazole)、ジクロフルアニド (dicloflu
 uanid)、ジクロメジン (diclomezine)、ジクロラン (dicloran
 n)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジフェノコナゾール (di
 fenconazole)、ジメチリモル (dimethirimol)、ジメトモル
 フ (dimethomorph)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジニ
 コナゾール-M、ジノカプ (dinocap)、ジフェニルアミン、ジピリチオン (di
 pyrithione)、ジタリンフォス (ditalimfos)、ジチアノン (di
 thianon)、ドデモルフ (dodemorph)、ドジン (dodine)、ドラ
 ゴキソロン (drazoxolon)、
 エジフェンフォス (edifenphos)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、
 エタコナゾール (etaconazole)、エチリモル (ethirimol)、
 エツリジアゾール (etridiazole)、
 ファモキサドン (famoxadon)、フェナパニル (fenapanil)、フェナ
 リモル (fenarimol)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、
 フェンフラム (fenfuram)、フェニトロパン (fenitropan)、フェン
 ピクロニル (fenpiclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、
 フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンチンアセテート (fen
 tin acetate)、フェンチンヒドロキシド (fentin hydroxid
 e)、フェルバム (ferbam)、フェリムゾン (ferimzone)、フルアジナ
 ム (fluazinam)、フルメトベル (flumetover)、フルオロミド (f
 luoromide)、フルクインコナゾール (fluquinconazole)、フ
 ルルプリミドル (flurprimidol)、フルシラゾール (flusilazole)、
 フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolani
 l)、フルツリアフォル (flutriafol)、フォルペト (folpet)、
 フォセチルーアルミニウム (fosetyl-aluminium)、フォセチルーナト
 リウム、フタリド (fthalide)、フベリダゾール (fuberidazole)、
 フララキシル (furalaxyl)、フラメツピル (furametpyr)、フル
 カルボニル (furcarbonil)、フルコナゾール (furconazole)、
 フルコナゾール-シス、フルメシクロクス (furmecyclox)、グアザチン (g
 uazatine)、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール (hexaconazo
 le)、ヒメキサゾール (hymexazole)、
 イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)
)、イミノクタジン (iminooctadine)、イミノクタジン アルベシレート、
 イミノクタジン トリアセテート、イオドカルブ (iodocarb)、イブコナゾール

(ipconazole)、イプロベンフォス(iprobenfos)(IBP)、イ
プロジオン(iprodione)、イルママイシン(irumamycin)、イソプ
ロチオラン(isoprothiolane)、イソバレジオン(isovaledio
ne)、

カスガマイシン(kasugamycin)、クレソキシムーメチル(kresoxim
-methyl)、銅調剤、例えば：水酸化銅、ナフテン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、
酸化銅、オキシニール銅及びボルドー混合物(Bordeaux mixture)、
マンコッパー(mancopper)、マンコゼブ(mancozeb)、マネブ(ma
neb)、メフェリムゾン(meferimzone)、メパニピリム(mepanip
yrim)、メプロニル(meprotil)、メタラキシール(metalaxyl)、
メツコナゾール(metconazole)、メタスルホカルブ(methasulfo
carb)、メトフロキサム(methfuroxam)、メチラム(metiram)
、メトメクラム(metomeclam)、メトスルホバクス(metsulfovax
)、ミルジオマイシン(mildiomycin)、ミクロブタニル(myclobut
anil)、ミクロゾリン(myclozolin)、

ニッケルジメチルジチオカルバメート、ニトロタルーイソプロピル(nitrothal
-isopropyl)、ヌアリモル(nuarimol)、
オフレース(ofurace)、オキサジキシール(oxadixyl)、オキサモカルブ
(oxamocarb)、オキシソリニン酸、オキシカルボキシム(oxycarboxi
m)、オキシフェンチン(oxyfenthin)、

パクロブトラゾール(paclobutrazole)、ペフラゾエート(pefura
zoate)、ペンコナゾール(penconazole)、ペンシクロン(pency
curon)、フォスジフェン(phosdiphen)、ピマリシン(pimaric
in)、ピペラリン(piperalin)、ポリオキシシン(polyoxin)、ポリ
オキシリム(polyoxorim)、プロベナゾール(probenazole)、プロ
クロラツ(prochloraz)、プロシミドン(procymidone)、プロ
パモカルブ(propamocarb)、プロパノシンーナトリウム(propanos
ine-sodium)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロピネ
ブ(propineb)、ピラゾフォス(pyrazophos)、ピリフェノクス(p
yriphenox)、ピリメタニル(pyrimethanil)、ピロクイロン(py
roquilon)、ピロキシフル(pyroxyfur)、

クインコナゾール(quinconazole)、クイントゼン(quintozene
) (PCNB)、

硫黄及び硫黄調剤、

テブコナゾール(tebuconazole)、テクロフタラム(tecloftalam
m)、テクナゼン(tecnazene)、テツシクラシス(tetcyclasis)
、テトラコナゾール(tetraconazole)、チアベンダゾール(thiabe
ndazole)、チシオフエン(thicyofen)、チフルザミド(thiflu
zamide)、チオファネートーメチル(thiophanate-methyl)、
チラム(thiram)、チオキシミド(tioxymid)、トルクロフォスーメチル
(tolclofos-methyl)、トリルフルアニド(tolylfluani
d)、トリアジメフォン(triadimefon)、トリアジメノル(triadime
nol)、トリアツブチル(triazbutyl)、トリアゾキシド(triazox
ide)、トリクラミド(trichlamide)、トリシクラゾール(tricyc
lazole)、トリデモルフ(tridemorph)、トリフルミゾール(trif
lumizole)、トリフォリン(triforine)、トリチコナゾール(tri
ticonazole)、

ユニコナゾール(uniconazole)、

バリダマイシン A(validamycin A)、ビンクロゾリン(vincloz
olin)、ビニコナゾール(viniconazole)、

10

20

30

40

50

ザリラミド (z a r i l a m i d e)、ジネブ (z i n e b)、ジラム (z i r a m) ならびにまた

D a g g e r G、OK-8705、OK-8801、
 α - (1, 1-ジメチルエチル) - β - (2-フェノキシエチル) - 1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-エタノール、
 α - (2, 4-ジクロロフェニル) - β - フルオロ- β - プロピル-1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-エタノール、
 α - (2, 4-ジクロロフェニル) - β - メトキシ- α - メチル-1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-エタノール、
 α - (5-メチル-1, 3-ジオキサ-5-イル) - β - [[4- (トリフルオロメチル) - フェニル] - メチレン] - 1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-エタノール、
 (5RS, 6RS) - 6-ヒドロキシ-2, 2, 7, 7-テトラメチル-5- (1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-イル) - 3-オクタノン、
 (E) - α - (メトキシイミノ) - N-メチル-2-フェノキシ-フェニルアセトアミド
 、
 1-イソプロピル {2-メチル-1- [[1- (4-メチルフェニル) - エチル] -
 アミノ] - カルボニル] - プロピル} - カルバメート、
 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 2- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)
) - エタノン-O- (フェニルメチル) - オキシム、
 1- (2-メチル-1-ナフタレニル) - 1H-ピロール-2, 5-ジオン、
 1- (3, 5-ジクロロフェニル) - 3- (2-プロペニル) - 2, 5-ピロリジンジオ
 ン、
 1- [(ジヨードメチル) - スルホニル] - 4-メチル-ベンゼン、
 1- [[2- (2, 4-ジクロロフェニル) - 1, 3-ジオキサラン-2-イル] - メチ
 ル] - 1H-イミダゾール、
 1- [[2- (4-クロロフェニル) - 3-フェニルオキシラニル] - メチル] - 1H-
 1, 2, 4-トリアゾール、
 1- [1- [2- [(2, 4-ジクロロフェニル) - メトキシ] - フェニル] - エテニル
] - 1H-イミダゾール、
 1-メチル-5-ノニル-2- (フェニルメチル) - 3-ピロリジノール、
 2', 6'-ジブromo-2-メチル-4'-トリフルオロメトキシ-4'-トリフルオロ
 -メチル-1, 3-チアゾール-5-カルボキシアニリド、
 2, 2-ジクロロ-N- [1- (4-クロロフェニル) - エチル] - 1-エチル-3-メ
 チル-シクロプロパンカルボキシアミド、
 2, 6-ジクロロ-5- (メチルチオ) - 4-ピリミジニル-チオシアナート、
 2, 6-ジクロロ-N- (4-トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、
 2, 6-ジクロロ-N- [[4- (トリフルオロメチル) - フェニル] - メチル] - ベン
 ズアミド、
 2- (2, 3, 3-トリヨード-2-プロペニル) - 2H-テトラゾール、
 2- [(1-メチルエチル) - スルホニル] - 5- (トリクロロメチル) - 1, 3, 4-
 チアジアゾール、
 2- [[6-デオキシ-4-O- (4-O-メチル- β -D-グリコピラノシル) - α -
 D-グルコピラノシル] - アミノ] - 4-メトキシ-1H-ピロロ [2, 3-d] ピリミ
 ジン-5-カルボニトリル、
 2-アミノブタン、
 2-ブromo-2- (ブromoメチル) - ペンタンジニトリル、
 2-クロロ-N- (2, 3-ジヒドロ-1, 1, 3-トリメチル-1H-インデン-4-
 イル) - 3-ピリジンカルボキシアミド、
 2-クロロ-N- (2, 6-ジメチルフェニル) - N- (イソチオシアナートメチル) -
 アセトアミド、

- 2-フェニルフェノール (OPP)、
 3, 4-ジクロロ-1-[4-(ジフルオロメトキシ)-フェニル]-1H-ピロール-2, 5-ジオン、
 3, 5-ジクロロ-N-[シアノ[(1-メチル-2-プロピニル)-オキシ]-メチル]-ベンズアミド、
 3-(1, 1-ジメチルプロピル-1-オキソ-1H-インデン-2-カルボニトリル、
 3-[2-(4-クロロフェニル)-5-エトキシ-3-イソオキサゾリジニル]-ピリジン、
 4-クロロ-2-シアノ-N, N-ジメチル-5-(4-メチルフェニル)-1H-イミダゾール-1-スルホンアミド、
 4-メチル-テトラゾロ[1, 5-a]キナゾリン-5(4H)-オン、
 8-(1, 1-ジメチルエチル)-N-エチル-N-プロピル-1, 4-ジオキサスピロ[4.5]デカン-2-メタナミン、
 8-ヒドロキシキノリンサルフェート、
 9H-キサンテン-2-[(フェニルアミノ)-カルボニル]-9-カルボン酸ヒドラジド、
 ビス-(1-メチルエチル)-3-メチル-4-[(3-メチルベンゾイル)-オキシ]2, 5-チオフエンジカルボキシレート、
 シス-1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)-シクロヘプタノール、
 シス-4-[3-[4-(1, 1-ジメチルプロピル)-フェニル-2-メチルプロピル]-2, 6-ジメチル-モルホリンヒドロクロリド、
 [(4-クロロフェニル)-アゾ]-シアノ酢酸エチル、
 重炭酸カリウム、
 メタンテトラチオール-ナトリウム塩、
 1-(2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル、
 N-(2, 6-ジメチルフェニル)-N-(5-イソオキサゾリルカルボニル)-DL-アラニン酸メチル、
 N-(クロロアセチル)-N-(2, 6-ジメチルフェニル)-DL-アラニン酸メチル、
 N-(2, 3-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-シクロヘキサンカルボキシアミド、
 N-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-メトキシ-N-(テトラヒドロ-2-オキソ-3-フラニル)-アセトアミド、
 N-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-メトキシ-N-(テトラヒドロ-2-オキソ-3-チエニル)-アセトアミド、
 N-(2-クロロ-4-ニトロフェニル)-4-メチル-3-ニトロ-ベンゼンスルホンアミド、
 N-(4-シクロヘキシルフェニル)-1, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン、
 N-(4-ヘキシルフェニル)-1, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン、
 N-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-2-メトキシ-N-(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)-アセトアミド、
 N-(6-メトキシ-3-ピリジニル)-シクロプロパンカルボキシアミド、
 N-[2, 2, 2-トリクロロ-1-[(クロロアセチル)-アミノ]-エチル]-ベンズアミド、
 N-[3-クロロ-4, 5-ビス-(2-プロピニルオキシ)-フェニル]-N'-メトキシ-メタンイミドアミド、

10

20

30

40

50

N-ホルミル-N-ヒドロキシ-DL-アラニン-ナトリウム塩、
 O, O-ジエチル [2-(ジプロピルアミノ)-2-オキソエチル]-エチルホスホルア
 ミドチオエート、
 O-メチルS-フェニルフェニルプロピルホスホルアミドチオエート、
 S-メチル1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール-7-カルボチオエート、
 スピロ [2H]-1-ベンゾピラン-2, 1' (3'H)-イソベンゾフラン]-3'-
 オン。

殺バクテリア剤：

ブロナポル (bronopol)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ニト
 ラピリン (nitrapyrin)、ニッケルジメチルジチオカルバメート、カスガマイ 10
 シン (kasugamycin)、オクチリノン (octhilinone)、フランカ
 ルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾール (probenazole)、スト
 レプトマイシン (streptomycin)、テクロフタラム (tecloftalam)
 m)、硫酸銅及び他の銅調剤。

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタミプ
 リド (acetamiprid)、アクリナツリン (acrinathrin)、アラニ
 カルブ (alanycarb)、アルジカルブ (aldicarb)、アルドキシカルブ
 (aldoxycarb)、アルファシペルメツリン (alphacypermethr 20
 in)、アルファメツリン (alphamethrin)、アミトラツ (amitraz
)、アベルメクチン (avermectin)、AZ 60541、アザジラクチン (a
 zadirachtin)、アザメチフォス (azamethiphos)、アジンフォ
 ス A (azinhpos A)、アジンフォス M、アゾシクロチン (azocycl
 otin)、

バシルス・ポピリアエ (Bacillus popilliae)、バシルス・スファエ
 リクス (Bacillus sphaericus)、バシルス・スブチリス (Baci
 llus subtilis)、バシルス・ツリングエンシス (Bacillus th 30
 uringiensis)、バクロウィルス、ベアウベリア・バシアナ (Beauver
 ia bassiana)、ベアウベリア・テネラ (Beauveria tenella)
 a)、ベンジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuraca
 rb)、ベンスルタブ (bensultap)、ベンゾキシメート (benzoxima
 te)、ベータシフルツリン (betacyfluthrin)、ビフェナゼート (bi
 fenazate)、ビフェンツリン (bifenthrin)、ビオエタノメツリン (40
 bioethanomethrin)、ビオペルメツリン (biopermethrin)
)、BPMC、ブロモフォス A (bromophos A)、ブフェンカルブ (buf
 encarb)、ブプロフェジン (buprofezin)、ブタチオフォス (buta
 thiofos)、ブトカルボキシム (butocarboxim)、ブチルピリダベン
 (butylpyridaben)、

カズサフォス (cadusafos)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン
 (carbofuran)、カルボフェノチオン (carbophenothion)、 40
 カルボスルファン (carbosulfan)、カルタブ (cartap)、クロエトカ
 ルブ (chloethocarb)、クロレトキシフォス (chlorethoxyfo
 s)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、クロルフェンビンフォス (ch
 lorfenvinphos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)
 、クロルメフォス (chlormephos)、クロルピリフォス (chlorpyri
 fos)、クロルピリフォス M、クロバポルツリン (chlovaporthrin)
 、シス-レスメツリン (cis-resmethrin)、シスペルメツリン (cisp
 ermethrin)、クロシツリン (clocythriner)、クロエトカルブ (cl
 oethocarb)、クロフェンテジン (clofentezine)、シアノフォス
 (cyanophos)、シクロブレン (cycloprene)、シクロプロツリン (50

cycloprothrin)、シフルツリン (cyfluthrin)、シハロツリン
 (cyhalothrin)、シヘキサチン (cyhexatin)、シペルメツリン (cypermethrin)、シロマジン (cyromazine)、
 デルタメツリン (deltamethrin)、デメトン M (demeton M)、
 デメトン S、デメトン-S-メチル、ジアフェンチウロン (diafenthion)
 (diafenthion)、ジアジノン (diazinon)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジフ
 ルベンズロン (diflubenzuron)、ジメトエート (dimethoate)
 、ジメチルビンフォス (dimethylvinphos)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスルフォトン (disulfoton)、ドクサト-ナトリウム (docusate-sodium)、ドフェナピン (dofenapyn)、
 エフルシラネート (eflusalate)、エマメクチン (emamectin)
 、エムペンツリン (endosulfan)、エンドスルファン (endosulfan)
)、エントモプフトラ種 (entomopffthora spp.)、エプリノメクチン
 (epinomectin)、エスフェンバレレート (efenvalerate)
 、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、エチオン (ethion)、エト
 プロフォス (ethoprophos)、エトフェンプロクス (ethofenprox)
)、エトキサゾール (etoxazole)、エツリムフォス (etrimphos)、
 フェナミフォス (fenamiphos)、フェナザクイン (fenazaquin)、
 フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、フェニトロチオン (fenitrothion)、
 フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェノキサクリム (fenoxacrim)、
 フェンプロパツリン (fenpropathrin)、フェンピラド (fenpyrad)、
 フェンピリツリン (fenpyrithrin)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、
 フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、フルアズロン (fluaazuron)、フルブロシツリネート (flubrocycythrinate)、
 フルシツリネート (flucycythrinate)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、フルテンジン (flutenzin)、フルバリネート (fluvalinate)、
 フォノフォス (fonophos)、フォスメチラン (fosmethilan)、フォスチアゼート (fosthiazate)、フブフェンプロクス (fubfenprox)、
 フラチオカルブ (furathiocarb)、
 グラニューローシスウィルス、
 ハロフェノジド (halofenozide)、HCH、ヘプテノフォス (heptenophos)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、ヒドロブレン (hydroprene)、
 イミダクロプリド (imidacloprid)、イサゾフォス (isazophos)、
 イソフェンフォス (isofenphos)、イソキサチオン (isoxathion)、
 イベルメクチン (ivermectin)、
 核多角体病ウィルス、
 ラムダーシハロツリン (lambda-cyhalothrin)、ルフェヌロン (lufenuron)、
 マラチオン (malathion)、メカルバム (mecarbam)、メタルデヒド (metaldehyde)、メタミドフォス (methamidophos)、メタリジウム・アニソプリアエ (Metharhizium anisopliae)、メタリジウム・フラボビリデ (Metharhizium flavoviride)、メチダチオン (methidathion)、メチオカルブ (methiocarb)、メトミル (methomyl)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、メト
 ルカルブ (metolcarb)、メトキサジアゾン (metoxadiazon)、
 メビンフォス (mevinphos)、ミルベメクチン (milbemectin)、モ
 ノクロトフォス (monocrotophos)、

10

20

30

40

50

ナレド (naled)、ニテンピラム (nitenpyram)、ニチアジン (nithiazine)、ノバルロン (novaluron)、
 オメトエート (omethoate)、オキサミル (oxamyl)、オキシデメトン
 M (oxydemeton M)、
 パエシロミセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus)、パラチオン A (parathion A)、パラチオン M、ペルメツリン (permethrin)、フェントエート (phenthoate)、フォレート (phorate)、フォサロン (phosalone)、フォスメト (phosmet)、フォスファミドン (phosphamidon)、フォキシム (phoxim)、ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミフォス A (pirimiphos A)、ピリミ
 10 フォス M、プロフェノフォス (profenofos)、プロメカルブ (promecarb)、プロポクスル (propoxur)、プロチオフォス (prothiofos)、プロトエート (prothoate)、ピメトロジン (pymetrozin)、ピラクロフォス (pyrachlaphos)、ピレスメツリン (pyresmethrin)、ピレツルム (pyrethrum)、ピリダベン (pyridaben)、ピリダチオン (pyridathion)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、ピリ
 プロキシフェン (pyriproxifen)、
 クイナルフォス (quinalphos)、
 リバビリン (ribavirin)、
 サリチオン (salithion)、セブフォス (sebufos)、セラメクチン (s
 20 elamectin)、シラフルオフエン (silaflofen)、スピノサド (spinosad)、スルフオテプ (sulfotep)、スルプロフォス (sulprofos)、
 タウフルバリネート (tau-fluvalinate)、テブフェノジド (tebufenozide)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テブピリミフォス (tebupirimiphos)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テフルツリン (tefluthrin)、テムフォス (temephos)、テミビンフォス (temivinvphos)、テルブフォス (terbufos)、テトラクロルビンフォス (tetrachlorvinphos)、テーターシペルメツリン (th
 30 eta-cypermethrin)、チアメトキサム (thiamethoxam)、
 チアプロニル (thiapronil)、チアツリフォス (thiatriphos)、
 チオシクラム水素オキサレート (thiocyclam hydrogen oxalate)、チオジカルブ (thiodicarb)、チオファノクス (thiofanox)、ツリングエンシン (thuringiensin)、トラロシツリン (tralocythrin)、トラロメツリン (tralomethrin)、トリアラテン (tri
 40 arathen)、トリアザメート (triazamae)、トリアゾフォス (triazophos)、トリアズロン (triazuron)、トリクロフェニジン (trichlorophenidine)、トリクロルフォン (trichlorfon)、トリフルムロン (triflumuron)、トリメタカルブ (trimethacarb)、
 バミドチオン (vamidothion)、バニリプロレ (vaniliprole)、
 40 ベルチシリウム・レカニイ (Verticillium lecanii)、
 YI 5302、
 ゼーターシペルメツリン (zeta-cypermethrin)、ゾラプロフォス (zolaprofos)、
 (1R-シス) - [5 - (フェニルメチル) - 3 - フラニル] - メチル - 3 - [(ジヒドロ - 2 - オキソ - 3 (2H) - フラニリデン) - メチル] - 2, 2 - ジメチルシクロプロ
 パンカルボキシレート、
 (3 - フェノキシフェニル) - メチル 2, 2, 3, 3 - テトラメチルシクロプロパンカル
 ボキシレート、
 1 - [(2 - クロロ - 5 - チアゾリル) メチル] テトラヒドロ - 3, 5 - ジメチル - N - 50

ニトロ-1, 3, 5-トリアジン-2 (1H) -イミン、
 2- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -4- [4- (1, 1-ジメチルエチル) フェニル] -4, 5-ジヒドロ-オキサゾール、
 2- (アセチルオキシ) -3-ドデシル-1, 4-ナフタレンジオン、
 2-クロロ-N- [[[4- (1-フェニルエトキシ) -フェニル] -アミノ] -カルボニル] -ベンズアミド、
 2-クロロ-N- [[[4- (2, 2-ジクロロ-1, 1-ジフルオロエトキシ) -フェニル] -アミノ] -カルボニル] -ベンズアミド、
 3-メチルフェニル プロピルカルバメート、
 4- [4- (4-エトキシフェニル) -4-メチルペンチル] -1-フルオロ-2-フェ 10
 ノキシ-ベンゼン、
 4-クロロ-2- (1, 1-ジメチルエチル) -5- [[2- (2, 6-ジメチル-4-フェノキシフェノキシ) エチル] チオ] -3 (2H) -ピリダジノン、
 4-クロロ-2- (2-クロロ-2-メチルプロピル) -5- [(6-ヨード-3-ピリジニル) メトキシ] -3 (2H) -ピリダジノン、
 4-クロロ-5- [(6-クロロ-3-ピリジニル) メトキシ] -2- (3, 4-ジクロロフェニル) -3 (2H) -ピリダジノン、
 バシルス・ツリングエンシス株 E G-2348、
 [2-ベンゾイル-1- (1, 1-ジメチルエチル) -ヒドラジノ安息香酸、
 ブタン酸 2, 2-ジメチル-3- (2, 4-ジクロロフェニル) -2-オキソ-1-オキ 20
 サスピロ [4. 5] デセ-3-エン-4-イル
 [3- [(6-クロロ-3-ピリジニル) メチル] -2-チアゾリジニリデン] -シアナミド、
 ジヒドロ-2- (ニトロメチレン) -2H-1, 3-チアジン-3 (4H) -カルボキシアルデヒド、
 エチル [2- [[1, 6-ジヒドロ-6-オキソ-1- (フェニルメチル) -4-ピリダジニル] オキシ] エチル] -カルバメート、
 N- (3, 4, 4-トリフルオロ-1-オキソ-3-ブテニル) -グリシン、
 N- (4-クロロフェニル) -3- [4- (ジフルオロメトキシ) フェニル] -4, 5- 30
 ジヒドロ-4-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキシアミド、
 N- [(2-クロロ-5-チアゾリル) メチル] -N'-メチル-N"-ニトロ-グアニジン、
 N-メチル-N'- (1-メチル-2-プロペニル) -1, 2-ヒドラジンジカルボチオアミド、
 N-メチル-N'-2-プロペニル-1, 2-ヒドラジンジカルボチオアミド、
 O, O-ジエチル [2- (ジプロピルアミノ) -2-オキソエチル] -エチルホスホルアミドチオエート。

【0389】

他の既知の活性化合物、例えば除草剤、肥料及び成長調節剤を混合することも可能である。

40

【0390】

本発明に従う活性化合物はさらに、殺虫剤として用いられる場合、それらの商業的に入手可能な調剤において、ならびにこれらの調剤から調製される使用形態において、相乗剤との混合物として存在することができる。相乗剤は本発明に従う活性化合物の作用を向上させる化合物であり、加えられる相乗剤がそれ自身で活性である必要はない。

【0391】

商業的に入手可能な調剤から調製される使用形態の活性化合物含有率は広い限度内で変わることができる。使用形態の活性化合物濃度は0.0000001~95重量%、好ましくは0.0001~1重量%の活性化合物であることができる。

【0392】

50

化合物は使用形態に適した通常の方法で用いられる。

【0393】

衛生上の有害生物及び保存製品の有害生物に対して用いられる場合、活性化合物は木材及び粘土上における優れた残留作用ならびに石灰処理された基質上のアルカリに対する優れた安定性により傑出している。

【0394】

すでに上記で言及した通り、本発明に従って植物全体及びそれらの一部を処理することができる。好ましい態様では、野生植物種及び植物品種又は通常の生物学的育種法、例えば交配又はプロトプラスト融合により得られるもの及びそれらの一部が処理される。さらに別の好ましい態様では、適宜通常の方法と組合わされた遺伝子工学により得られる形質転換植物及び植物品種（遺伝的改変生物（Genetically Modified Organisms））及びそれらの一部が処理される。「一部」又は「植物の一部（parts of plants）」及び「植物の一部（plant parts）」という用語は上記で説明した。

【0395】

特に好ましくは、それぞれ商業的に入手可能であるか又は使用中である植物品種の植物が本発明に従って処理される。植物品種は、通常の育種により、突然変異誘発により、又は組換えDNA法により得られた特定の性質（「特色」）を有する植物を意味すると理解されるべきである。これは変種、バイオタイプ及び遺伝子型であることができる。

【0396】

植物種又は植物品種、それらの位置及び生育条件（土壌、気候、生育期間、栄養）に依存して、本発明に従う処理は超加算的（「相乗」）効果も生じ得る。かくして例えば適用率の低下及び／又は活性範囲の拡大及び／又は本発明に従って用いられるべき物質及び組成物の活性の向上、より良好な植物生育、高温又は低温に対する耐性の向上、乾燥もしくは水もしくは土壌の塩含有に対する耐性の向上、開花性能の向上、より容易な収穫、加速される成熟、より高い収穫収率、収穫される製品のより良好な質及び／又はより高い栄養価、収穫される製品のより良好な保存安定性及び／又は加工性が可能であり、それらは実際に予測されるべきであった効果を越える。

【0397】

本発明に従って処理されるべき好ましい形質転換植物もしくは植物品種（すなわち遺伝子工学により得られるもの）には、遺伝子改変においてこれらの植物に特に有利な有用な性質（「特色」）を与える遺伝物質が与えられたすべての植物が含まれる。そのような性質の例はより良好な植物生育、高温又は低温に対する耐性の向上、乾燥もしくは水もしくは土壌の塩含有に対する耐性の向上、開花性能の向上、より容易な収穫、加速される成熟、より高い収穫収率、収穫される製品のより良好な質及び／又はより高い栄養価、収穫される製品のより良好な保存安定性及び／又は加工性である。そのような性質のさらに別の且つ特に強調される例は、有害動物及び有害微生物に対する、例えば昆虫、ダニ、植物病原性菌・カビ、バクテリア及び／又はウィルスに対する植物のより高い防御ならびにまたある種の除草的に活性な化合物への植物の耐性の向上である。挙げることができる形質転換植物の例は重要な作物植物、例えば穀類（小麦、稲）、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿、アブラナならびにまた果実植物（リンゴ、ナシ、柑橘果実及びブドウを持つ）であり、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿及びアブラナが特に強調される。強調される特色は特に、植物において形成される毒素、特にバシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）からの遺伝物質により（例えば遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIFならびに又それらの組み合わせにより）植物において形成されるものによる（下記では「Bt植物」と言う）、昆虫に対する植物の防御の向上である。やはり特に強調される特色は、系統的取得抵抗性（systemic acquired resistance）（SAR）、システミン、フィトアレキシン、エリシター及び抵抗性遺伝子ならびに対応して発現されるタ

ンパク質及び毒素による菌・カビ、バクテリア及びウィルスに対する植物の防御の向上である。さらに特に強調される特色は、ある種の除草的に活性な化合物、例えばイミダゾリノン類、スルホニルウレア類、グリホセート又はホスフィノトリシン（例えば「PAT」遺伝子）に対する植物の耐性の向上である。問題の所望の特色を与える遺伝子が形質転換植物中で互いの組み合わせにおいて存在することもできる。挙げることができる「Bt植物」の例は、YIELD GARD^R（例えばトウモロコシ、綿、大豆）、Knock Out^R（例えばトウモロコシ）、StarLink^R（例えばトウモロコシ）、 Bollgard^R（綿）、Nucotn^R（綿）及びNewLeaf^R（ジャガイモ）の商品名の下に販売されているトウモロコシ変種、綿変種、大豆変種及びジャガイモ変種である。挙げることができる除草剤－耐性植物の例は、Roundup Ready^R（グリホセートに対する耐性、例えばトウモロコシ、綿、大豆）、Liberty Link^R（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えばアブラナ）、IMI^R（イミダゾリノン類に対する耐性）及びSTS^R（スルホニルウレアに対する耐性、例えばトウモロコシ）の商品名の下に販売されているトウモロコシ変種、綿変種及び大豆変種である。挙げることができる除草剤－抵抗性植物（除草剤耐性のために通常の方法で育種された植物）にはClearfield^R（例えばトウモロコシ）の名前の下に販売されている変種が含まれる。もちろんこれらの記述は、将来開発及び／又は販売されるであろうこれらの遺伝的特色又はまだ開発されていない遺伝的特色を有する植物品種にも適用される。

【0398】

上記の植物を本発明に従って特に有利な方法で、本発明に従う一般式（I）の化合物又は活性化合物混合物を用いて処理することができる。活性化合物又は混合物に関して上記で記載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。本文で特定の挙げた化合物又は混合物を用いる植物の処理が特に強調される。

【0399】

本発明に従う活性化合物は植物の有害生物、衛生上の有害生物及び保存製品の有害生物に対してのみでなく、獣医学部門において動物寄生虫（外部寄生虫）、例えばカタダニ、ヒメダニ、カイセンダニ（mange mites）、リーフマイト（leaf mites）、ハエ類（囓む及びなめる）、寄生性ハエ幼虫、シラミ、毛ジラミ、羽ジラミ及びノミに対しても作用する。これらの寄生虫には：

シラミ類（Anoplurida）の目から、例えばハエマトピヌス種（Haematopinus spp.）、リノグナツス種（Linognathus spp.）、ペジクルス種（Pediculus spp.）、フチルス種（Phthirus spp.）及びソレノポテス種（Solenopotes spp.）、
ハジラミ類（Mallophagida）の目ならびにマルツノハジラミ類（Amblycerina）及びホソツノハジラミ類（Ischnocerina）の亜目から、例えばトリメノポン種（Trimenopon spp.）、メノポン種（Menopon spp.）、トリノトン種（Trinoton spp.）、ボビコラ種（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ種（Werneckiella spp.）、レピケントロン種（Lepikentron spp.）、ダマリナ種（Damalina spp.）、トリコデクテス種（Trichodectes spp.）及びフェリコラ種（Felicola spp.）、

双翅類（Diptera）の目ならびに糸角類（Nematocarina）及び短角類（Brachycarina）の亜目から、例えばアエデス種（Aedes spp.）、アノフェレス種（Anopheles spp.）、クレクス種（Culex spp.）、シムリウム種（Simulium spp.）、エウシムリウム種（Eusimulium spp.）、フレボトムス種（Phlebotomus spp.）、ルツヅミイア種（Lutzomyia spp.）、クリコイデス種（Culicoides spp.）、クリソプス種（Chrysops spp.）、ヒボミツラ種（Hybomitra spp.）、アチロツス種（Atylotus spp.）、タバヌス種（Tabanus spp.）、ハエマトポタ種（Haematopota spp.）、フ

ィリボミイア種 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ種 (*Braula* spp.)、ムスカ種 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア種 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキシス種 (*Stomoxys* spp.)、ハエマトビア種 (*Haematobia* spp.)、モレリア種 (*Morellia* spp.)、ファニア種 (*Fannia* spp.)、グロシナ種 (*Glossina* spp.)、カリフォラ種 (*Calliphora* spp.)、ルシリア種 (*Lucilia* spp.)、クリソミア種 (*Chrysomya* spp.)、ウォールファルチア種 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファガ種 (*Sarcophaga* spp.)、オエストルス種 (*Oestrus* spp.)、ヒポデルマ種 (*Hypoderma* spp.)、ガステロフィルス種 (*Gasterophilus* spp.)、ヒポボスカ種 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ種 (*Lipoptena* spp.) 及びメロファグス種 (*Melophagus* spp.)、
 ノミ類 (*Siphonapterida*) の目から、例えばプレクス種 (*Pulex* spp.)、クテノセファリデス種 (*Ctenocephalides* spp.)、キセノプシラ種 (*Xenopsylla* spp.) 及びセラトフィルス種 (*Ceratophyllus* spp.)、
 異翅類 (*Heteroptera*) の目から、例えばシメクス種 (*Cimex* spp.)、トリアトマ種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス種 (*Rhodnius* spp.) 及びパンストロンギルス種 (*Panstrongylus* spp.)、
 ゴキブリ類 (*Blattaria*) の目から、例えばブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ブラテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*) 及びスベラ種 (*Supella* spp.)、
 ダニ類 (*Acaria* (*Acarida*)) の亜綱、ならびに後気門類及び中気門類 (*Meta- and Mesostigmata*) の目から、例えばアルガス種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス種 (*Otobius* spp.)、イクソデス種 (*Ixodes* spp.)、アンブリオマ種 (*Amblyomma* spp.)、ボーフィルス種 (*Boophilus* spp.)、デルマセントル種 (*Dermacentor* spp.)、ハエモフィサリス種 (*Haemophysalis* spp.)、ヒアロマ種 (*Hyalomma* spp.)、リピセファルス種 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニسس種 (*Dermanyssus* spp.)、ライリエチア種 (*Raillietia* spp.)、ニューモニسس種 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ種 (*Sternostoma* spp.) 及びバロア種 (*Varroa* spp.)、
 前気門類 (*Actinedida* (*Prostigmata*)) 及び無気門類 (*Acaridida* (*Astigmata*)) の目から、例えばアカラピス種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ種 (*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア種 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア種 (*Myobia* spp.)、プソレルガテス種 (*Psorergates* spp.)、デモデクス種 (*Demodex* spp.)、トロムビクラ種 (*Trombicula* spp.)、
 リストロフォルス種 (*Listrophorus* spp.)、アカルス種 (*Acarus* spp.)、チロファグス種 (*Tyrophagus* spp.)、カログリフス種 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス種 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス種 (*Pterolichus* spp.)、プソロプテス種 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス種 (*Chorioptes* spp.)、オトデクテス種 (*Otodectes* spp.)、サルコプテス種 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエド레스種 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス種 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス種 (*Cytodites* spp.) 及びラミノシオプテス種 (*Laminosioptes* spp.)
 が含まれる。

【0400】

それらは例えばダニ類の生育段階に対して、ハエ類に対して及びノミ類に対して優れた活性を有する。

【0401】

本発明に従う式 (I) の活性化合物は、農業的生産家畜、例えば牛、羊、ヤギ、馬、豚、ロバ、ラクダ、水牛、ウサギ、鶏、七面鳥、アヒル、ガチョウ及び蜂、他のペット類、例えば犬、猫、かごの鳥及び水族館の魚ならびにまたいわゆる試験動物、例えばハムスター、モルモット、ラット及びマウスに蔓延する節足動物の抑制にも適している。本発明に従う活性化合物の使用によりこれらの節足動物が抑制されることによって、死亡及び生産性の低下（肉、ミルク、ウール、皮革、卵、蜂蜜などに関する）の事例が減少し、より経済的且つ簡単な動物飼育 (animal husbandry) が可能にならなければならない。

10

【0402】

獣医学部門において、本発明に従う活性化合物は既知の方法で、例えば錠剤、カプセル、頓服水剤、水薬、顆粒剤、ペースト剤、大型丸薬、フィードスルー法 (feed-through process) 及び座薬の形態で腸内投与により、非経口的投与により、例えば注入（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など）、体内埋植物により、鼻内投与により、例えば浸漬もしくは入浴、スプレー噴霧、ポアリングオン (pouring on) 及びスポッティングオン (spotting on)、洗浄、粉剤散布の形態で皮膚的使用により、ならびにまた活性化合物を含有する成形品、例えばカラー、イアマーク、テイルマーク、リムバンド、ホルター、マーキング装置などにより用いられる。

20

【0403】

牛、家禽、ペットなどのために用いる場合、本発明に従う式 (I) の活性化合物を、1～80重量%の量で本発明に従う活性化合物を含む調剤（例えば粉剤、乳剤、流動性組成物）として直接又は100～10000倍希釈の後に使用することができるか、あるいは薬浴としてそれらを用いることができる。

【0404】

さらに、本発明に従う化合物が工業材料を破壊する昆虫に対する有力な殺虫作用を有することが見いだされた。

【0405】

以下の昆虫を例として且つ好ましいとして挙げることができる一が制限としてではない：甲虫類 (Beetles)、例えば

30

ヒロツルベス・バジュルス (Hylotrupes bajulus)、クロロホルス・ピロシス (Chlorophorus pilosis)、アノビウム・プンクタツム (Anobium punctatum)、クセストビウム・ルフォビロスム (Xestobium rufovillosum)、プチリヌス・ペクチコルニス (Ptilinus pecticornis)、デンドロビウム・ペルチネクス (Dendrobium pertinex)、エルノビウス・モリス (Ernobius mollis)、プリオビウム・カルピニ (Priobium carpini)、リクツス・ブルネウス (Lyctus brunneus)、リクツス・アフリカヌス (Lyctus africanus)、リクツス・プラニコリス (Lyctus planicollis)、リクツス・リネアリス (Lyctus linearis)、リクツス・プベセンス (Lyctus pubescens)、トロゴキシロン・アエクアレ (Trogoxylon aequale)、ミンテス・ルギコリス (Minthes rugicollis)、キシレボルス種 (Xyleborus spec.)、トリプトデンドロン種 (Trypodendron spec.)、アパテ・モナクス (Apate monachus)、ボスツリクス・カプシンス (Bostrychus capucins)、ヘテロボスツリクス・ブルネウス (Heterobostrychus brunneus)、シノキシロン種 (Sinoxylon spec.) 及びジノデルス・ミヌツス (Dinoderus minutus)。

40

50

膜翅類 (Hymenoptera)、例えば

シレクス・ジュベックス (Sirex juvenicus)、ウロセルス・ギガス (Urocerus gigas)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (Urocerus gigas taignus) 及びウロセルス・アウグル (Urocerus augur)。

白アリ類 (Termites)、例えば

カロテルメス・フラビコリス (Kaloterмес flavicollis)、クリプトテルメス・ブレビス (Cryptotermes brevis)、ヘテロテルメス・インジコラ (Heterotermes indicola)、レチクリテルメス・フラビペス (Reticulitermes flavipes)、レチクリテルメス・サントネンシス (Reticulitermes santonensis)、レチクリテルメス・ルシフグス (Reticulitermes lucifugus)、マストテルメス・ダルウィニエンシス (Mastotermes darwiniensis)、ゾオテルモプシス・ネバデンシス (Zootermopsis nevadensis) 及びコプトテルメス・フォルモサヌス (Coptotermes formosanus)。

シミ類 (Bristletails)、例えばレピスマ・サッカリナ (Lepisma saccharina)。

【0406】

本発明に関し、工業材料とは非生物材料、例えば好ましくはプラスチック、接着剤、のり、紙及びカード、皮革、木材及び加工木材製品ならびにコーティング組成物を意味すると理解されるべきである。

【0407】

昆虫の蔓延から特に好適に保護されるべき材料は木材及び加工木材製品である。

【0408】

本発明に従う薬剤又はそれを含む混合物により保護することができる木材及び加工木材製品とは、例えば：

建築木材、はり材、鉄道の枕木、橋梁部品、栈橋、木製車両、箱類、パレット類、コンテナ類、電話柱、木製断熱材、木製窓枠及びドア、合板、チップボード、建具類あるいは家の建築又は建具に非常に一般的に用いられる木材製品を意味すると理解されるべきである。

【0409】

本発明に従う活性化合物はそのまま、濃厚液の形態であるいは一般に通例の調剤、例えば粉剤、顆粒剤、溶液、懸濁剤、乳剤又はペースト剤中で用いることができる。

【0410】

上記の調剤はそれ自体既知の方法で、例えば本発明に従う活性化合物を少なくとも1種の溶媒又は希釈剤、乳化剤、分散剤及び／又は結合剤もしくは定着剤、撥水剤、適宜乾燥剤及びUV安定剤ならびに適宜染料及び顔料ならびにまた他の加工助剤と混合することにより調製することができる。

【0411】

木材及び木材製品 (wood-derived timber products) の保存のために用いられる殺虫性組成物又は濃厚液は、本発明に従う活性化合物を0.0001～95重量%、特に0.001～60重量%の濃度で含む。

【0412】

用いられる組成物又は濃厚液の量は、昆虫の性質及び発生度ならびに媒体に依存する。用いられる最適量は、それぞれの場合に試験系列によって使用のために決定することができる。しかしながら一般に保存されるべき材料に基づいて0.0001～20重量%、好ましくは0.001～10重量%の活性化合物の使用が十分であろう。

【0413】

用いられる溶媒及び／又は希釈剤は有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／又は低揮発性

10

20

30

40

50

の油性又は油一様有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／又は極性有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／又は水ならびに適宜乳化剤及び／又は湿潤剤である。

【0414】

好適に用いられる有機化学溶媒は、35より高い蒸発数 (evaporation number) 及び30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点を有する油性又は油一様溶媒である。そのような低揮発性の油性もしくは油一様の水一不溶性溶媒として用いられる物質は、適した鉱油又はそれらの芳香族留分あるいは鉱油を含有する溶媒混合物、好ましくはホワイトスピリット、石油及び／又はアルキルベンゼンである。

【0415】

170～220℃の沸騰範囲を有する鉱油、170～220℃の沸騰範囲を有するホワイトスピリット、250～350℃の沸騰範囲を有するスピンドル油、160～280℃の沸騰範囲を有する石油及び芳香族留分、ターペンタイン油などが有利に用いられる。 10

【0416】

好ましい態様の場合、180～210℃の沸騰範囲を有する液体脂肪族炭化水素又は180～220℃の沸騰範囲を有する芳香族及び脂肪族炭化水素の高沸点混合物ならびに／又はスピンドル油ならびに／又はモノクロロナフタレン、好ましくは α -モノクロロナフタレンが用いられる。

【0417】

35より高い蒸発数及び30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点を有する低揮発性の有機油性又は油一様溶媒を、部分的に高又は中揮発性の有機化学溶媒により置き換えることができ、但し溶媒混合物は同様に35より高い蒸発数及び30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点を有し、殺虫剤／殺菌・殺カビ剤混合物はこの溶媒混合物中に可溶性であるか、又は乳化可能である。 20

【0418】

好ましい態様に従うと、有機化学溶媒又は溶媒混合物のいくらかが脂肪族極性有機化学溶媒又は溶媒混合物で置き換えられる。ヒドロキシル及び／又はエステル及び／又はエーテル基を含有する脂肪族有機化学溶媒、例えばグリコールエーテル類、エステル類などが好適に用いられる。

【0419】

本発明の範囲内で用いられる有機化学的結合剤は、それ自体既知であり、水中で希釈することができ、及び／又は用いられる有機化学溶媒中に溶解もしくは分散もしくは乳化可能である合成樹脂及び／又は結合性乾燥性油であり、特にアクリレート樹脂、ビニル樹脂、例えばポリ酢酸ビニル、ポリエステル樹脂、重縮合もしくは重付加樹脂、ポリウレタン樹脂、アルキド樹脂又は改質アルキド樹脂、フェノール樹脂、炭化水素樹脂、例えばインデン／クマロン樹脂、シリコーン樹脂、乾燥性植物油及び／又は乾燥性油及び／又は天然及び／もしくは合成樹脂に基づく物理的に乾燥性の結合剤からなるか又はそれらを含む結合剤である。 30

【0420】

結合剤として用いられる合成樹脂はエマルション、分散液又は溶液の形態で用いることができる。最高で10重量%の量でビチューメン又はビチューメン性物質も結合剤として用いることができる。それ自体既知である染料、顔料、撥水剤、臭気一修正剤及び妨害剤又は腐食防止剤などをさらに用いることができる。 40

【0421】

組成物又は濃厚液が有機化学的結合剤として少なくとも1種のアルキド樹脂もしくは改質アルキド樹脂及び／又は乾燥性植物油を含むのが本発明に従って好ましい。45重量%より多い、好ましくは50～68重量%の油含有率を有するアルキド樹脂が本発明に従って好適に用いられる。

【0422】

上記の結合剤の全体又はいくらかを定着剤 (混合物) 又は可塑剤 (混合物) で置き換えることができる。これらの添加剤は活性化合物の蒸発及び結晶化もしくは沈澱を防ぐことを 50

目的とする。それらは好ましくは結合剤の 0.01～30%（用いられる結合剤の 100%に基づいて）と置き換えられる。

【0423】

可塑剤はフタル酸エステル類、例えばフタル酸ジブチル、ジオクチル又はベンジルブチル、リン酸エステル類、例えばリン酸トリブチル、アジピン酸エステル類、例えばアジピン酸ジ（2-エチルヘキシル）、ステアリン酸エステル類、例えばステアリン酸ブチルもしくはステアリン酸アミル、オレイン酸エステル類、例えばオレイン酸ブチル、グリセロールエーテル類又は比較的高分子量のグリコールエーテル類、グリセロールエステル類ならびに p-トルエンスルホン酸エステル類の化学的種類に由来する。

【0424】

定着剤は化学的にポリビニルアルキルエーテル類、例えばポリビニルメチルエーテル又はケトン類、例えばベンゾフェノンもしくはエチレンベンゾフェノンに基づいている。

【0425】

特に適宜 1 種又はそれより多い上記の有機化学溶媒又は希釈剤、乳化剤及び分散剤との混合物としての水も可能な溶媒もしくは希釈剤である。

【0426】

特に有効な木材の保存は大きな工業的規模での含浸法、例えば真空、二重真空又は加圧法により達成される。

【0427】

調製済み組成物は適宜他の殺虫剤及び又適宜 1 種又はそれ以上の殺菌・殺カビ剤も含むことができる。

【0428】

可能な追加の混合パートナーは好ましくは国際公開第 94/29268 号パンフレットに挙げられている殺虫剤及び殺菌・殺カビ剤である。この文書に挙げられている化合物は本出願の明白な構成部分である。

【0429】

挙げることができる特別に好ましい混合パートナーは殺虫剤、例えばクロルピリフォス（chlorpyrifos）、フォキシム（phoxim）、シラフルオフィン（silaflofin）、アルファメスリン（alphamethrin）、シフルスリン（cyfluthrin）、シベルメスリン（cypermethrin）、デルタメスリン（deltamethrin）、ペルメスリン（permethrin）、イミダクロプリド（imidacloprid）、NI-25、フルフェノクスロン（flufenoxuron）、ヘキサフルムロン（hexaflumuron）、トランスフルスリン（trandfluthrin）、チアクロプリド（thiacloprid）、メトキシフェノジド（methoxyfenozide）及びトリフルムロン（triflumuron）ならびにまた殺菌・殺カビ剤、例えばエポキシコナゾール（epoxiconazole）、ヘキサコナゾール（hexaconazole）、アザコナゾール（azaconazole）、プロピコナゾール（propiconazole）、テブコナゾール（tebuconazole）、シプロコナゾール（ciproconazole）、メトコナゾール（metconazole）、イマザリル（imazalil）、ジクロルフルアニド（dichlorfluanid）、トリルフルアニド（tolylfluanid）、3-ヨード-2-プロピニル-ブチルカルバメート、N-オクチルイソチアゾリン-3-オン及び 4,5-ジクロロ-N-オクチルイソチアゾリン-3-オンである。

【0430】

本発明に従う化合物を同時に、塩水又は塩分のある水と接触する物体、特に船体、仕切り、ネット、建築物、係留用具及び信号システムを汚染に対して保護するために用いることができる。

【0431】

固着性貧毛類（Oligochaeta）、例えばセルプリダエ（Serpulidae）

10

20

30

40

50

）による、ならびにレダモルファ（*Ledamorphia*）の群（エボシガイ）からの貝殻及び種、例えば種々のエボシガイ（*Lepas*）及びスカルペルム（*Scalpellum*）種による、あるいはフジツボ型類（*Balanomorpha*）の群（フジツボ）からの種、例えばバラヌス（*Balanus*）又はポリシペス（*Pollicipes*）種による汚染は、船の摩擦的障害を増加させ、結局、より高いエネルギー消費及びさらに頻繁な乾ドックにおける滞留のために運転コストにおける顕著な増加を生ずる。

【0432】

藻類、例えばシオミドロ種（*Ectocarpus* sp.）及びセラミウム種（*Ceramium* sp.）による汚染と別に、蔓脚類（*Cirripedia*）（*cirriped crustaceans*）の属名に属する固着性エントモストラカ（*Entomostirakia*）の群による汚染は特に重要である。

【0433】

驚くべきことに今回、本発明に従う化合物が単独でもしくは他の活性化合物との組み合わせにおいて、顕著な防汚作用を有することが見いだされた。

【0434】

本発明に従う化合物を単独で又は他の活性化合物と組み合わせて用いることは、例えばビス（トリアルキル錫）スルフィド、トリ－*n*－ブチル錫ラウレート、トリ－*n*－ブチル錫クロリド、酸化銅（I）、トリエチル錫クロリド、トリ－*n*－ブチル（2－フェニル－4－クロロフェノキシ）錫、トリブチル錫オキシド、二硫化モリブデン、酸化アンチモン、高分子チタン酸ブチル、フェニル－（ビスピリジン）－ビスマスキロリド、トリ－*n*－ブチル錫フルオリド、マンガンエチレンビスチオカルバメート、亜鉛ジメチルジチオカルバメート、亜鉛エチレンビスチオカルバメート、2－ピリジンチオール1－オキシドの亜鉛塩及び銅塩、ビスジメチルジチオカルバモイル亜鉛エチレン－ビスチオカルバメート、酸化亜鉛、銅（I）エチレン－ビスジチオカルバメート、チオシアン酸銅、ナフテン酸銅及びトリブチル錫ハライド中におけるような重金属の使用を免じるか、あるいはこれらの化合物の濃度を実質的に減少させることを可能にする。

【0435】

適宜、調製済み防汚塗料はさらに他の活性化合物、好ましくは殺藻剤（*algicides*）、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺軟体動物剤（*molluscicides*）又は他の防汚性活性化合物を含むことができる。

【0436】

本発明に従う防汚性組成物との組み合わせ中における好適の成分は：

殺藻剤、例えば

2－*tert*－ブチルアミノ－4－シクロプロピルアミノ－6－メチルチオール，3，5－トリアジン、ジクロロフェン（*dichlorophen*）、ジウロン（*diuron*）、エンドタル（*endothal*）、フェンチンアセテート（*fentin acetate*）、イソプロツロン（*isoproturon*）、メタベンズチアズロン（*methabenzthiazuron*）、オキシフルオルフェン（*oxyfluorfen*）、クイノクラミン（*quinoclamine*）及びテルブツリン（*terbutryn*）；

殺菌・殺カビ剤、例えば

ベンゾ[b]チオフェンカルボン酸シクロヘキシルアミド S，S－ジオキシド、ジクロフルアニド（*dichlofluaniid*）、フルオルフォルペト（*fluorfolpet*）、3－ヨード－2－プロピニルブチルカルバメート、トリルフルアニド（*tolylfluaniid*）及びアゾール類、例えばアザコナゾール（*azaconazole*）、シプロコナゾール（*cypconazole*）、エポキシコナゾール（*epoxyconazole*）、ヘキサコナゾール（*hexaconazole*）、メトコナゾール（*metconazole*）、プロピコナゾール（*propiconazole*）及びテブコナゾール（*tebuconazole*）；

殺軟体動物剤、例えば

10

20

30

40

50

フェンチンアセテート、メタルデヒド (metaldehyde)、メチオカルブ (methiocarb)、ニコロサミド (niclosamid)、チオジカルブ (thiodicarb) 及びトリメタカルブ (trimethacarb) ;

あるいは通常の防汚性活性化合物、例えば

4, 5-ジクロロ-2-オクチル-4-イソチアゾリン-3-オン、ジヨードメチルパラツリルスルホン、2-(N, N-ジメチルチオカルバモイルチオ)-5-ニトロチアジル、2-ピリジンチオール1-オキシドのカリウム、銅、ナトリウム及び亜鉛塩、ピリジン-トリフェニルボラン、テトラブチルジスタンノキサン、2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)-ピリジン、2, 4, 5, 6-テトラクロロイソフタロニトリル、テトラメチルチウラムジスルフィド及び2, 4, 6-トリクロロフェニルマレイミド

10

である。

【0437】

用いられる防汚性組成物は、本発明に従う化合物の本発明に従う活性化合物を0.001~50重量%、特に0.01~20重量%の濃度で含む。

【0438】

さらに本発明に従う防汚性組成物は通常の成分、例えばUngerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732及びWilliams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973に記載されているものを含む。

20

【0439】

殺菌性、殺菌・殺カビ性、殺軟体動物性活性化合物及び本発明に従う殺虫性活性化合物の他に、防汚塗料は特に結合剤を含む。

【0440】

認められている結合剤の例は、溶媒系中のポリ塩化ビニル、溶媒系中の塩素化ゴム、溶媒系中、特に水性系中のアクリル樹脂、水性分散液もしくは有機溶媒系の形態における塩化ビニル/酢酸ビニルコポリマー系、ブタジエン/スチレン/アクリロニトリルゴム、乾燥性油、例えば亜麻仁油、タールもしくはビチューメン、アスファルトならびにエポキシ化合物との組み合わせにおける樹脂エステルもしくは改質硬化樹脂、少量の塩素ゴム、塩素化ポリプロピレン及びビニル樹脂である。

30

【0441】

適宜塗料は、好ましくは塩水中で不溶性の無機顔料、有機顔料又は着色料も含む。塗料はさらに、活性化合物の制御された放出を可能にするために、コロホニウムのような材料を含むことができる。さらに塗料は可塑剤、流動学的性質に影響する改質剤及び他の通常の成分を含むことができる。本発明に従う化合物又は上記の混合物を自己研磨性 (self-polishing) 防汚系中に導入することもできる。

【0442】

本発明に従う活性化合物は、囲まれた空間、例えば住宅、工場ホール、事務所、車両の室などにおいて見いだされる有害動物、特に昆虫、クモ形類及びダニ類の抑制にも適している。これらの有害生物を抑制するための家庭用殺虫剤製品において、それらを単独で又は他の活性化合物及び助剤と組み合わせて用いることができる。それらは感受性の種及び耐性の種に対して、ならびにすべての発育段階に対して活性である。これらの有害生物には：

40

サソリ類 (Scorpionidea) の目から、例えばブツス・オクシタヌス (Buthus occitanus)、

アカリナ (Acarina) の目から、例えばアルガス・ペルシクス (Argas persicus)、アルガス・レフレクス (Argas reflexus)、ブリオビア種 (Bryobia spp.)、デルマニッス・ガリナエ (Dermanyssus gallinae)、グリシファグス・ドメスティクス (Glyciphagus domesticus)、オルニトドルス・モウバト (Ornithodoros moub

50

at)、リピセファルス・サングイネウス (*Rhipicephalus sanguineus*)、トロンビクラ・アルフレッドゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、ネウトロンビクラ・アウツムナリス (*Neutronebicula autumnalis*)、デルマトファゴイデス・プテロニシムス (*Dermatophagoides pteronissimus*) 及びデルマトファゴイデス・フォリナエ (*Dermatophagoides forinae*)、

オニグモ類 (*Araneae*) の目から、例えばアビクラリイダエ (*Aviculariidae*) 及びアラネイダエ (*Araneidae*)、

メクラグモ類 (*Opiliones*) の目から、例えばシュードスコルピオネス・ケリフェル (*Pseudoscorpiones chelifera*)、シュードスコルピオネス・ケイリジウム (*Pseudoscorpiones cheiridium*) 及びオピリオネス・ファランギウム (*Opiliones phalangium*)、

等脚類 (*Isopoda*) の目から、例えばオニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*) 及びボルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*)、

倍脚類 (*Diplopoda*) の目から、例えばブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*) 及びポリデスムス種 (*Polydesmus spp.*)、

唇脚類 (*Chilopoda*) の目から、例えばゲオフィルス種 (*Geophilus spp.*)、

シミ類 (*Zygentoma*) の目から、例えばクテノレピスマ種 (*Ctenolepisma spp.*)、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*) 及びレピスマデス・インクイリヌス (*Lepismodes inquilinus*)、

ゴキブリ類 (*Blattaria*) の目から、例えばブラッタ・オリエンタリエス (*Blatta orientalis*)、ブラテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、ブラテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、

レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ種 (*Panchlora spp.*)、パルコブラタ種 (*Parcoblatta spp.*)、

ペリプラネタ・アウスツララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、

ペリプラネタ・ブルネア (*Periplaneta brunnea*)、ペリプラネタ・フルギノサ (*Periplaneta fuliginosa*) 及びスベラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*)、

跳躍類 (*Saltatoria*) の目から、例えばアケタ・ドメスティクス (*Achetadomesticus*)、

ハサミムシ類 (*Dermaptera*) の目から、例えばフォルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)、

シロアリ類 (*Isoptera*) の目から、例えばカロテルメス種 (*Kaloterme spp.*) 及びレチクリテルメス種 (*Reticulitermes spp.*)、

チャタテムシ類 (*Psocoptera*) の目から、例えばレピナツス種 (*Lepinatus spp.*) 及びリボセリス種 (*Liposcelis spp.*)、

甲虫類 (*Coleoptera*) の目から、例えばアントレヌス種 (*Anthrenus spp.*)、アタゲヌス種 (*Attagenus spp.*)、デルメステス種 (*Dermeestes spp.*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、

ネクロビア種 (*Necrobia spp.*)、プチヌス種 (*Ptinus spp.*)、リゾベルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*) 及びステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、

双翅類 (*Diptera*) の目から、例えばアエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)

ypti)、アエデス・アルボピクツス (*Aedes albopictus*)、アエデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、アノフェレス種 (*Anopheles spp.*)、カリフォラ・エリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosozona pluvialis*)、クレクス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレクス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、ドロソフィラ種 (*Drosophila spp.*)、ファニア・カニクラリス (*Fannia canicularis*)、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、フレボトムス種 (*Phlebotomus spp.*)、サルコファガ・カルナリア (*Sarcophaga carnaira*)、シムリウム種 (*Simulium spp.*)、ストモクシス・カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*) 及びチブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、

鱗翅類 (*Lepidoptera*) の目から、例えばアクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、プロジア・インテルプункテラ (*Plodia interpunctella*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*) 及びチネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、

ノミ類 (*Siphonaptera*) の目から、例えばクテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレクス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*) 及びキセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)、

膜翅類 (*Hymenoptera*) の目から、例えばカンポノツス・ヘルクレアヌス (*Camponotus herculeanus*)、ラシウス・フリギノス (*Lasius fuliginosus*)、ラシウス・ニゲル (*Lasius niger*)、ラシウス・ウンブラツス (*Lasius umbratus*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラベスプラ種 (*Paravespula spp.*) 及びテトラモリウム・カエスピツム (*Tetramorium caespitum*)、

シラミ類 (*Anoplura*) の目から、例えばペジクルス・フマヌス・カピチス (*Pediculus humanus capitis*)、ペジクルス・フマヌス・コルポリス (*Pediculus humanus corporis*) 及びフチルス・プビス (*Phthirus pubis*)、

異翅類 (*Heteroptera*) の目から、例えばシメクス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメクス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、ロージヌス・プロリクス (*Rhodinus prolixus*) 及びトリアトマ・インフェスタンス (*Triatoma infestans*)

が含まれる。

10

20

30

40

50

【0443】

家庭用殺虫剤の分野で、それらは単独で又は他の適した活性化合物、例えばリン酸エステル類、カルバメート類、ピレスロイド類、成長調節剤あるいは他の既知の種類の殺虫剤からの活性化合物と組み合わせて用いられる。

【0444】

それらはエアゾール、無圧スプレー製品、例えばポンプ及びアトマイザースプレー、自動噴霧システム、噴霧器、泡剤、ゲル剤、セルロース又はポリマーから作られる蒸発器錠剤 (*evaporator tablets*)、液体蒸発器、ゲル及び膜蒸発器、プロペラー駆動蒸発器、無エネルギーもしくは受動的蒸発システム、防虫紙 (*moth papers*)、防虫袋 (*moth bags*) 及び防虫ゲル (*moth gels*) を用いる蒸

発器製品として、顆粒剤もしくは微粉剤として、散布のためもしくは餌ステーションにおける餌中で用いられる。

【0445】

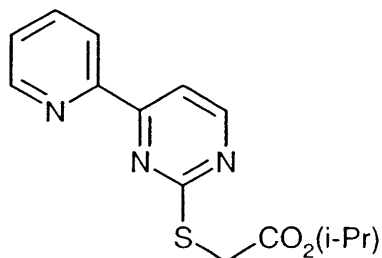
本発明に従う物質の製造及び使用を下記の実施例において示す。

製造実施例

【実施例1】

【0446】

【化74】



10

【0447】

0.57 g (3ミリモル)の4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジンチオール及び1.66 g (12ミリモル)の炭酸カリウムを最初に30 mlのアセトニトリル中に入れる。0.41 g (3ミリモル)の2-クロロ酢酸イソプロピルを加え、次いで混合物を60℃で16時間攪拌する。仕上げるために、反応混合物を減圧下で濃縮し、水と塩化メチレンの間で分配し、有機相を乾燥し、減圧下で濃縮する。

20

【0448】

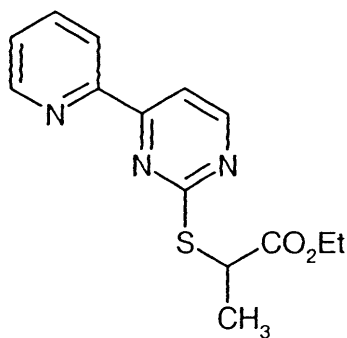
これは0.72 g (理論値の79%)の{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]チオール}-酢酸イソプロピルを油として与える。

HPLC: log P (pH 2.3) = 2.56

【実施例2】

【0449】

【化75】



30

【0450】

35.6 mg (0.188ミリモル)の4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジンチオール及び104 mg (0.752ミリモル)の炭酸カリウムを最初に5 mlのテトラヒドロフラン中に入れる。34.0 mg (0.188ミリモル)の2-ブロモプロピオン酸エチルを加え、次いで混合物を60℃で16時間攪拌する。仕上げるために、0.5 mlの水及び2 mlの酢酸エチルを加え、反応混合物を30分間攪拌し、Extrelutシリカゲルカートリッジに通過させ、次いで減圧下で濃縮する。

40

【0451】

これは41 mg (理論値の70%)のエチル-2-{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]チオール}-プロパノエートを与える。

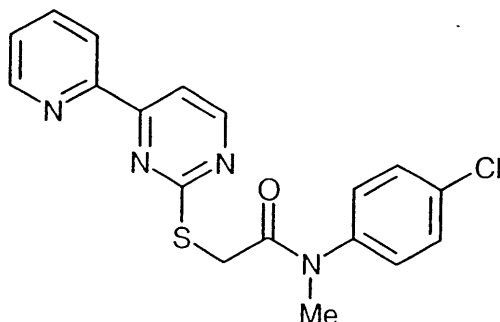
HPLC: log P (pH 2.3) = 2.74

50

【実施例 3】

【0452】

【化76】



10

【0453】

0.57 g (3ミリモル)の4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジンチオール及び1.66 g (12ミリモル)の炭酸カリウムを最初に30 mlのアセトニトリル中に入れる。0.65 g (3ミリモル)のN-(4-クロロフェニル)-N-メチル-2-クロロアセトアミドを加え、次いで混合物を60℃で16時間攪拌する。仕上げるために、混合物を減圧下で濃縮し、水と塩化メチレンの間に分配し、有機相を乾燥し、減圧下で濃縮する。

【0454】

20

これは1.09 g (理論値の81%)のN-(4-クロロフェニル)-N-メチル-2-{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジンチオ]}アセトアミドを与える。

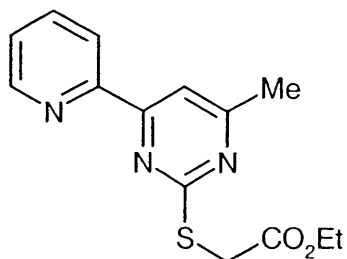
HPLC: log P (pH 2.3) = 2.73

融点 142℃。

【実施例 4】

【0455】

【化77】



30

【0456】

0.30 g (1.04ミリモル)の[(4-ブロモ-6-メチル-2-ピリミジニル)チオ]酢酸エチル、0.38 g (1.04ミリモル)の2-(トリブチルスタンニル)ピリジン及び0.06 g (0.05ミリモル)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムを最初にアルゴン下に、10 mlのキシレン中に入れ、16時間還流させる。仕上げるために、混合物を減圧下で濃縮し、粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィーにかける(移動相:ジクロロメタン)。

40

【0457】

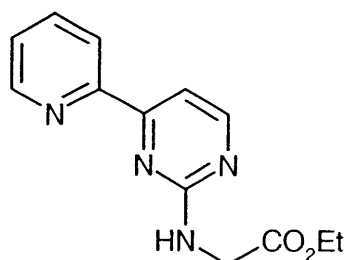
これは0.215 g (理論値の70%)の{[4-メチル-6-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]チオ}酢酸エチルを与える。

HPLC: log P (pH 2.3) = 2.45

【実施例 5】

【0458】

【化78】



【0459】

0.71 g (3ミリモル)の2-(メチルスルホニル)-4-(2-ピリジニル)ピリミジン及び0.33 g (3ミリモル)のトリエチルアミンを最初に30 mlのエタノール中に入れ、0.46 g (3.3ミリモル)のグリシン酸エチル塩酸塩を加え、混合物を16時間加熱還流する。仕上げるために、反応混合物を減圧下で濃縮し、ジクロロメタン中に取り上げ、重炭酸ナトリウム溶液及びクエン酸溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下で濃縮する。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィーにかける(移動相:ジクロロメタン/アセトン 95/5)。

【0460】

これは0.12 g (理論値の13%)のN-[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]グリシン酸エチルを与える。

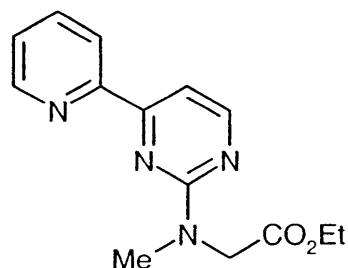
HPLC: log P (pH 2.3) = 1.14

融点 85℃。

【実施例6】

【0461】

【化79】



【0462】

0.41 g (1.74ミリモル)の2-(メチルスルホニル)-4-(2-ピリジニル)ピリミジン及び0.48 g (3.49ミリモル)の炭酸カリウムを最初に20 mlのDMF中に入れ、0.29 g (1.92ミリモル)のN-メチル-L-グリシン酸エチル塩酸塩を加え、混合物を80℃で16時間攪拌する。仕上げるために、混合物を減圧下で濃縮し、残留物をジクロロメタン中に取り上げ、混合物を重炭酸ナトリウム溶液及びクエン酸溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下で濃縮する。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィーにかける(移動相:ジクロロメタン/アセトン 95/5)。

【0463】

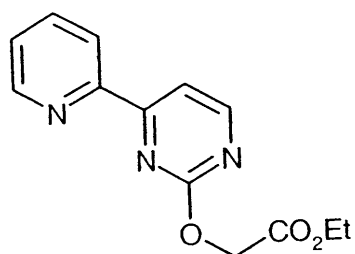
これは0.14 g (理論値の30%)のN-メチル-N-[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]グリシン酸エチルを油として与える。

HPLC: log P (pH 2.3) = 1.66。

【実施例7】

【0464】

【化80】



【0465】

10

0.71 g (3ミリモル)の2-(メチルスルホニル)-4-(2-ピリジニル)ピリミジンを最初に3 mlのグリコール酸エチル中に入れる。35℃未満の温度で、次いで0.18 g (4.5ミリモル)の水素化ナトリウム(60%)を1回に少量ずつ加える。混合物を室温でさらに30分間攪拌し、その後水を加え、混合物をジクロロメタンで抽出する。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィーにかける(移動相:ジクロロメタン/アセトン 95/5)。

【0466】

これは0.39 g (理論値の46%)の{[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]オキシ}酢酸エチルを与える。

HPLC: $\log P$ (pH 2.3) = 1.73

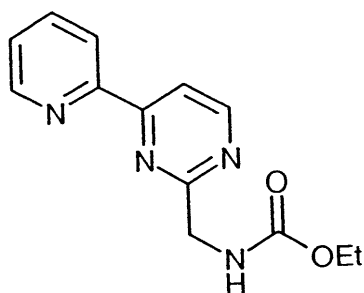
20

融点 48~53℃

【実施例8】

【0467】

【化81】



30

【0468】

0.88 g (5ミリモル)の3-(ジメチルーアミノ)-1-(2-ピリジニル)-2-プロペン-1-オン、0.91 g (5ミリモル)のメチル2-アミノ-2-イミノエチルカルバメート塩酸塩及び0.68 g (10ミリモル)のナトリウムエトキシドを最初に20 mlのエタノール中に入れ、16時間還流させる。仕上げるために、混合物を減圧下で濃縮し、残留物をジクロロメタン中に取り上げ、混合物をクエン酸溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下で濃縮する。

40

【0469】

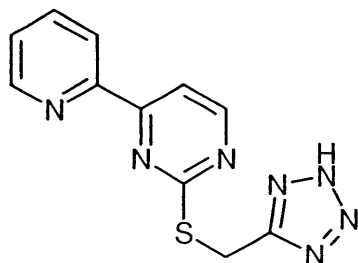
これは0.35 g (理論値の25%)のエチル[4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジニル]メチルカルバメートを与える。

HPLC: $\log P$ (pH 2.3) = 1.14。

【実施例9】

【0470】

【化82】



【0471】

10

30 ml のトルエン中の 0.6 g (2.6 ミリモル) の 4-(2-ピリジニル)-ピリミジン-2-チオアセトニトリル及び 0.54 g (2.6 ミリモル) のトリメチル錫アジドを 16 時間加熱還流する。仕上げるために、混合物を濃縮し、残留物を水酸化ナトリウム溶液 (水中の 10% 濃度) 中に溶解し、混合物を濾過して溶解しない成分を除去する。塩酸 (水中の 10% 濃度) を用いて濾液を pH 4 に調節し、酢酸エチルで抽出する。有機相を乾燥し、減圧下で濃縮する。最後に残る微量の錫誘導体を除去するために、粗生成物をジクロロメタン中に溶解し、飽和フッ化カリウム溶液と一緒に 5 時間攪拌する。有機相をもう一度乾燥し、減圧下で濃縮する。

【0472】

20

これは 0.4 g (理論値の 57%) の 4-(2-ピリジニル)-ピリミジン-2-チオメチル-テトラゾールを与える。

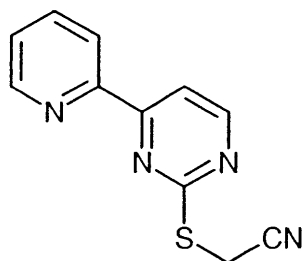
融点 162 °C。

出発物質の製造

式 (XIV) のニトリル

【0473】

【化83】



30

【0474】

30 ml のエタノール中の 0.95 g (5 ミリモル) の 4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジンチオール、0.75 g (10 ミリモル) のクロロアセトニトリル及び 2.46 g (30 ミリモル) の酢酸ナトリウムを還流下で 6 時間煮沸し、次いで濃縮する。混合物をジクロロメタンと水の間で分配し、次いで有機相を分離し、乾燥し、濃縮する。

【0475】

40

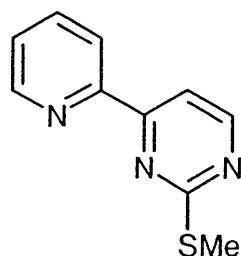
これは 0.95 g (理論値の 75%) の 4-(2-ピリジニル)-ピリミジン-2-チオアセトニトリルを与える。

HPLC: log P (pH 2.3) = 1.68。

式 (XVI) のメチルチオ誘導体

【0476】

【化84】



【0477】

4.73 g (25ミリモル)の4-(2-ピリジニル)-2-ピリミジンチオール及び5.18 g (37.5ミリモル)の炭酸カリウムを最初に50 mlのアセトニトリル中に入れる。3.55 g (25ミリモル)のヨードメタンを滴下し、混合物を40℃で16時間攪拌する。仕上げるために、混合物を減圧下で濃縮し、残留物を水と塩化メチレンの間で分配し、有機相を乾燥し、減圧下で濃縮する。

【0478】

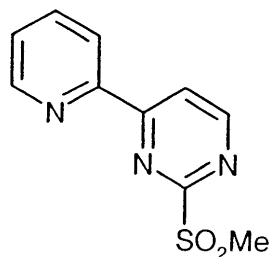
これは4.45 g (理論値の81%)の2-(メチルチオ)-4-(2-ピリジニル)ピリミジンを与える。

HPLC: $\log P(\text{pH } 2.3) = 1.93$ 。

式(VII)のメチルスルホニルピリミジン

【0479】

【化85】



【0480】

4.07 g (20ミリモル)の2-(メチルチオ)-4-(2-ピリジニル)ピリミジンを100 mlのジクロロメタン中に溶解する。氷-冷しながら、10.85 g (44ミリモル)のm-クロロ過安息香酸(70%濃度)を1回に少量ずつ加え、混合物を室温で16時間攪拌する。有機相を飽和重炭酸ナトリウム溶液及び重亜硫酸ナトリウム溶液で連続して洗浄し、乾燥し、減圧下で濃縮する。

【0481】

これは3.6 g (理論値の53%)の2-(メチルスルホニル)-4-(2-ピリジニル)ピリミジンを与える。

HPLC: $\log P(\text{pH } 2.3) = 0.99$ 。

【0482】

下記の表に挙げる化合物を上記の本発明に従う方法の1つに従って製造することができる。

【0483】

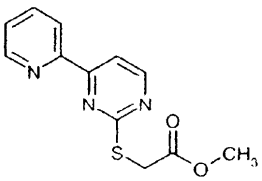
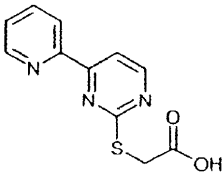
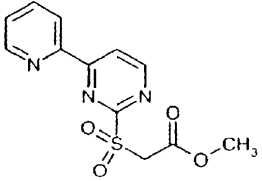
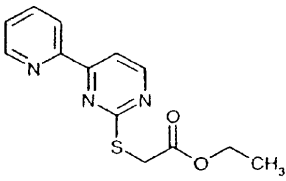
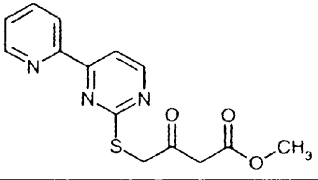
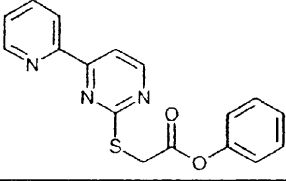
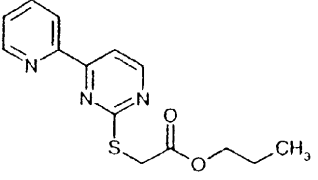
【表1】

10

20

30

40

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
10		1.81	95
11		1.14	181
12		1.37	125
13		2.17	78-80
14		1.76	
15		2.88	
16		2.76	

10

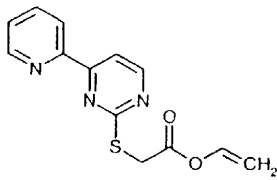
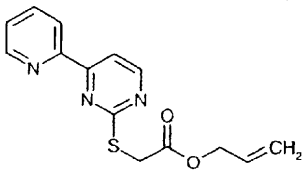
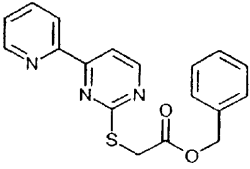
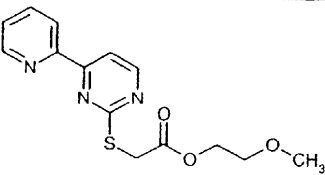
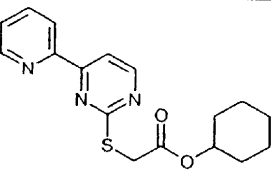
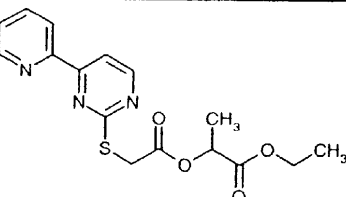
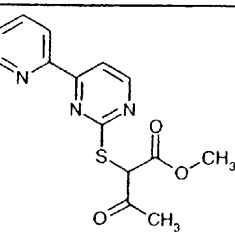
20

30

40

【 0 4 8 4 】

【 表 2 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
17		2.34	108
18		2.40	68
19		2.99	88
20		1.97	
21		3.53	
22		2.58	
23		2.34	95

10

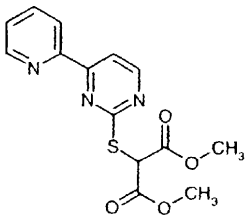
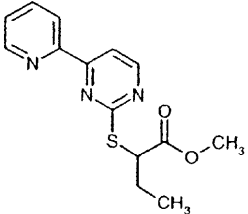
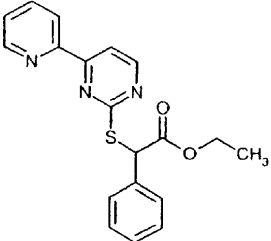
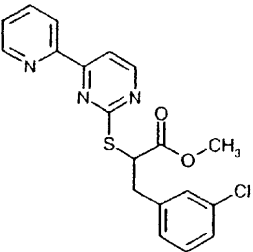
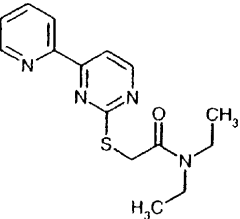
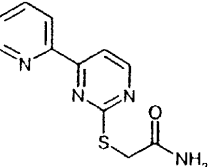
20

30

40

【 0 4 8 5 】

【 表 3 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
24		2.16	
25		2.68	
26		3.50	118
27		3.84	
28		1.80	120
29		0.69	172

10

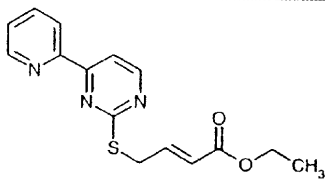
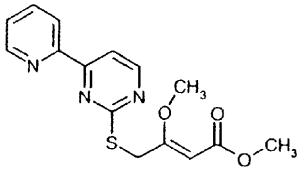
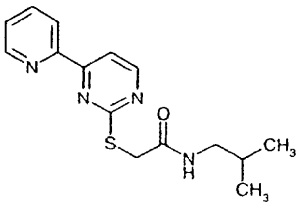
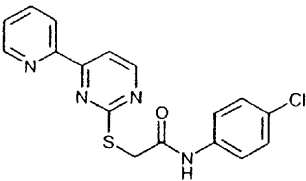
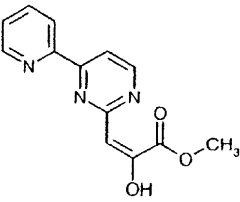
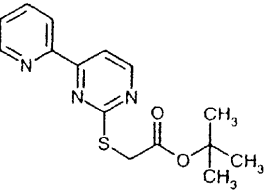
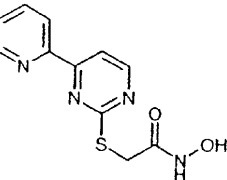
20

30

40

【 0 4 8 6 】

【 表 4 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
30		2.92	
31		2.70	
32		1.81	
33		2.58	
34		1.89	183
35		2.96	86
36		0.55	157

10

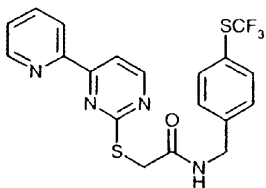
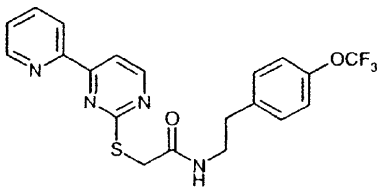
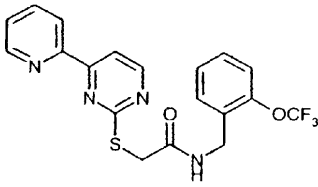
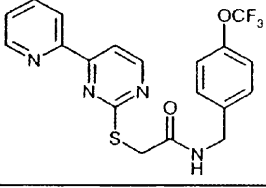
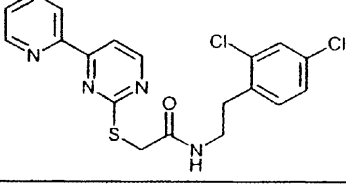
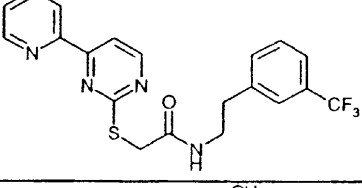
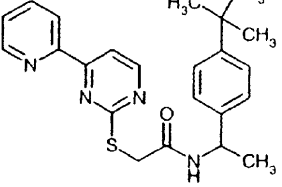
20

30

40

【 0 4 8 7 】

【 表 5 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
37		2.93	
38		2.96	
39		2.72	
40		2.76	
41		2.83	
42		2.82	
43		3.40	

10

20

30

40

【 0 4 8 8 】

【 表 6 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
44		2.64	
45		2.69	
46		2.62	
47		2.64	
48		2.42	
49		2.01	
50		2.58	

10

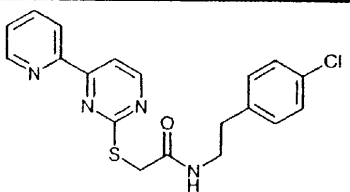
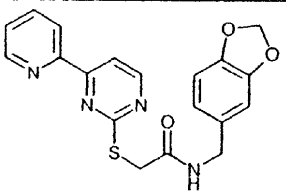
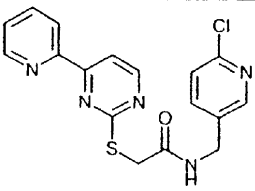
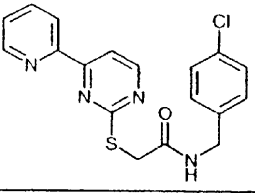
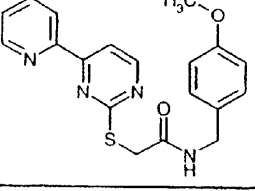
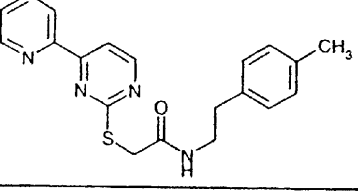
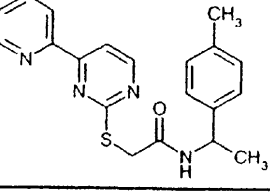
20

30

40

【 0 4 8 9 】

【 表 7 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
51		2.58	
52		1.94	
53		1.71	
54		2.38	
55		2.00	
56		2.56	
57		2.48	

10

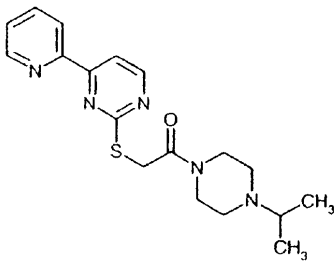
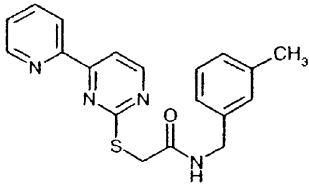
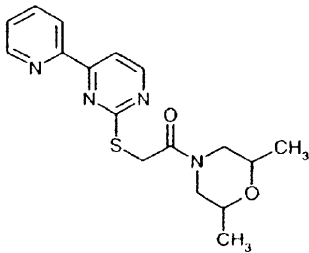
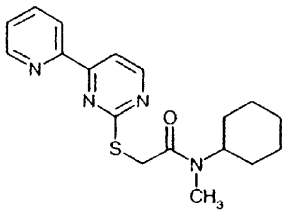
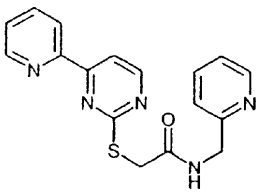
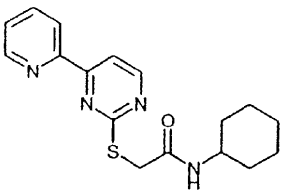
20

30

40

【 0 4 9 0 】

【 表 8 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
58		0.95	
59		2.29	
60		1.94	
61		2.67	
62		1.14	
63		2.31	

10

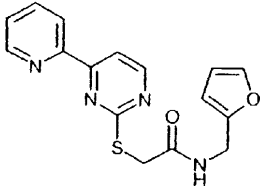
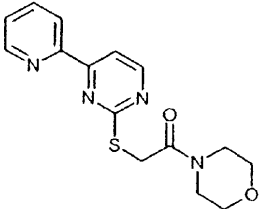
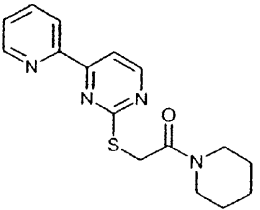
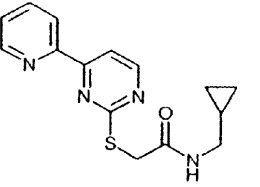
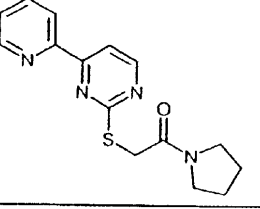
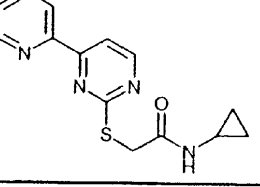
20

30

40

【 0 4 9 1 】

【 表 9 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
64		1.82	
65		1.55	
66		2.09	
67		1.83	
68		1.75	
69		1.56	

10

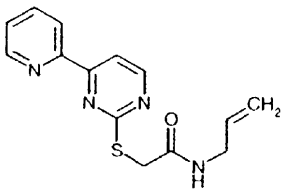
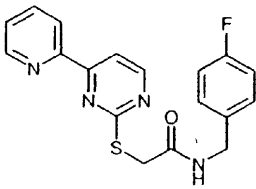
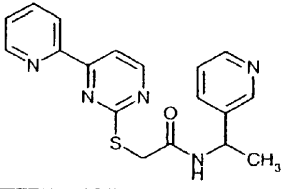
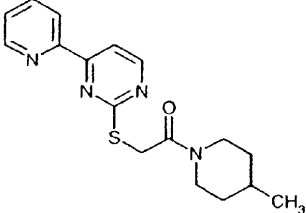
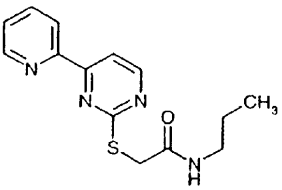
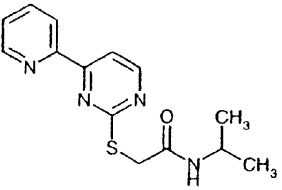
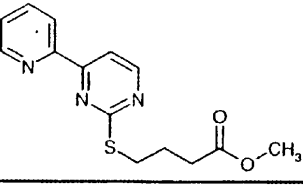
20

30

40

【 0 4 9 2 】

【 表 1 0 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
70		1.65	
71			
72			
73			
74			
75			
76		2.35	

10

20

30

40

【 0 4 9 3 】

【 表 1 1 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
77		3.46	136
78		2.13	87-95
79		2.68	
80		3.96	
81			
82			
83		3.37	

10

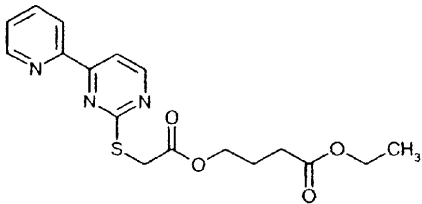
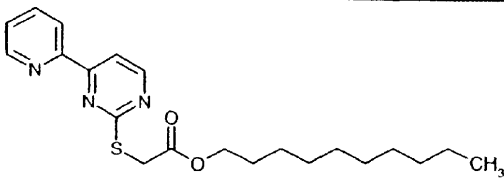
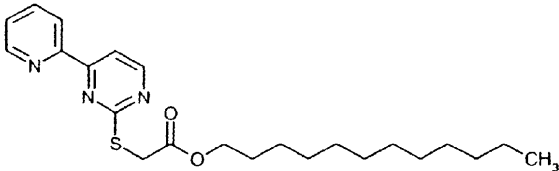
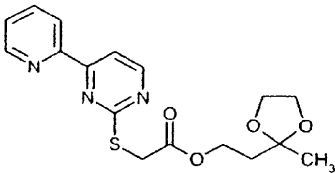
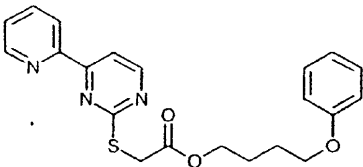
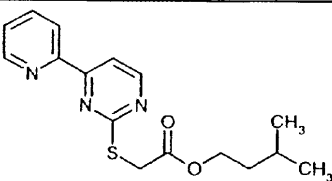
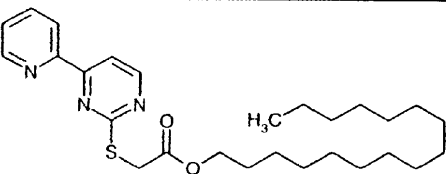
20

30

40

【 0 4 9 4 】

【 表 1 2 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
84		2.72	
85		6.15	
86		7.22	
87			
88		3.86	
89		3.56	
90			

10

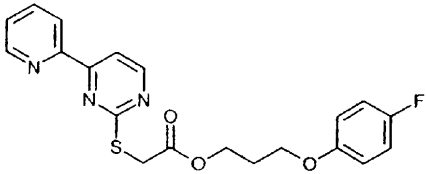
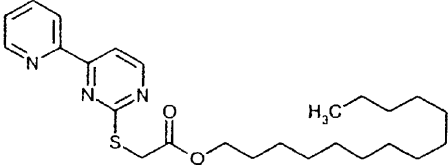
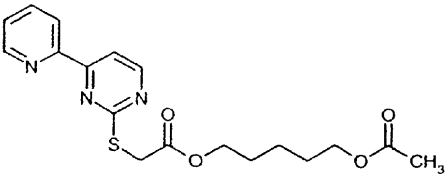
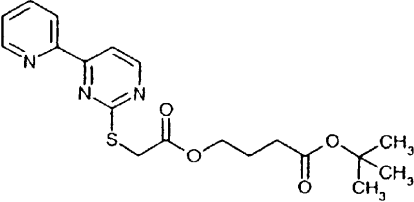
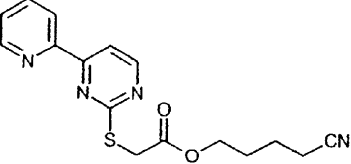
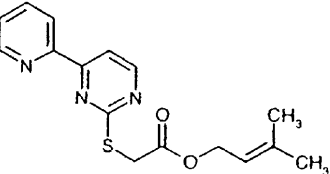
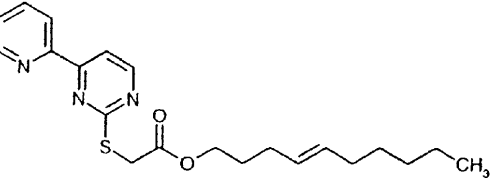
20

30

40

【 0 4 9 5 】

【表 1 3】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
91		3.59	
92			
93		2.82	
94		3.48	
95		2.29	
96		3.18	
97			

10

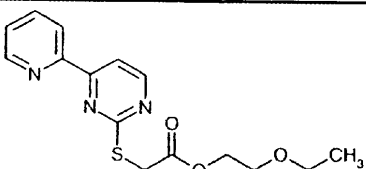
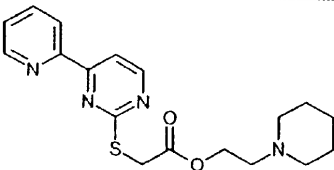
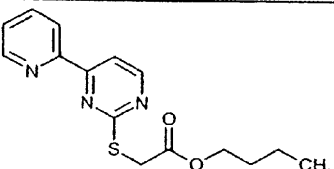
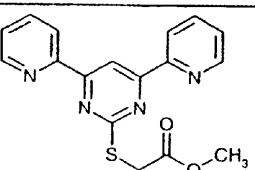
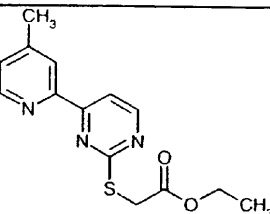
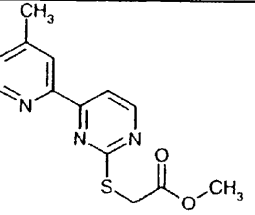
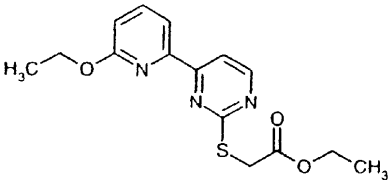
20

30

40

【 0 4 9 6 】

【 表 1 4 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
98		2.34	
99		1.04	
100		3.07	
101		2.81	117
102		2.20	60
103		1.80	105
104		3.67	

10

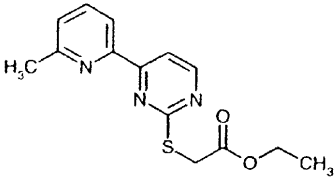
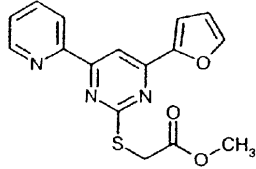
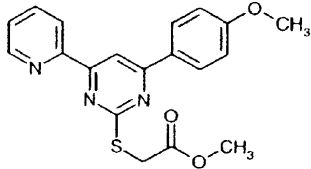
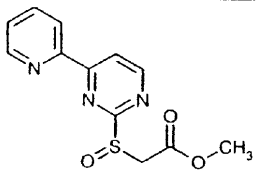
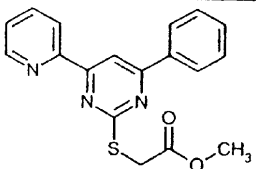
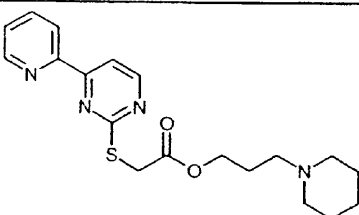
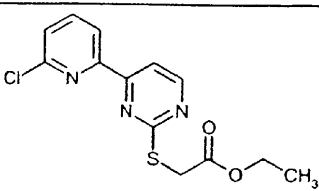
20

30

40

【 0 4 9 7 】

【 表 1 5 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
105		2.46	
106		3.01	
107		3.50	
108		0.89	
109		3.57	
110		1.13	
111		3.19	

10

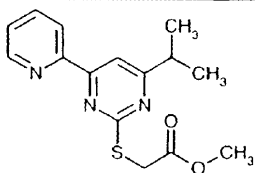
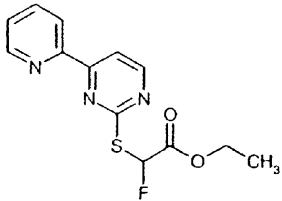
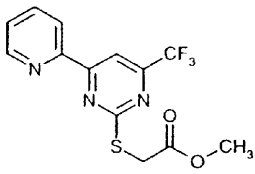
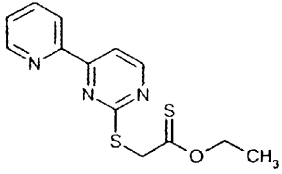
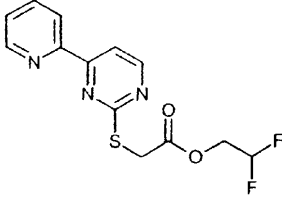
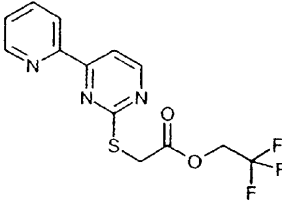
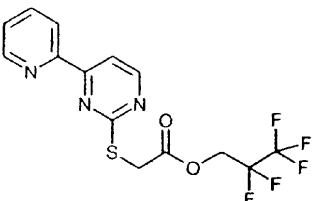
20

30

40

【 0 4 9 8 】

【 表 1 6 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
112		3.11	
113		2.55	
114		3.34	
115		3.30	
116		2.25	
117		2.69	
118		3.24	

10

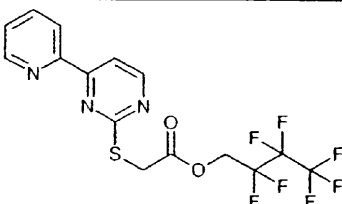
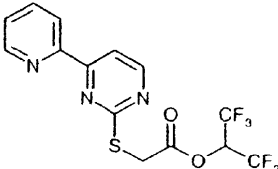
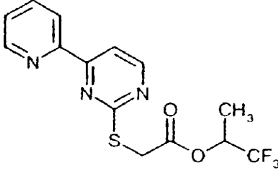
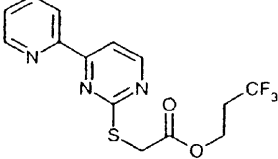
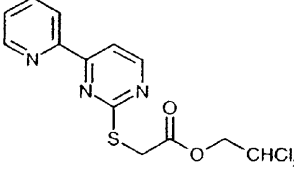
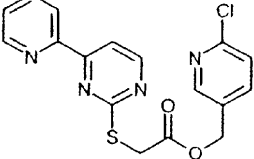
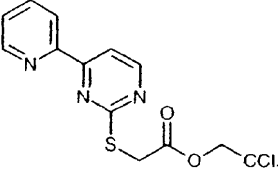
20

30

40

【 0 4 9 9 】

【 表 1 7 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
119		3.37	
120		3.59	
121		3.06	
122		2.26	
123		2.78	
124		2.31	
125		3.31	

10

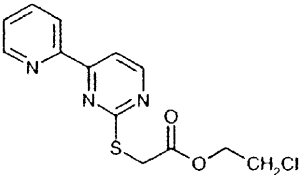
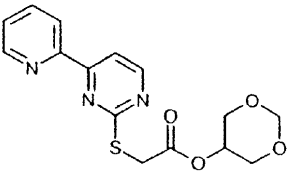
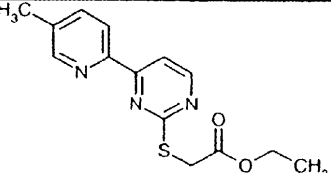
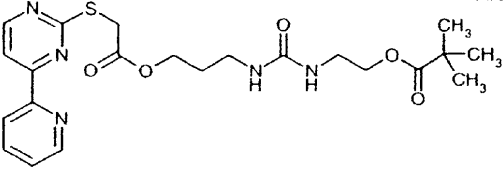
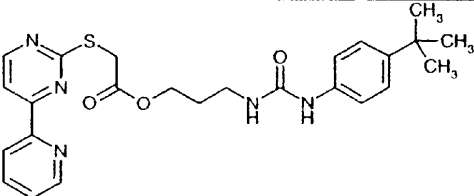
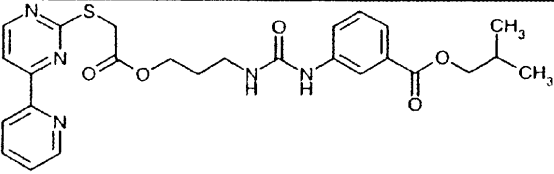
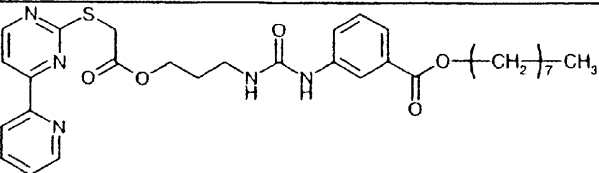
20

30

40

【0500】

【表18】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
126		2.29	
127		1.76	
128		2.50	
129		2.51	
130		3.51	
131		3.45	
132			

10

20

30

40

【0501】

【表19】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
133		3.06	
134		0.43	184
135		2.23	220
136		0.44	195
137		3.22	
138		2.92	

10

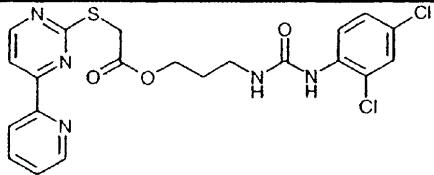
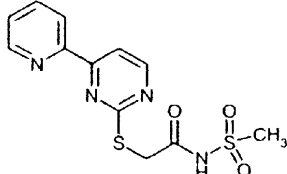
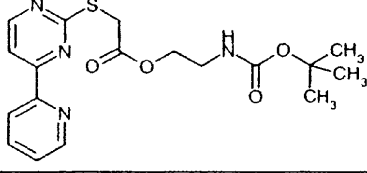
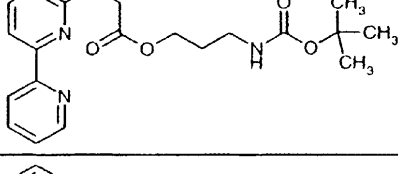
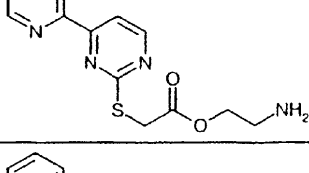
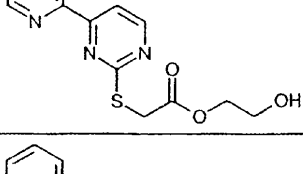
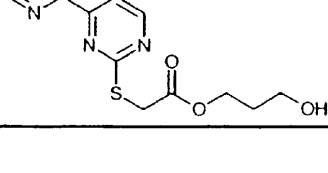
20

30

40

【0502】

【表20】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
139		3.20	
140		1.13	
141		2.63	
142		2.79	
143			
144			
145			

10

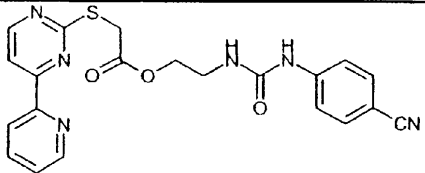
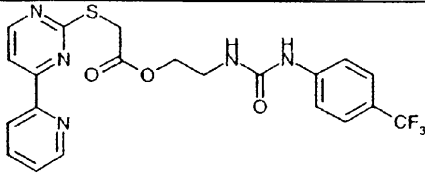
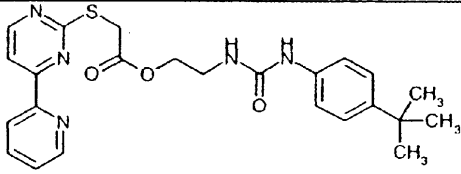
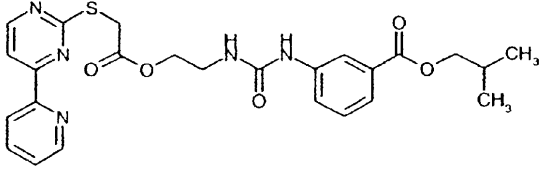
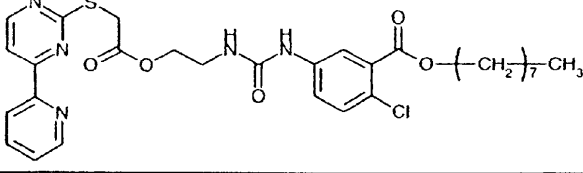
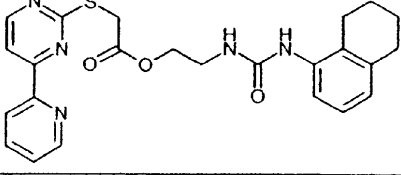
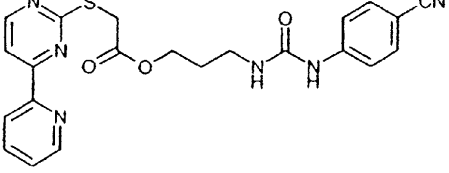
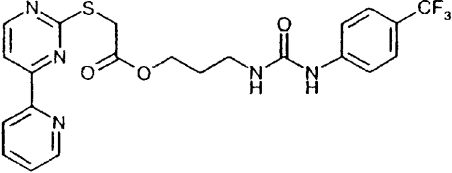
20

30

40

【 0 5 0 3 】

【 表 2 1 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
146		2.3	
147		3.04	
148		3.35	
149		3.01	
150		4.95	
151		2.94	
152		2.45	
153		3.2	

10

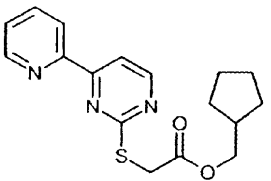
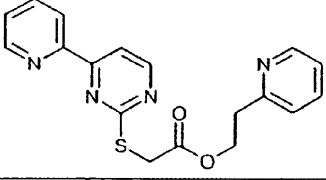
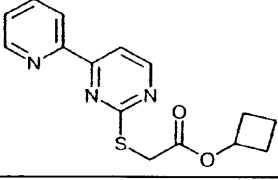
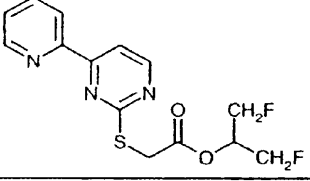
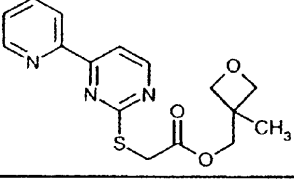
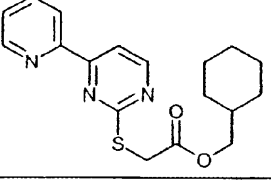
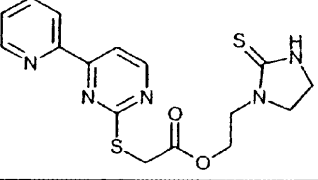
20

30

40

【 0 5 0 4 】

【 表 2 2 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
154		3.60	
155			
156			
157			
158		1.98	
159		4.00	
160		1.59	

10

20

30

40

【 0 5 0 5 】

【 表 2 3 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
161		1.16	
162			
163		1.11	
164		2.05	
165		1.64	
166			
167			

10

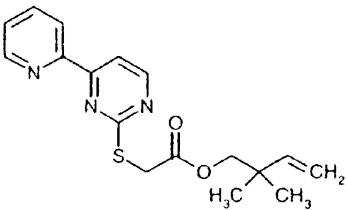
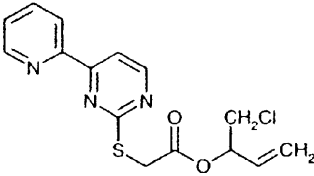
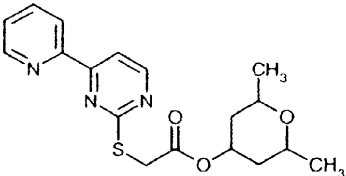
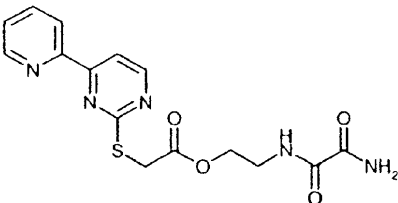
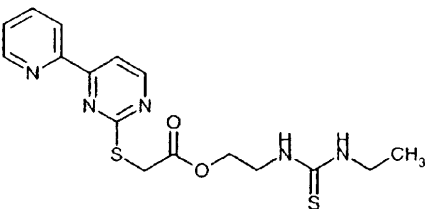
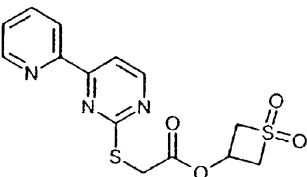
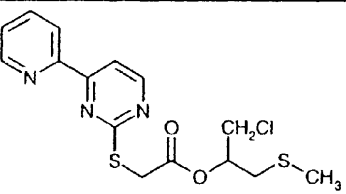
20

30

40

【 0 5 0 6 】

【 表 2 4 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
168		3.48	
169			
170			
171			
172		1.79	
173		1.67	
174			

10

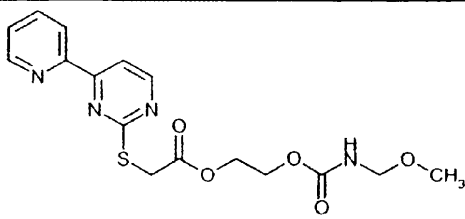
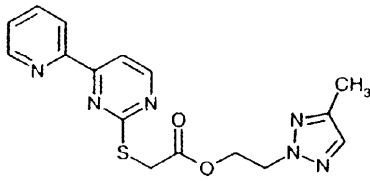
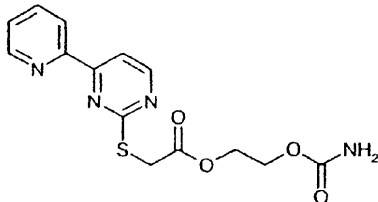
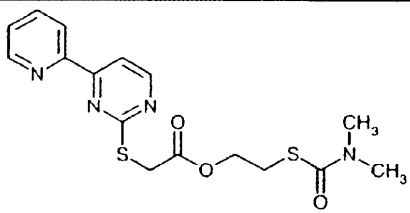
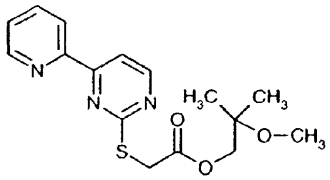
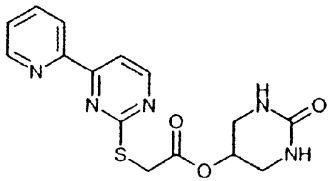
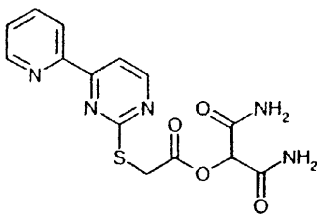
20

30

40

【 0 5 0 7 】

【 表 2 5 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
175		1.64	
176		1.93	
177		1.41	
178		2.20	
179		2.29	
180			
181			

10

20

30

40

【 0 5 0 8 】

【 表 2 6 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
182			
183			
184			
185			
186		3.46	
187			
188		1.97	

10

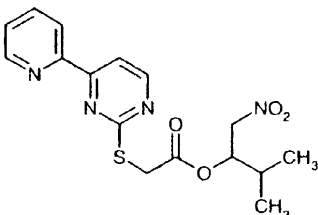
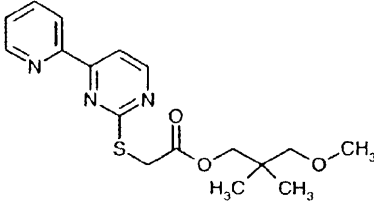
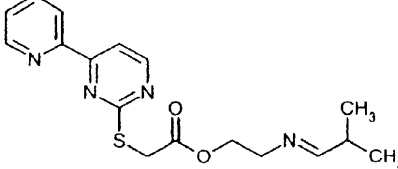
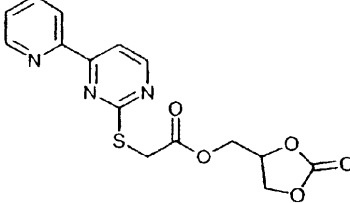
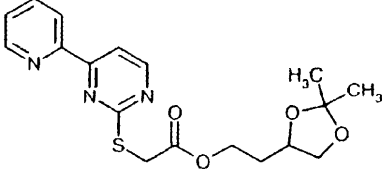
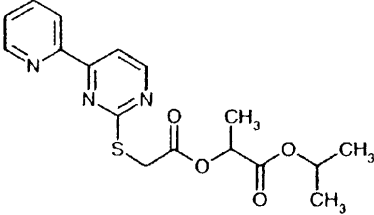
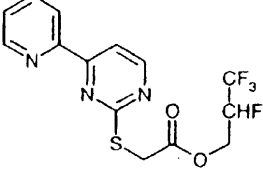
20

30

40

【0509】

【表27】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
189			
190		3.05	
191		2.02	
192		1.63	
193		2.46	
194		2.95	
195		2.72	

10

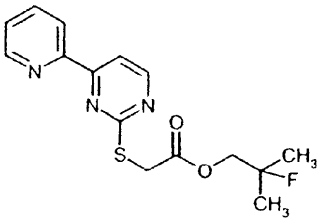
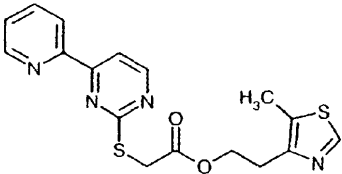
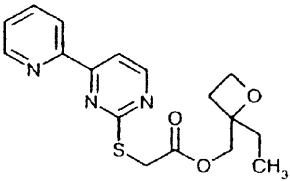
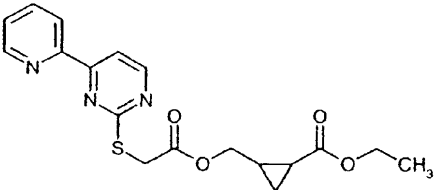
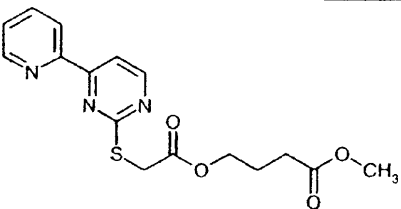
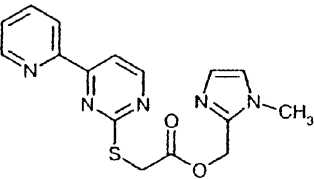
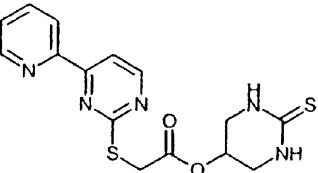
20

30

40

【 0 5 1 0 】

【 表 2 8 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
196		2.66	
197		1.79	
198		2.20	
199		2.64	
200		2.21	
201		1.02	
202			

10

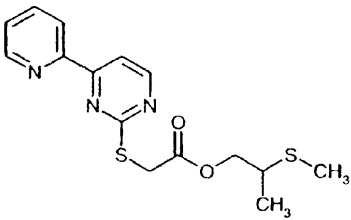
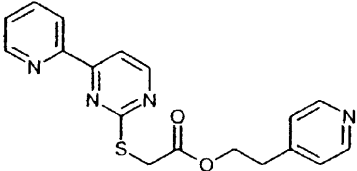
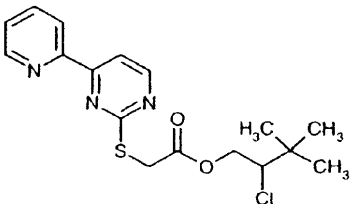
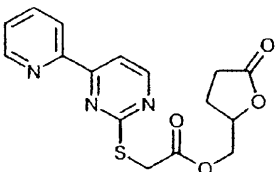
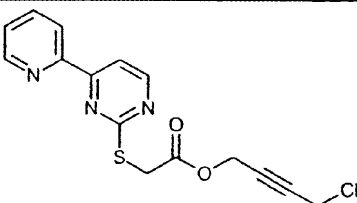
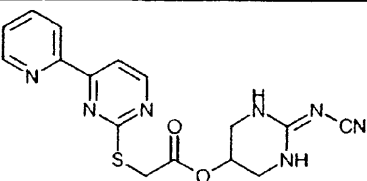
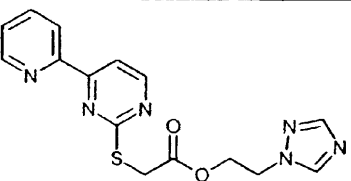
20

30

40

【 0 5 1 1 】

【 表 2 9 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
203		2.78	
204		1.20	
205		3.81	
206		1.64	
207		2.61	
208			
209		1.32	

10

20

30

40

【 0 5 1 2 】

【 表 3 0 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
210		1.42	
211		2.75	
212		2.13	
213		1.42	
214		2.13	
215		3.48	
216		2.04	

10

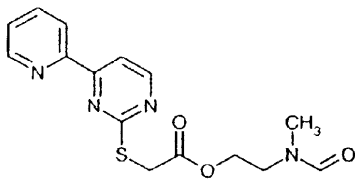
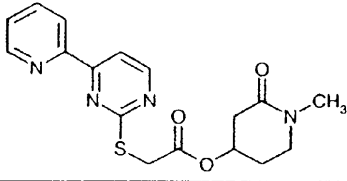
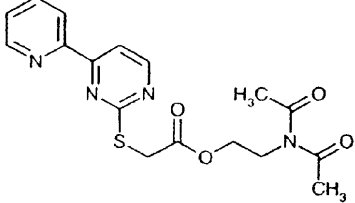
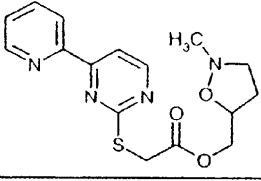
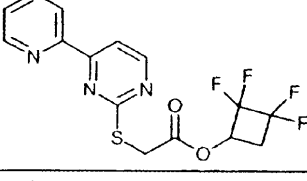
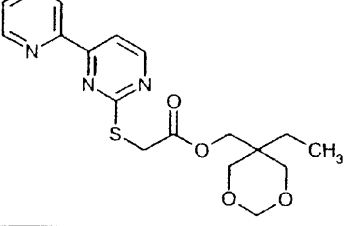
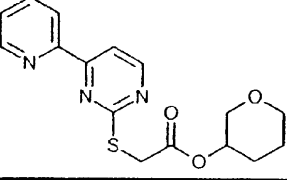
20

30

40

【 0 5 1 3 】

【 表 3 1 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
217		1.40	
218			
219			
220		1.12	
221		3.00	
222		2.51	
223			

10

20

30

40

【0 5 1 4】

【表 3 2】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
224		2.49	
225			
226			
227			
228			
229			
230		1.96	

10

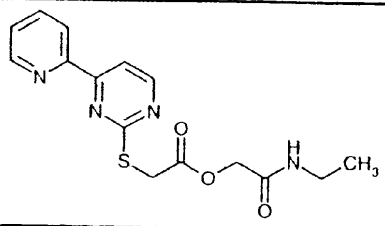
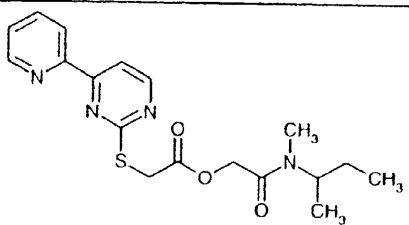
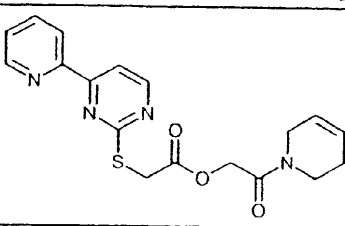
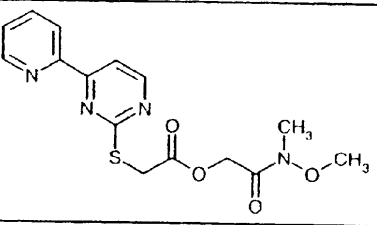
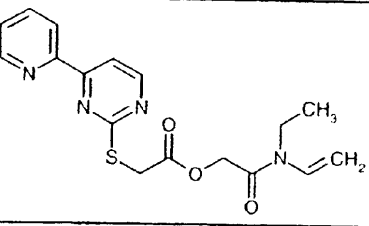
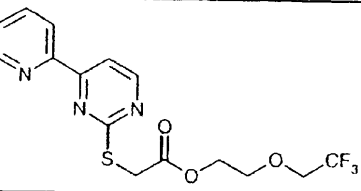
20

30

40

【 0 5 1 5 】

【 表 3 3 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
231		1.97	
232			
233			
234		1.97	
235			
236		2.70	

10

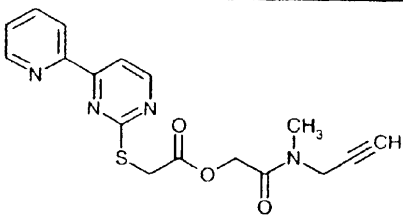
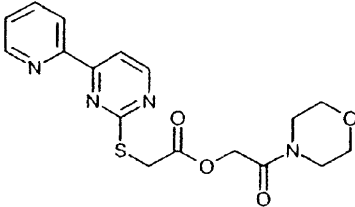
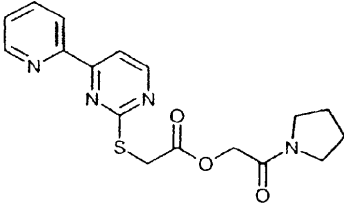
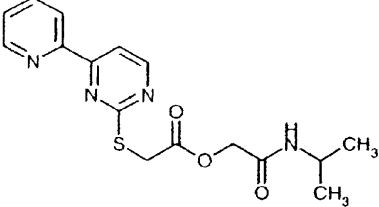
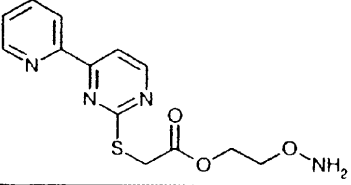
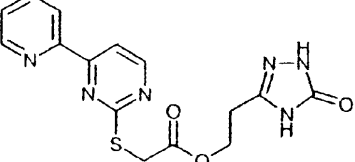
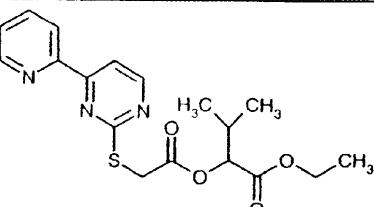
20

30

40

【 0 5 1 6 】

【 表 3 4 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
237			
238			
239			
240			
241			
242			
243		3.20	

10

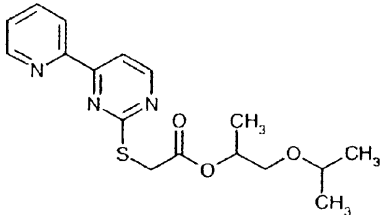
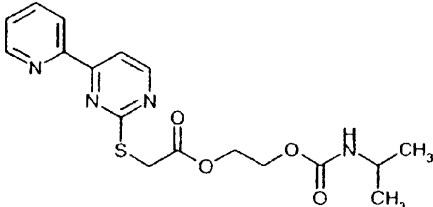
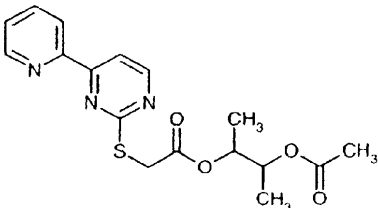
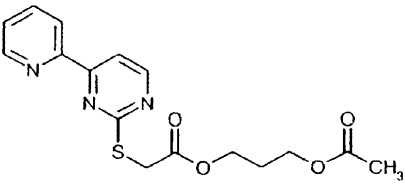
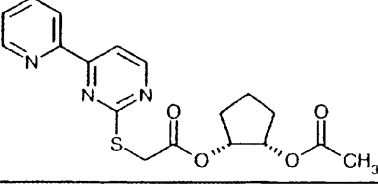
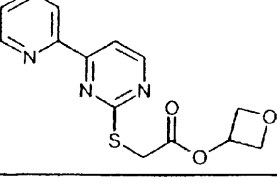
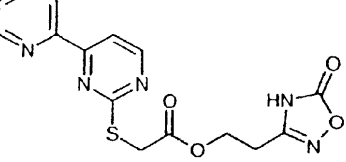
20

30

40

【 0 5 1 7 】

【 表 3 5 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
244			
245		2.19	
246		2.54	
247			
248		2.65	
249		1.69	
250		1.97	

10

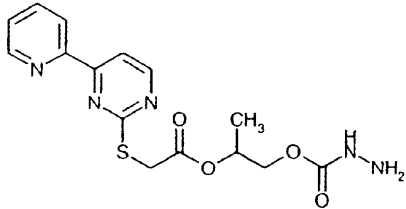
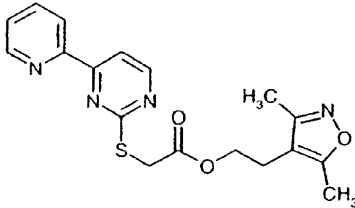
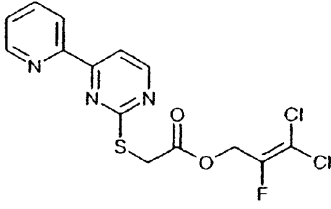
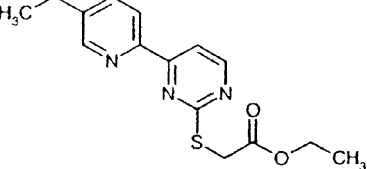
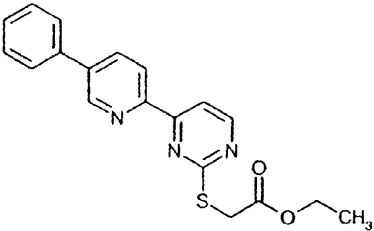
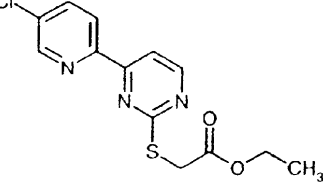
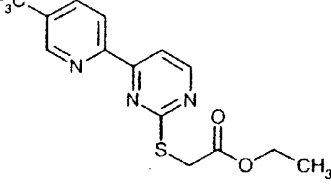
20

30

40

【 0 5 1 8 】

【 表 3 6 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
251			
252		2.25	
253		3.19	
254		2.98	
255			
256		3.23	
257		3.48	

10

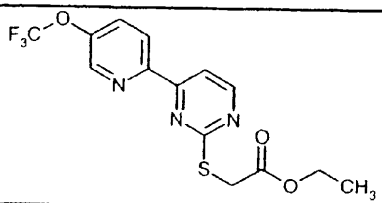
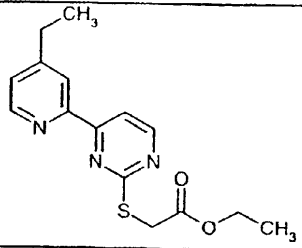
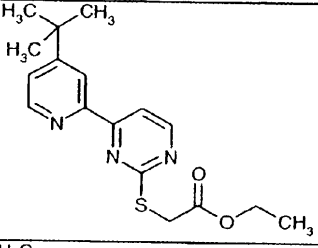
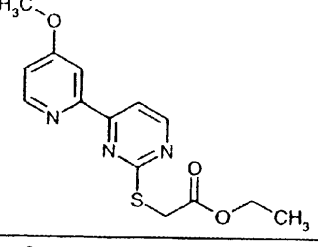
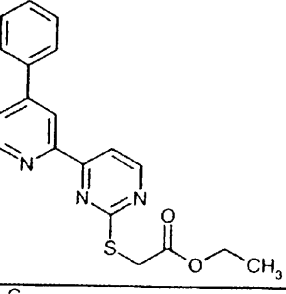
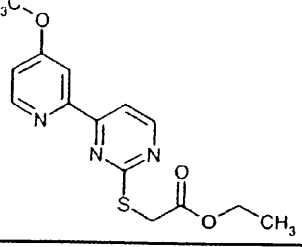
20

30

40

【 0 5 1 9 】

【 表 3 7 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
258			
259		2.69	
260			
261		1.62	
262		3.54	
263			

10

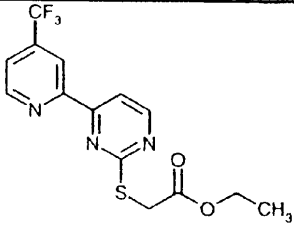
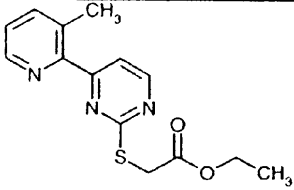
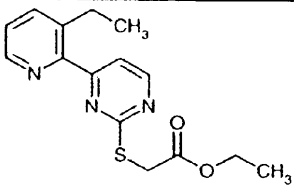
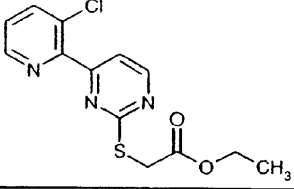
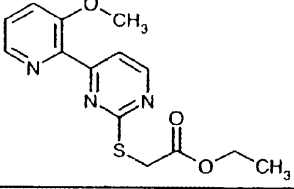
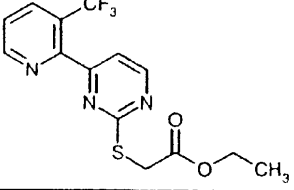
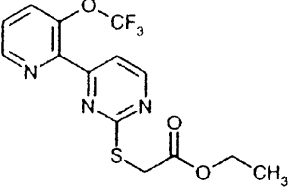
20

30

40

【0520】

【表38】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
264			
265		1.85	
266		2.22	
267			
268		1.34	
269		2.53	
270			

10

20

30

40

【 0 5 2 1 】

【 表 3 9 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
271		2.18	64-65
272			
273			
274			
275			
276			
277			

10

20

30

40

【 0 5 2 2 】

【 表 4 0 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
278			
279			
280			
281		2.04	
282			
283			
284			

10

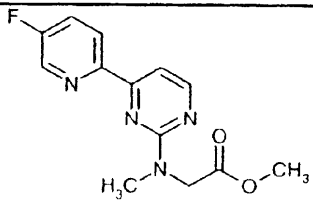
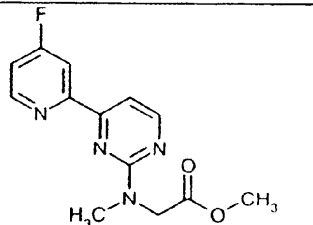
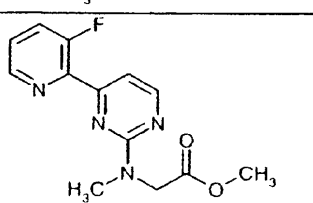
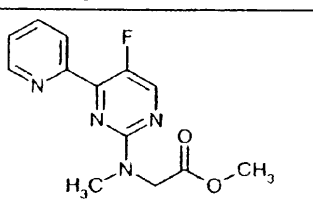
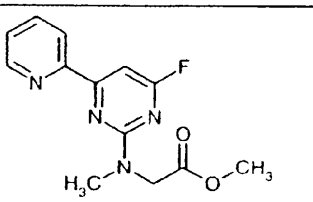
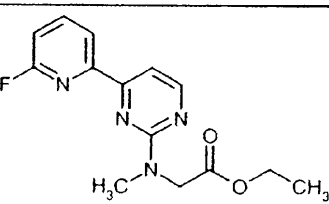
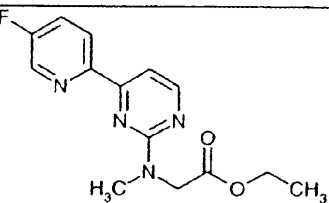
20

30

40

【 0 5 2 3 】

【 表 4 1 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
285			
286			
287			
288			
289			
290			
291			

10

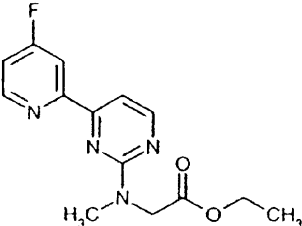
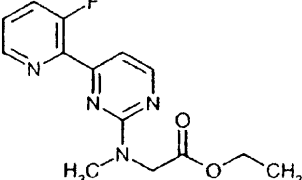
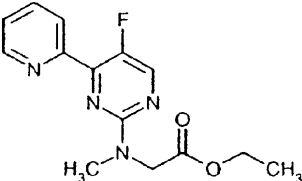
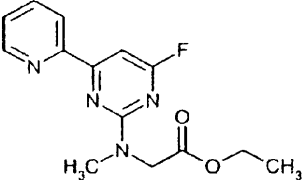
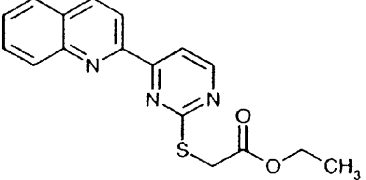
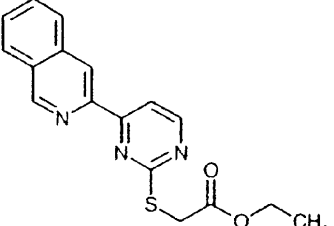
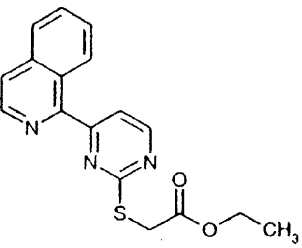
20

30

40

【 0 5 2 4 】

【 表 4 2 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
292			
293			
294			
295			
296		3.49	
297			
298		2.51	

10

20

30

40

【 0 5 2 5 】

【 表 4 3 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
299		1.17	162
300		1.59	
301		1.24	
302		2.69	
303		2.57	
304		5.37	
305		3.39	

10

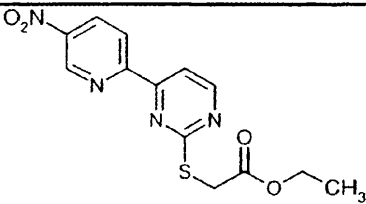
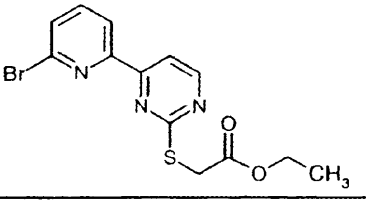
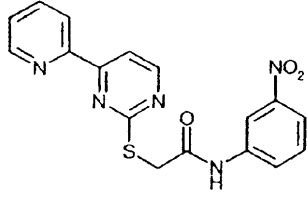
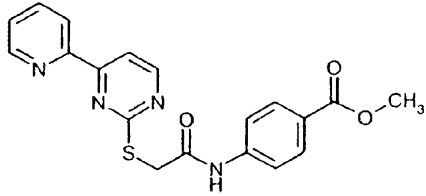
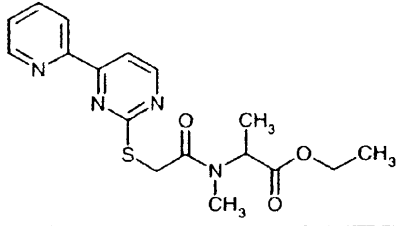
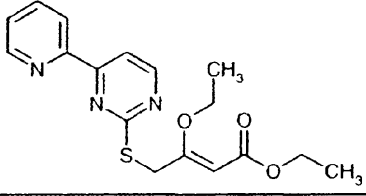
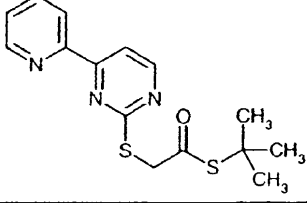
20

30

40

【 0 5 2 6 】

【 表 4 4 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
306		2.77	
307		3.31	
308		2.25	
309		2.16	
310		1.93	
311		3.39	
312		3.61	

10

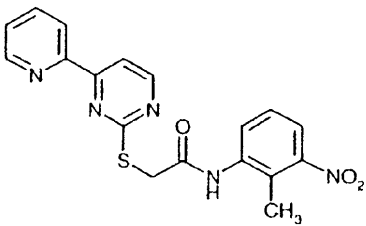
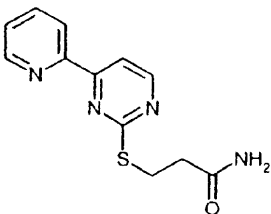
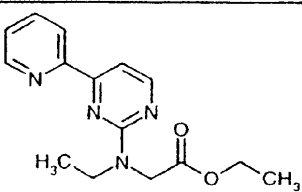
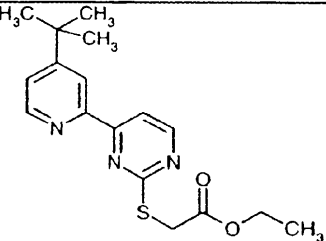
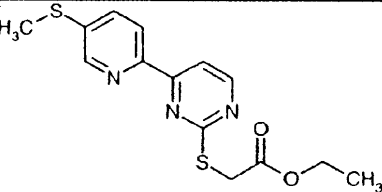
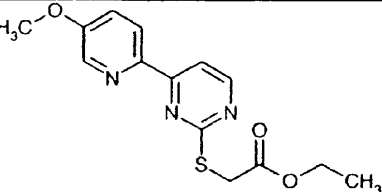
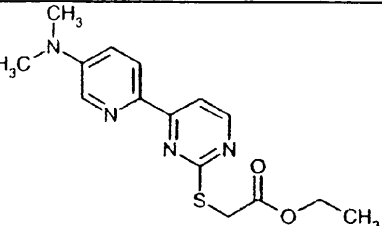
20

30

40

【 0 5 2 7 】

【 表 4 5 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
313		2.28	
314		0.96	
315		2.13	
316		3.55	
317		1.68	
318			
319			

10

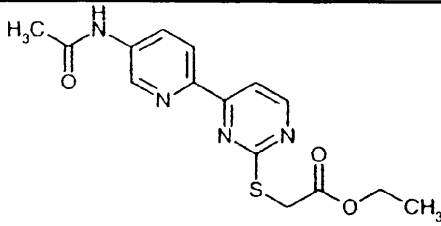
20

30

40

【 0 5 2 8 】

【 表 4 6 】

番号	構造	log P (pH 2.3)	融点/ °C
320			

10

【0529】

記載したlog P値は、EEC Directive 79/831 Annex V. A 8に従い、逆相カラム (C 18) を用いるHPLC (高性能液体クロマトグラフィー) により決定された。温度：43℃。

【0530】

酸性範囲内における決定のための移動相：0.1%リン酸水溶液、アセトニトリル；10%アセトニトリルから90%アセトニトリルまでの線状勾配。

【0531】

既知のlog P値を有する非分枝鎖状アルカン-2-オン (3～16個の炭素原子を有する) を用いてキャリブレーションを行った (2個の連続するアルカノンの間の直線状内挿を用いる、保持時間によるlog P値の決定)。

20

【0532】

ラムダマックス値は、200nm～400nmのUVスペクトルを用い、クロマトグラフィー信号の極大において決定された。

使用実施例

実施例A

【0533】

アフィス・ゴシピイ (*Aphis gossypii*) 試験

30

溶媒：30重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、乳化剤-含有水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0534】

ワタアブラムシ (アフィス・ゴシピイ) が重度に蔓延した綿の葉 (*Gossypium hirsutum*) を、所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することにより処理する。

【0535】

所望の時間の後、%における殺害を決定する。100%はすべてのアブラムシが殺されたことを意味し；0%はアブラムシが殺されなかったことを意味する。

40

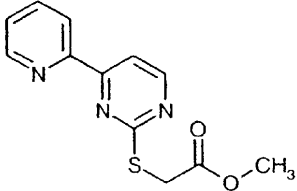
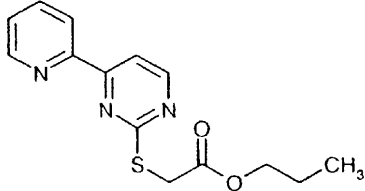
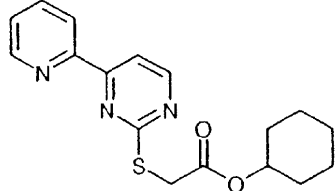
【0536】

活性化合物、活性化合物濃度及び試験結果を下記の表に示す。

【0537】

【表47】

表A
植物-損傷性昆虫
アフィス・ゴシイ試験

活性化合物	ppmにおける 活性化合物の 濃度	6日後の%に おける殺害率
	200	85
	200	85
	200	90

10

20

実施例 B

30

【0538】

フランクリネラ (Franklinella) 試験

溶媒：3重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0539】

すべての段階のアザミウマ (フランクリネラ・オクシデンタリス (Franklinella occidentalis)) が重度に蔓延したキュウリの木 (ククミス・サチブス (cucumis sativus)) に所望の濃度の活性化合物の調製物をスプレー噴霧する。

40

【0540】

所望の時間の後、%における効果を決定する。100%はすべてのアザミウマが殺されたことを意味し；0%はアザミウマが殺されなかったことを意味する。

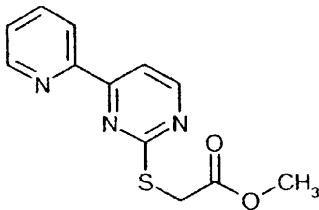
【0541】

活性化合物、活性化合物濃度及び試験結果を下記の表に示す。

【0542】

【表48】

表B
植物-損傷性昆虫
フランクリナ試験

活性化化合物	ppmlにおける 活性化化合物の 濃度	7日後の%に おける殺害率
	1000	99

10

実施例 C

20

【0543】

メロイドジネ試験

活性化化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化化合物を記載する量の溶媒及び乳化剤と混合し、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0544】

容器に砂、活性化化合物の溶液、メロイドジネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*) 卵/幼虫懸濁液及びレタスの種を満たす。レタスの種は発芽し、植物が生育する。根にえい瘤 (*gall*) が形成される。

【0545】

所望の時間の後、えい瘤の形成により、%における殺線虫作用を決定する。100%はえい瘤が見いだされなかったことを意味し；0%は処理植物上のえい瘤の数が未処理標準のそれに相当することを意味する。 30

【0546】

溶媒の量、乳化剤の量、活性化化合物、活性化化合物濃度及び試験結果を下記の表に示す。

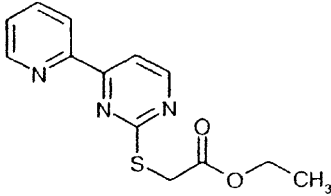
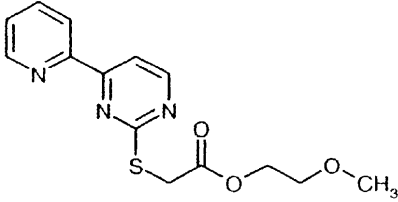
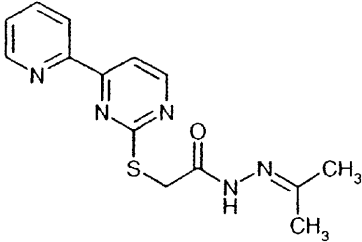
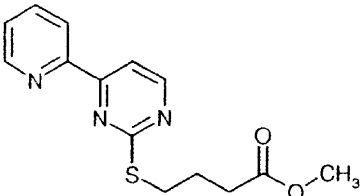
【0547】

【表49】

表C-1
植物-損傷性線虫類
メイト・ジネ試験

溶媒: 30重量部の ジメチルホルムアミド
乳化剤: 1重量部の アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物 ppmにおける 14日後の%に
濃度 活性化化合物の おける殺害率

	20	90
	20	90
	20	98
	20	90

【 0 5 4 8 】
【 表 5 0 】

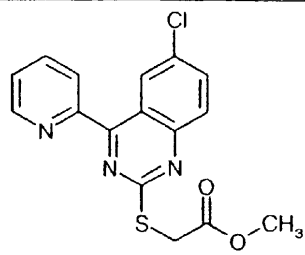
10

20

30

40

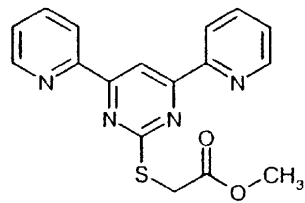
活性化合物

ppmにおける
活性化合物の
濃度14日後の%に
おける殺害率

20

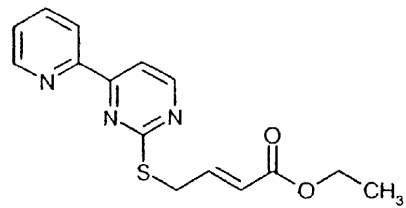
98

10



20

95



20

100

20

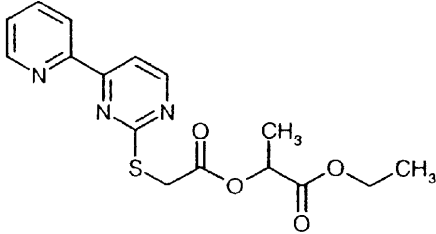
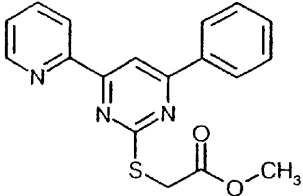
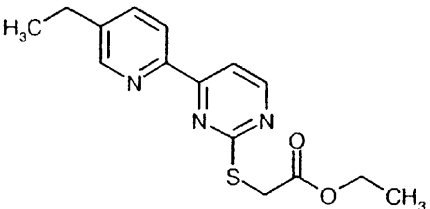
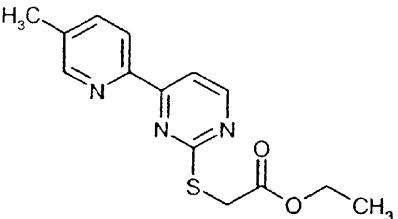
【 0 5 4 9 】

【 表 5 1 】

表C-2
植物-損傷性線虫類
メイトジネ試験

溶媒: 7重量部の ジメチルホルムアミド
乳化剤: 2重量部の アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物 ppmにおける 14日後の%に
濃度 活性化合物の おける殺害率

	20	80
	20	100
	20	90
	20	90

10

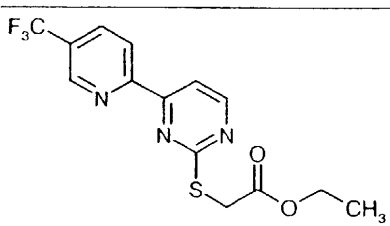
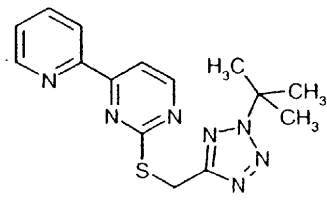
20

30

40

【 0 5 5 0 】

【 表 5 2 】

活性化化合物	ppmにおける 活性化化合物の 濃度	14日後の%に おける殺害率
	20	100
	20	90

10

実施例 D

20

【0551】

ミズス試験

活性化化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化化合物を記載する量の溶媒及び乳化剤と混合し、乳化剤-含有水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0552】

モモアカアブラムシ（ミズス・ペルシカエ（*Myzus persicae*））が重度に蔓延したキャベツの葉（ブラシカ・オレラセア（*Brassica oleracea*））を、所望の濃度の活性化化合物の調製物中に浸漬することにより処理する。

【0553】

所望の時間の後、%における殺害を決定する。100%はすべてのアブラムシが殺されたことを意味し；0%はアブラムシが殺されなかったことを意味する。

30

【0554】

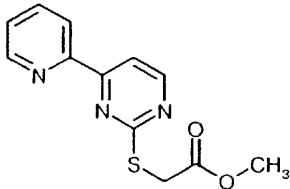
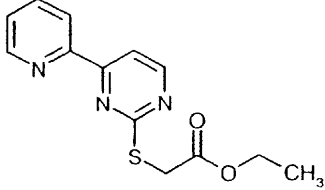
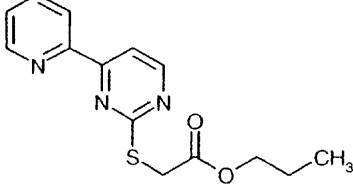
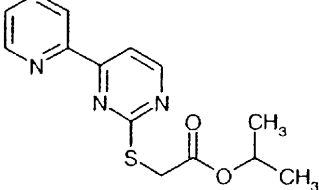
溶媒の量、乳化剤の量、活性化化合物、活性化化合物濃度及び試験結果を下記の表に示す。

【0555】

【表53】

表D-1
植物-損傷性昆虫
ミス試験

溶媒: 30重量部の シメチルホルムアミド
乳化剤: 1重量部の アルキルアリアルポリグリコールエーテル

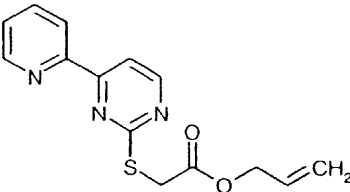
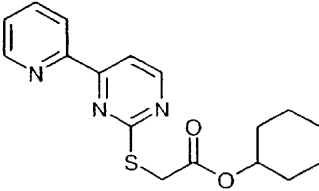
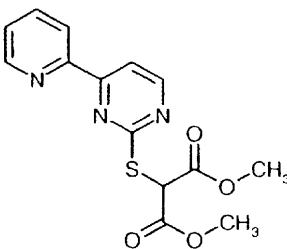
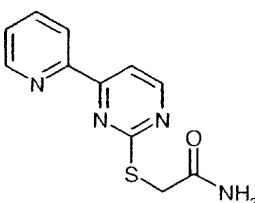
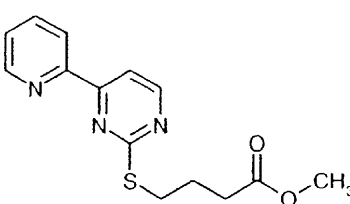
活性化化合物	ppmにおける 活性化化合物の 濃度	6日後の%に おける殺害率
	100	100
	1000	100
	1000	95
	1000	100

10

20

30

【 0 5 5 6 】
【 表 5 4 】

活性化化合物	ppmにおける 活性化化合物の 濃度	6日後の%に おける殺害率
	1000	95
	1000	100
	100	95
	1000	95
	1000	100

10

20

30

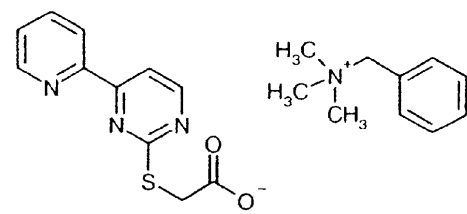
【 0 5 5 7 】

【 表 5 5 】

活性化化合物

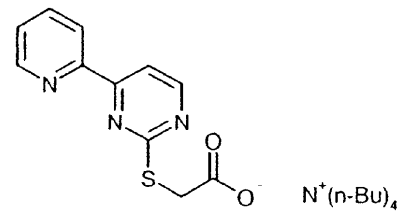
ppmにおける
活性化化合物の
濃度

6日後の%に
おける殺害率



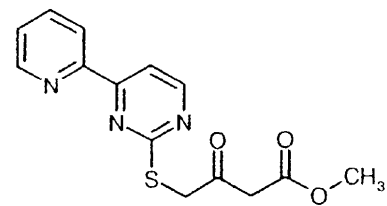
1000

100



1000

100



200

95

10

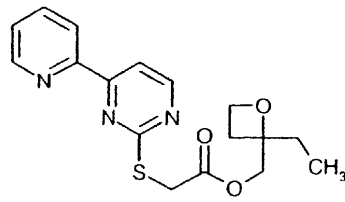
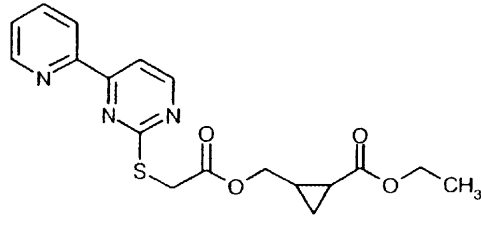
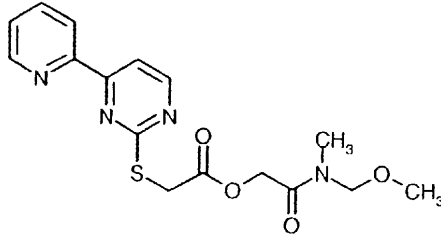
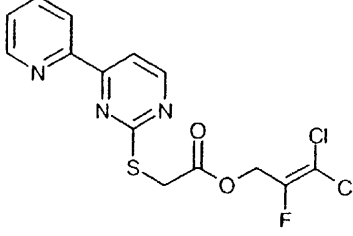
20

【 0 5 5 8 】

【 表 5 6 】

表D-2
植物-損傷性昆虫
ミス試験

溶媒: 7重量部の ジメチルホルムアミド
乳化剤: 2重量部の アルキルアールホリグリコールエーテル

活性化化合物	ppmにおける 活性化化合物の 濃度	6日後の%に おける殺害率
	500	98
	500	98
	500	98
	500	100

【 0 5 5 9 】
【 表 5 7 】

10

20

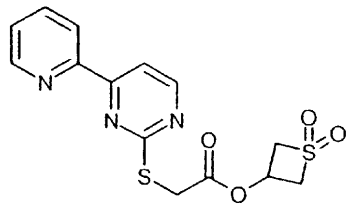
30

40

活性化化合物

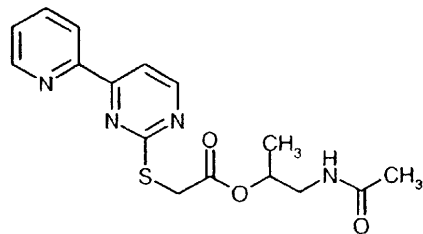
ppmにおける
活性化化合物の
濃度

6日後の%に
おける殺害率



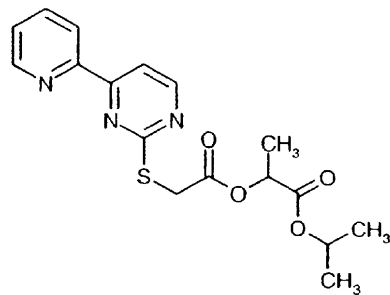
500

100



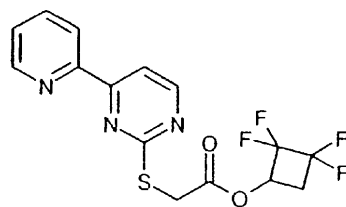
500

95



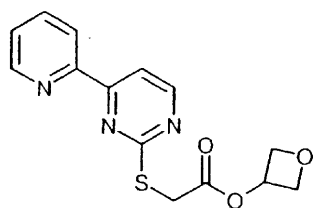
500

95



500

100



500

95

10

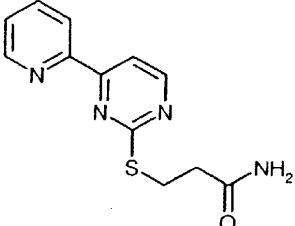
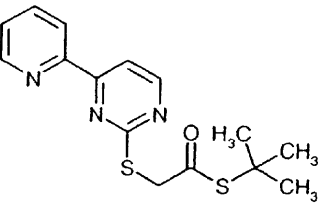
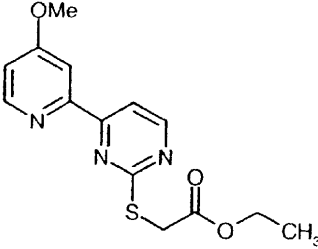
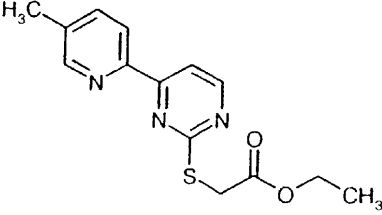
20

30

【 0 5 6 0 】

【 表 5 8 】

40

活性化化合物	ppmにおける 活性化化合物の 濃度	6日後の%に おける殺害率	
	500	80	10
	500	95	
	500	90	20
	500	98	30

実施例 E

【0561】

ファエドン幼虫試験

活性化化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化化合物を記載する量の溶媒及び乳化剤と混合し、乳化剤-含有水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0562】

キャベツの葉（ブラシカ・オレラセア）を、所望の濃度の活性化化合物の調製物中に浸漬することにより処理し、葉がまだ湿っている間にマスタードビートル（ファエドン・コクレアリアエ（*Phaedon cochleariae*））の幼虫をたからせる。

【0563】

所望の時間の後、%における殺害を決定する。100%はすべてのビートル幼虫が殺されたことを意味し；0%はビートル幼虫が殺されなかったことを意味する。

【0564】

溶媒の量、乳化剤の量、活性化化合物、活性化化合物濃度及び試験結果を下記の表に示す。

【0565】

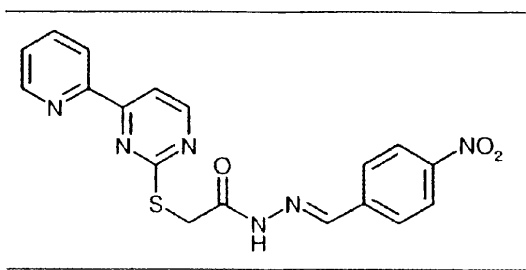
【表59】

40

50

表E-1
植物-損傷性昆虫
ファイトン幼虫試験

溶媒:	30重量部の	ジメチルホルムアミド
乳化剤:	1重量部の	アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物	ppmにおける 活性化化合物の 濃度	7日後の%に おける殺害率
 <chem>O=[N+]([O-])c1ccc(cc1)/N=C/NC(=O)CS2=CN=C(c3ccncc3)N2</chem>	1000	100

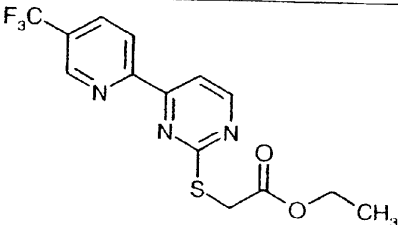
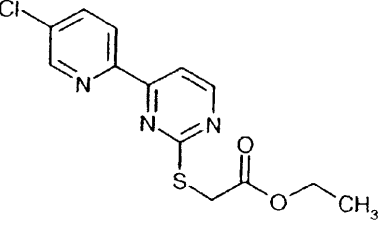
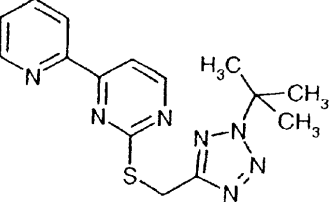
【 0 5 6 6 】
【 表 6 0 】

10

20

表E-2
植物-損傷性昆虫
ファイトン幼虫試験

溶媒: 7重量部の ジメチルホルムアミド
乳化剤: 2重量部の アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物	ppmにおける 活性化合物の 濃度	7日後の%に おける殺害率
	500	100
	500	100
	500	100

実施例 F

【0567】

スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) 試験

溶媒: 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: 2重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、乳化剤-含有水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0568】

キャベツの葉 (ブラシカ・オレラセア) を、所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することにより処理し、葉がまだ湿っている間にアワヨトウ (スポドプテラ・フルギペルダ) の毛虫をたからせる。

【0569】

所望の時間の後、%における殺害を決定する。100%はすべての毛虫が殺されたことを意味し; 0%は毛虫が殺されなかったことを意味する。

【0570】

活性化合物、活性化合物濃度及び試験結果を下記の表に示す。

【0571】

10

20

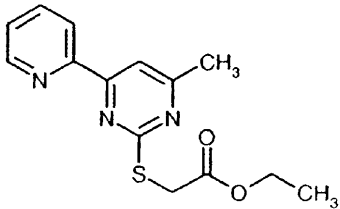
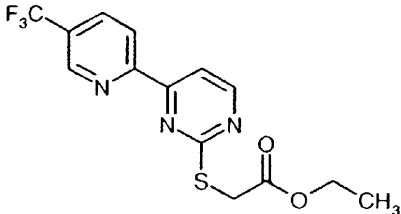
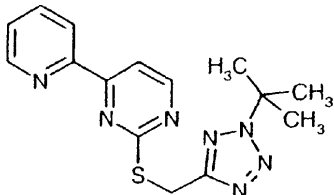
30

40

50

【表 6 1】

表F
植物-損傷性昆虫
スホトプテラ・フルギペルダ試験

活性化合物	ppmにおける 活性化合物の 濃度	7日後の%に おける殺害率
	500	100
	500	100
	500	100

10

20

30

実施例 G

【0572】

ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) 試験 (土壌中の幼虫)

限界濃度試験/土壌昆虫-形質転換植物の処理

溶媒: 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒と混合し、上記の量の乳化剤を加え、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0573】

活性化合物の調製物を土壌の上に注ぐ。ここにおいて、調製物中の活性化合物の濃度は実質的に重要ではなく、土壌の体積単位当たりの活性化合物の重量による量のみが重要であり、それは ppm (mg/l) で記載される。土壌を 0.25 リットルのポットに満たし、これらを 20 °C で放置する。

40

【0574】

調製の直後に、YIELD GUARD (Monsanto Comp., USA の商標) の品種の 5 個の発芽前のトウモロコシを各ポット中に置く。2 日後、対応する試験昆虫を処理された土壌中に入れる。さらに 7 日後、発芽したトウモロコシの木の数数を数えることにより、活性化合物の有効性を決定する (1 個の植物 = 20 % の活性)。

実施例 H

50

【0575】

ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*) 試験 (形質転換植物の処理)

溶媒: 7 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: 1 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1 重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び上記の量の乳化剤と混合し、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0576】

Roundup Ready (Monsanto Comp., USA の商標) の品種の大豆の苗条 (グリシン・マクス (*Glycine max*)) を、所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することによって処理し、葉がまだ湿っている間にタバコバドワーム (*tobacco bud worm*) の毛虫、ヘリオチス・ビレセンスをたからせる。

10

【0577】

所望の時間の後、% における殺害を決定する。100% はすべての毛虫が殺されたことを意味し; 0% は毛虫が殺されなかったことを意味する。

【国際公開パンフレット】

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
6. September 2002 (06.09.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/067684 A1(51) Internationale Patentklassifikation: A01N 43/54,
43/547, 43/553, 43/707, 43/76, 43/78, 43/80, C07D
401/04, 401/14, 405/14, 409/14, 417/14, 413/14GH, GM, IIR, IU, ID, IL, IN, IS, JP, KF, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SD, SL, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/01403

(22) Internationales Anmeldedatum:
11. Februar 2002 (11.02.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 08 481.1 22. Februar 2001 (22.02.2001) DE

Erklärung gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten 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, KF, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KF, IS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER AKTIENGESellschaft [DE/DE];
51368 Leverkusen (DE).(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BRETSCHNEIDER,
Thomas [DE/DE]; Talstr. 29 b, 53797 Lehmard (DE);
ES-SAYED, Mazen [DE/DE]; Ricarda-Huch-Str. 36,
40764 Langenfeld (DE). FISCHER, Rüdiger [DE/DE];
Zu den Fussfällen 23, 50259 Pulheim (DE). MAURER,
Fritz [DE/DE]; Brühlstr. 36, 40789 Monheim (DE).
ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüschhof
15, 42799 Leichlingen (DE). LÖSEL, Peter [GB/DE];
Lohstr. 90a, 51371 Leverkusen (DE).(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESellschaft;
SELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

WO 02/067684 A1

(54) Title: PYRIDYL PYRIMIDINES FOR USE AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: PYRIDYL-PYRIMIDINE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

(57) Abstract: The invention relates to novel pyridyl pyrimidines of formula (I), wherein R¹, R², X, n, Y, Z and R are defined as in the description. The invention further relates to several methods for producing said substances and to the use thereof as pesticides, as well as to novel intermediates and methods for producing the same.(57) Zusammenfassung: Neue Pyridylpyrimidine der Formel (I), in welcher R¹, R², X, n, Y, Z und R die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen, sowie neue Zwischenprodukte und Verfahren zu deren Herstellung.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 1 -

PYRIDYLPYRIMIDINE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Pyridylpyrimidine, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

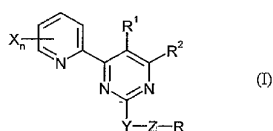
5

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte Pyridylpyrimidin-Derivate pharmazeutische Wirkung besitzen (vgl. JP 52-71481). Andere Verbindungen dieses Typs sind als Zwischenprodukte zu fungiziden Wirkstoffen beschrieben (vgl. EP 0 471 261 B1). Wieder andere Derivate sind als Komplexliganden bekannt (vgl. J. Chem. Soc., Dalton Trans. 1999, 3095-3101, Tetrahedron Lett. 1999, 40, 4779-4782) oder werden zur Synthese von polycyclischen Heterocyclen eingesetzt (vgl. Eur. J. Org. Chem. 1998, 2907-2912). Insektizid wirksame Pyridylpyrimidine sind bisher nicht bekannt.

10

Es wurden nun neue substituierte Pyridylpyrimidine der Formel (I)

15



gefunden, in welcher

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Alkyl,

20

Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkynyloxy, Halogenalkynyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, Cycloalkyl; oder für gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,

25

R¹ und R² außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauer-

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 2 -

stoff unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl substituiert sein kann,

- 5 X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy, $-S(O)_pR^3$, $-NR^4R^5$, $-COR^6$, $-CO_2R^7$, $-CSR^6$, $-CONR^4R^5$, $-NHCO_2R^8$, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht;
- 10 oder wenn n für 2, 3 oder 4 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann,
- 15 n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2, 3 oder 4 steht,
- 20 Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p-$ oder $-NR^9-$ steht,
- p für 0, 1 oder 2 steht,
- 25 Z für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$, $-(CH_2)_t-C(O)-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-S(O)_p-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ steht,
- r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,
- t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,
- 30 R für die Gruppierung

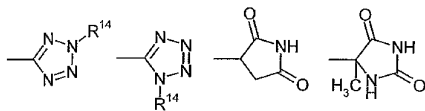
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 3 -



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



5

steht,

- A für Sauerstoff, Schwefel oder NR^{15} steht,
- 10 E für $-\text{OR}^{16}$, $-\text{SR}^{16}$, $-\text{O}-\text{M}$, $-\text{S}-\text{M}$ oder $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ steht,
- M für gegebenenfalls durch Alkyl, Aryl oder Arylalkyl substituiertes Ammonium oder für ein Alkalimetallion steht,
- 15 M außerdem für ein Erdalkalimetallion steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 20 R^3 für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- R^4 für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl oder Alkylcarbonyl steht,
- 25 R^5 für Wasserstoff, Amino, Formyl, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Oxamoyl steht,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 4 -

- R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für Alkyliden; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen;
- 5 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann,
- 10 R⁶ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl oder Arylalkyl steht,
- R⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,
- 15 R⁸ für Alkyl oder Halogenalkyl steht,
- R⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 20 R¹⁰ für Halogen, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für Aryl oder Arylalkyl, welche ihrerseits im Arylteil durch Halogen oder Alkyl substituiert sein können, steht,
- 25 R¹¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- R¹² und R¹³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl oder Alkoxy stehen,
- 30 R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

WO 02/067684

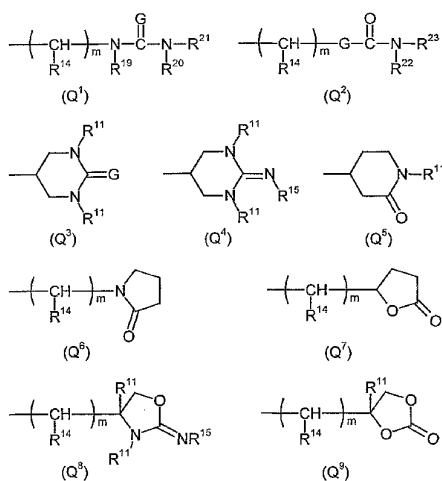
PCT/EP02/01403

- 5 -

- R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Cyano oder Dialkylamino steht,
- 5 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxy-carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxy-alkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halo-genaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Hetero-cyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,
- 10 R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cyclo-alkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Hete-rocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben
- 20 R¹⁷ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebe-nenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogen-alkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cyclo-alkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,
- 25 R¹⁸ außerdem für jeweils gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxy-carbonyl substituiertes Alkyl oder Alkenyl steht,
- 30

R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 bis 2 weitere Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann, stehen.

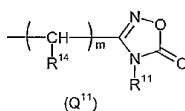
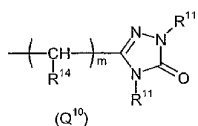
15



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 7 -



steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vor-

5

m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

10

G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder gemeinsam für Alkylen stehen,

15

R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Alkylcarbonyloxy oder Alkoxy substituiertes Alkyl; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylen substituiertes Aryl steht,

20

R²² für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

R²³ für Wasserstoff, Amino, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht.

Die Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere bzw. Regioisomere oder deren Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Sowohl die reinen Isomere als auch die Isomerengemische werden erfindungsgemäß beansprucht. Ebenso können Verbindungen der Formel (I) gegebenen-

25

WO 02/067684

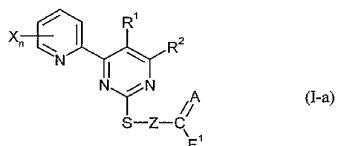
PCT/EP02/01403

- 8 -

falls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten in verschiedenen tautomeren Formen vorliegen. Alle Tautomere werden erfindungsgemäß beansprucht.

5 Ebenfalls werden erfindungsgemäß alle Pyridin- und/oder Pyrimidin-N-Oxide, die durch Verbindungen der Formel (I) gebildet werden können, beansprucht. Weiterhin fallen alle Salze von Verbindungen der Formel (I), z.B. mit Mineralsäuren wie Salzsäure, unter den Anspruch der vorliegenden Erfindung.

10 Weiterhin wurde gefunden, dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-a)



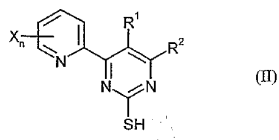
in welcher

15 R^1 , R^2 , X , n , Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

E^1 für $-OR^{16}$, $-SR^{16}$ oder $-NR^{17}R^{18}$ steht,

erhält, indem man

20 A) Thiole der Formel (II)



in welcher

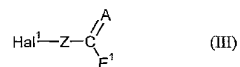
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 9 -

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogen-Verbindungen der Formel (III)



in welcher

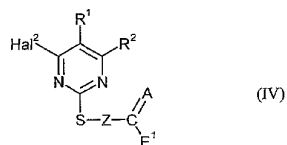
Z, A und E¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal¹ für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

oder

B) Halogenpyrimidine der Formel (IV)



in welcher

R¹, R², Z, A und E¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

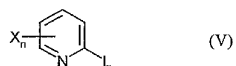
Hal² für Halogen steht,

mit Pyridin-Verbindungen der Formel (V)

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 10 -



in welcher

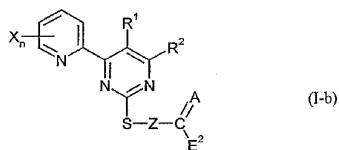
5 X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und

L für $\text{Sn}(\text{Alkyl})_3$, $\text{Sn}(\text{Aryl})_3$, ZnBr oder ZnCl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart
 10 eines Katalysators umgesetzt,

oder

C) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-b)



15

in welcher

R^1 , R^2 , X, n, Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

20 E^2 für $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ steht,

erhält, indem man

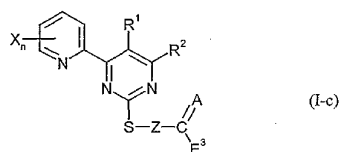
Pyridylpyrimidine der Formel (I-c)

25

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 11 -



in welcher

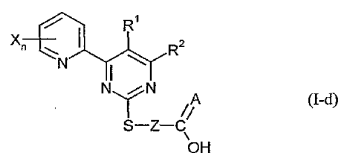
R^1 , R^2 , X , n , Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5

E^3 für $-OR^{16}$ steht, wobei R^{16} die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer ersten Stufe gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
mit einer Base behandelt und die entstandene Verbindung der Formel (I-d)

10

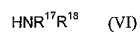


in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

in einer zweiten Stufe mit Aminen der Formel (VI)



20

in welcher

R^{17} und R^{18} die oben angegebenen Bedeutungen haben,

WO 02/067684

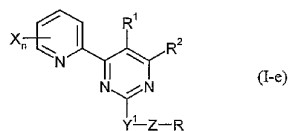
PCT/EP02/01403

- 12 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines wasserabsorbierenden Reagenzes umgesetzt,

5 oder

D) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-e)



10 in welcher

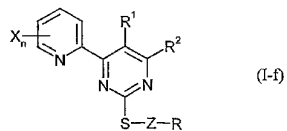
R^1 , R^2 , X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y^1 für -SO- oder -SO₂- steht,

15

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-f)



20

in welcher

R^1 , R^2 , X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

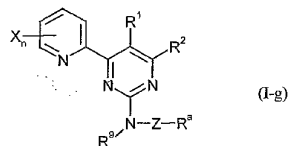
- 13 -

mit einem Oxidationsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oxidiert,

oder

5

E) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-g)

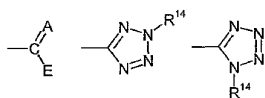


in welcher

10

R^1 , R^2 , X , n , Z und R^9 die oben angegebenen Bedeutungen haben und

R^a für eine der folgenden Gruppierungen steht



15

in welcher

R^{14} die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20

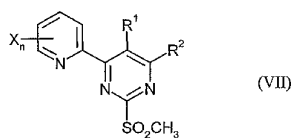
erhält, indem man

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 14 -



in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Aminen der Formel (VIII)



in welcher

10

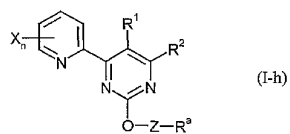
Z, R^9 und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart einer Base umgesetzt,

15

oder

F) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-h)



20

in welcher

R^1 , R^2 , X, n, Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

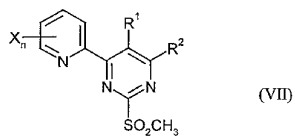
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 15 -

erhält, indem man

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



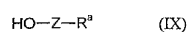
5

in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

mit Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX)



in welcher

15

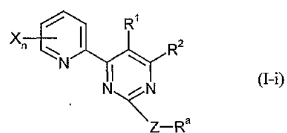
Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

oder

20

G) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-i)



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

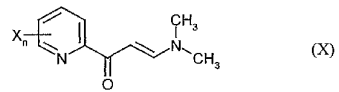
- 16 -

in welcher

 R^1 , R^2 , X, n, Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 erhält, indem man

Pyridin-Derivate der Formel (X)

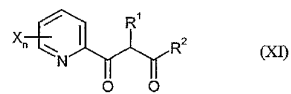


10 in welcher

X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

oder Pyridin-Derivate der Formel (XI)

15

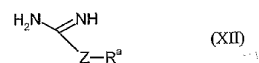


in welcher

 R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit Amidinen der Formel (XII)



25

in welcher

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

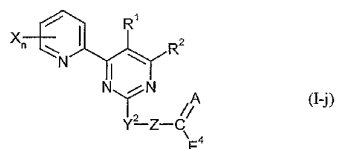
- 17 -

Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

5 oder

H) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-j)



10 in welcher

Y² für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR⁹- steht,

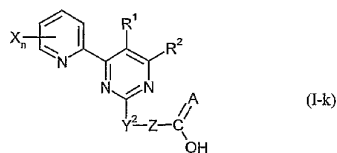
E⁴ für -O-M oder -S-M steht und

15

R¹, R², X, n, Z, A und M die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

20 Pyridylpyrimidine der Formel (I-k)



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 18 -

in welcher

R¹, R², X, n, Y², Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 mit Hydroxiden der Formel (XIII)



in welcher

10

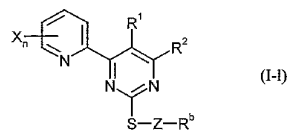
M die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

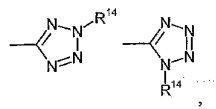
15

J) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-I)



in welcher

20

R¹, R², X, n, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben undR^b für eine der folgenden Gruppierungen steht

25

WO 02/067684

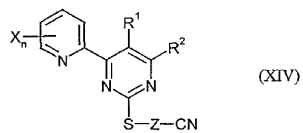
PCT/EP02/01403

- 19 -

worin R¹⁴ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

5 Nitrile der Formel (XIV)



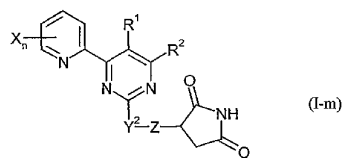
in welcher

10 R¹, R², X, n und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit Trialkylzinnaziden gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels umgesetzt,

oder

15 K) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-m)



in welcher

20 R¹, R², X, n, Y² und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

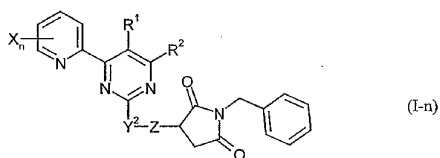
erhält, indem man

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 20 -

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)



in welcher

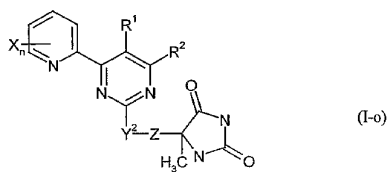
5

R¹, R², X, n, Y² und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

10 oder

L) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-o)



15

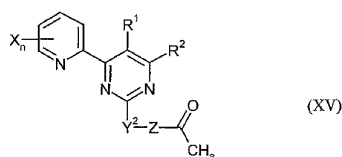
in welcher

R¹, R², X, n, Y² und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

20

Keto-Verbindungen der Formel (XV)



in welcher

- R¹, R², X, n, Y² und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,
- mit Ammoniumcarbonat und Kaliumcyanid gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.
- Schließlich wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sehr gute insektizide Eigenschaften besitzen und sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz zur Bekämpfung unerwünschter Schädlinge, wie Insekten, verwenden lassen. Über insektizide Wirksamkeit von Pyridylpyrimidinen ist aus dem Stand der Technik bisher nichts bekannt.
- Die erfindungsgemäßen Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert.
- R¹ und R² stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₇-Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl oder 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder un-

gesättigtes Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält.

5 R¹ und R² stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann.

10 X steht bevorzugt für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₇-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält;

20 oder wenn n für 2 oder 3 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam bevorzugt für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann.

25 n steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 oder 3 steht.

30 Y steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_p- oder -NR⁹-.

p steht bevorzugt für 0, 1 oder 2.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 23 -

5 Z steht bevorzugt für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_r-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$,
 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_r-$,
 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_r-$ oder $-(CH_2)_r-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$.

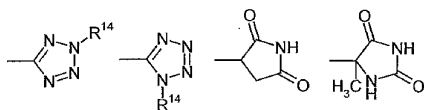
r steht bevorzugt für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6.

t und w stehen unabhängig voneinander bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.

10 R steht bevorzugt für die Gruppierung



15 oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



A steht bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder NR^{15} .

20 E steht bevorzugt für $-OR^{16}$, $-SR^{16}$, $-O-M$, $-S-M$ oder $-NR^{17}R^{18}$.

M steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C_1 - C_6 -Alkyl, Aryl oder Aryl- C_1 - C_6 -alkyl substituiertes Ammonium oder für ein Lithiumkation (Li^+), ein Natriumkation (Na^+) oder ein Kaliumkation (K^+).

25

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 24 -

- M steht außerdem bevorzugt für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 5 R³ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 10 R⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl.
- R⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, Oxamoyl.
- 20 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für C₁-C₆-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl substituiertes Benzyli-
den.
- 25 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach,
30 gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann.

WO 02/067684

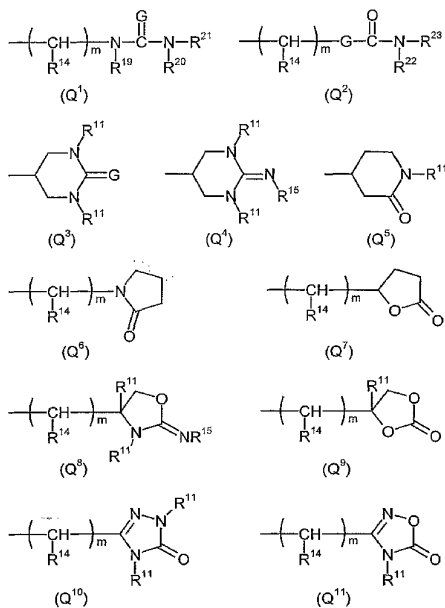
PCT/EP02/01403

- 25 -

- R⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl.
- 5 R⁷ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl.
- R⁸ steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl.
- 10 R⁹ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder 15 Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 20 R¹⁰ steht bevorzugt für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein können.
- 25 R¹¹ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl.
- R¹² und R¹³ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy.
- 30 R¹⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl.

- R¹⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Cyano oder Di(C₁-C₆-alkyl)amino.
- 5 R¹⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyloxy, C₂-C₆-Alkenyl-carbonyloxy, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls
10 einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen
20 der Reste Q.
- R¹⁶ steht außerdem bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0
25 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.
- 30 R¹⁷ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl.

- R¹⁸ steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵.
- R¹⁸ steht außerdem bevorzugt für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-carbonyl substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl.
- R¹⁸ steht außerdem bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl ausgewählt werden können.
- R¹⁷ und R¹⁸ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann.
- Q steht bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen



5

10

wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

15

- m steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.
- G steht bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

- R¹⁹ und R²⁰ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder gemeinsam für C₂-C₄-Alkylen.
- 5 R²¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₁₀-Alkoxy carbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl.
- 10 R²² steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl.
- 15 R²³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl.
- R¹ und R² stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls
- 20 einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht
- 25 benachbarte Schwefelatome enthält.
- 30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 30 -

R¹ und R² stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

X steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält;

oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C₃-C₄-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann.

n steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht.

Y steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_p- oder -NR⁹-.

p steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 31 -

- Z steht besonders bevorzugt für $-(CH_2)_r$, $-(CH_2)_r-(CHR^{10})-(CH_2)_w$, $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_r$, $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_r$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_r$, $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_r$ oder $-(CH_2)_r-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w$.
- 5 r steht besonders bevorzugt für 1, 2, 3 oder 4.
- t und w stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.
- R steht besonders bevorzugt für die Gruppierung
- 10
- $$\begin{array}{c} \text{A} \\ \parallel \\ \text{---C---} \\ | \\ \text{E} \end{array}$$
- oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe
- 15
-
- A steht besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.
- 20 E steht besonders bevorzugt für $-OR^{16}$, $-SR^{16}$, $-O-M$, $-S-M$ oder $-NR^{17}R^{18}$.
- M steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C_1 - C_4 -Alkyl, Phenyl, Benzyl oder Phenylethyl substituiertes Ammonium oder für ein Natriumkation (Na^+) oder ein Kaliumkation (K^+).
- 25

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 32 -

- M steht außerdem besonders bevorzugt für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 5 R³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 10 R⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl.
- 20 R⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Oxamoyl.
- 25 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Benzyliden.
- 30 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder un-

gesättigten Heterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

- 5 R⁶ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Aryl-C₁-C₄-alkyl.
- R⁷ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl.
- 10 R⁸ steht besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 15 R⁹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclus oder Heterocyclus-C₁-C₄-alkyl, welche 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 20 R¹⁰ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl, welche ihrerseits im Aryl-
- 25 teil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können.
- 30

- R¹¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.
- R¹² und R¹³ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy.
- 5 R¹⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 10 R¹⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Cyano oder Di(C₁-C₄-alkyl)amino.
- 15 R¹⁶ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₄-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q.
- 20
- 25
- 30

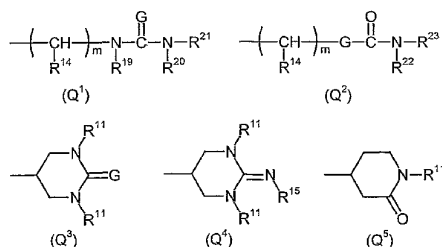
- R¹⁶ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkinyl.
- 5 R¹⁶ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche
- 10 jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.
- 15 R¹⁷ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.
- R¹⁸ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵.
- 20 R¹⁸ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-,
- 25
- 30

Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxy-carbonyl substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl; oder für jeweils ge-
gebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch
Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl.

5 R¹⁸ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis
vierfach, gleich oder verschieden substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-
Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-
C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte
10 Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten,
wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C₁-
C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können.

15 R¹⁷ und R¹⁸ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebun-
den sind, besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder
ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann,
welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1
Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach bis dreifach,
gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

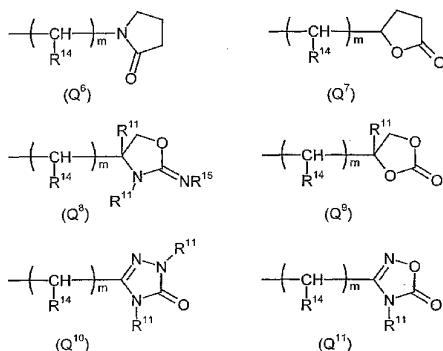
20 Q steht besonders bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 37 -



- 5 wobei die Reste R^{11} die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.
- 10 m steht besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit $-(CHR^{14})-$ innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.
- 15 G steht besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.
- R^{19} und R^{20} stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder gemeinsam für C_2 - C_3 -Alkylen.
- 20 R^{21} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach bis zweifach, gleich oder verschieden durch C_1 - C_4 -Alkylcarbonyloxy oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes C_1 - C_4 -Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₈-Alkoxy carbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl.

- 5 R²² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl.
- R²³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl.
- 10 R¹ und R² stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, 15 -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, Amino, Cyclopentyl, Cyclohexyl; jeweils gegebenenfalls durch Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Pyridinyl, 20 Furyl, Furfuryl.
- R¹ und R² stehen außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH-, -CH=CCl-CH=CH-.
- 25 X steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -CH=CH₂, -C≡CH, Amino, 30

5 -NHMe, -NMe₂, -CHO, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, -NHCOMe, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl; oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH-.

10 X steht außerdem ganz besonders bevorzugt für Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, i-Propylthio.

n steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht.

15 Y steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_p- oder -NR⁹-.

p steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

20 Z steht ganz besonders bevorzugt für -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CHR¹⁰)-, -CH₂-C(O)-CH₂-, -CH₂-NH-, -CH=CH-, -CH₂-CH=CH-, -CH=C(OH)-, -CH=C(OMe)-, -CH₂-C(OMe)=CH-.

Z steht außerdem ganz besonders bevorzugt für -CH₂-C(OEt)=CH-.

25 R steht ganz besonders bevorzugt für die Gruppierung

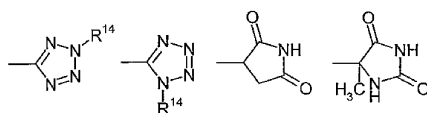


oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 40 -



- A steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.
- 5 E steht ganz besonders bevorzugt für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M oder -NR¹⁷R¹⁸.
- M steht ganz besonders bevorzugt für Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium oder für ein Natriumkation (Na⁺) oder ein Kaliumkation (K⁺).
- 10 M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für ein Magnesiumkation (Mg²⁺) oder ein Calciumkation (Ca²⁺), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe.
- 15 R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Propargyl, Methoxy, Methoxymethyl, -COMe, -COEt, t-Butoxycarbonyl, Oxamoyl.
- 20 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Ethyliden, i-Propyliden, s-Butyliden, Nitrobenzyliden.
- 25 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ganz besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Piperidin, Thiomorpholin, Pyrrolidin, Tetrahydropyridin, der gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl substituiert sein kann.

- R⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCI, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H oder für -CF₂CHFCF₃.
- 5 R⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CH₂CF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- 10 R¹⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe, -COEt, -CO₂Me, -CO₂Et, Cyclohexyl; Phenyl oder Benzyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiert sein können.
- 15 R¹¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl.
- R¹⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl oder t-Butyl.
- 20 R¹⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl oder Cyano.
- 25 R¹⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, -O-(CH₂)₂-O-, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -CH=N-OCH₃ substituiertes Methyl, Ethyl,
- 30

n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch

5 Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -CO₂Me,

10 -CO₂Et, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyl-methyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclo-propylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxa-

15 zyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanyl-methyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazylmethyl, Imidazo-

20 -lylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinyl-methyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydro-pyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazo-lanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinyl-

25 ethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxid-ethyl; oder für einen der Reste Q.

R¹⁶ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor

30 und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl,

n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl.

- R¹⁶ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxidylethyl, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.
- R¹⁷ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.
- R¹⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH₂-O- substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyri-

dinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für -SO₂Me, -SO₂Et oder -NR⁴R⁵.

5 R¹⁸ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal
10 möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl.

15 R¹⁸ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl, wobei die Substituenten zusätzlich zu den
20 oben genannten aus Nitro, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl ausgewählt werden können.

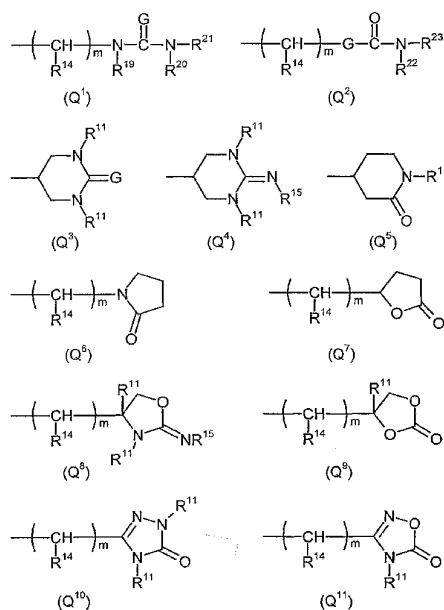
R¹⁷ und R¹⁸ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ganz besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Piperazin, Morpholin, Piperidin, Pyrrolidin, welcher
25 gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl substituiert sein kann.

Q steht ganz besonders bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 45 -



5

wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

10

m steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.

15

G steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 46 -

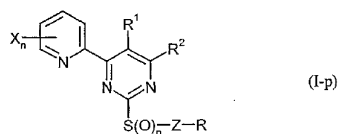
R¹⁹ und R²⁰ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, oder gemeinsam für -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-.

5 R²¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach durch t-Butylcarbonyloxy oder Methoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Chlor, Cyano, Methyl, Ethyl, t-Butyl, Trifluormethyl, s-Butyloxycarbonyl, t-Butyloxycarbonyl, n-Octyloxycarbonyl, -(CH₂)₄- substituiertes Phenyl.

R²² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Methoxymethyl.

15 R²³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl oder Methoxymethyl.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-p)



20 in welcher

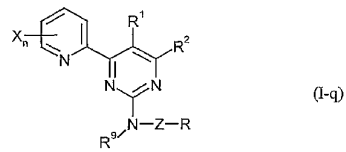
R¹, R², X, n, p, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben.

25 Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-q)

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 47 -

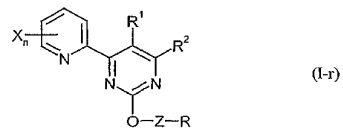


in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z , R und R^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

5

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-r)

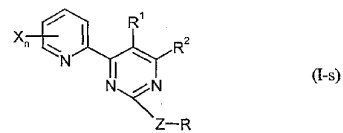


in welcher

10

R^1 , R^2 , X , n , Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-s)



15

in welcher

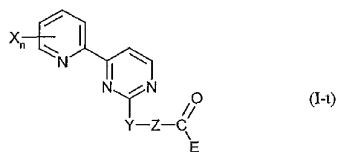
R^1 , R^2 , X , n , Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 48 -

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-t)



in welcher

5

X für Methyl, Ethyl, Chlor, Brom, -CF₃, Methoxy oder Trifluormethoxy steht,

n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn
n für 2 steht,

10

Y für -S- oder -NR⁹- steht,

Z für -CH₂- oder -(CH₂)₂- steht,

15

E für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, i-Butoxy,
s-Butoxy, t-Butoxy, -NH-SO₂Me oder -NH-SO₂Et steht,

R⁹ für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

20

Gesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl können, auch in Verbindung mit
Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder
verzweigt sein.

25

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten
Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also
zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert

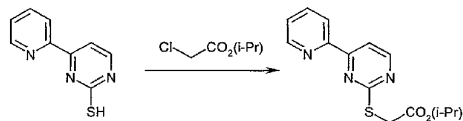
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

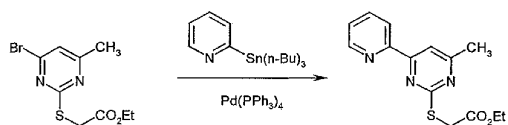
- 49 -

werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

- 5 Verwendet man 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinylthiol und 2-Chloressigsäureisopropylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- 10 Verwendet man Ethyl-[(4-brom-6-methyl-2-pyrimidinyl)thio]acetat, 2-(Tributylstannyl)pyridin und einen Palladium-Katalysator als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



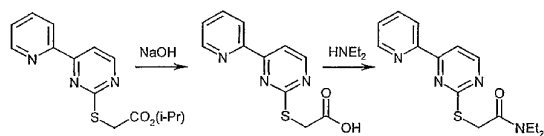
15

- 20 Verwendet man Isopropyl-[[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio]acetat als Ausgangsstoff und Natronlauge und Diethylamin als Reaktionshilfsmittel, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

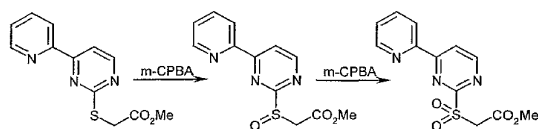
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

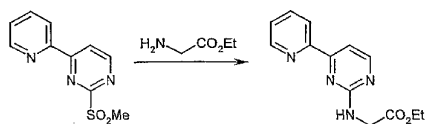
- 50 -



- Verwendet man Methyl-{{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetat als Ausgangsstoff und meta-Chlorperbenzoesäure (m-CPBA) als Oxidationsmittel, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- Verwendet man 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und Glycinethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

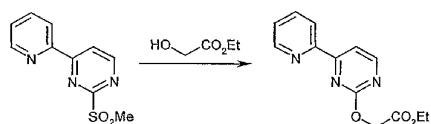


- Verwendet man 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und Glykolsäureethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

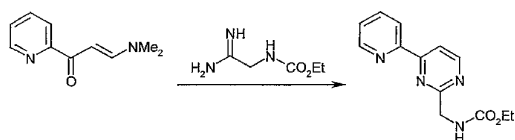
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

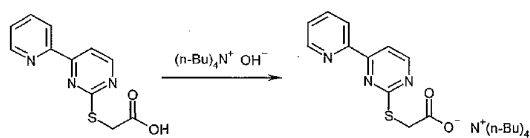
- 51 -



- Verwendet man 3-(Dimethyl-amino)-1-(2-pyridinyl)-2-propen-1-on und Methyl-2-amino-2-iminoethylcarbamate als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- 10 Verwendet man {[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}essigsäure und Tetrabutylammoniumhydroxid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

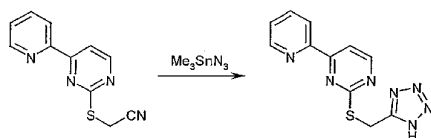


- 15 Verwendet man {[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetonitril und Trimethylzinnazid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

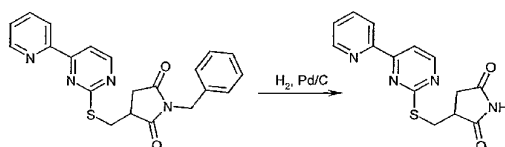
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

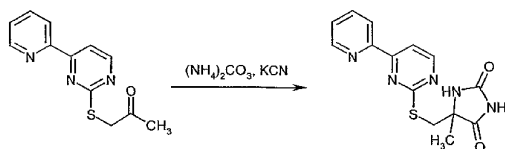
- 52 -



- Verwendet man 1-Benzyl-3-((4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl)thio)methyl)-2,5-pyrrolidindion und Wasserstoff als Ausgangsstoffe, sowie Palladium/Aktivkohle als Katalysator, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- Verwendet man 1-{{4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl}thio}acetone, Kaliumcyanid und Ammoniumcarbonat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

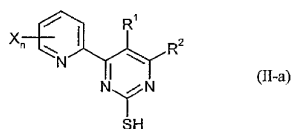


15

Erläuterung der Verfahren und ZwischenprodukteVerfahren (A)

- 5 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) als Ausgangsstoffe benötigten Thiole sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R^1 , R^2 , X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als
- 10 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Die Thiole der Formel (II-a)

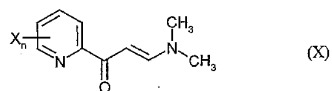


- 15 in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben mit der Maßgabe, dass wenigstens einer der Reste R^1 , R^2 oder X nicht für Wasserstoff steht,

- 20 sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

a) Pyridin-Derivate der Formel (X)



- 25 in welcher

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

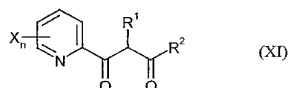
- 54 -

X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Thioharnstoff gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
(z.B. Methanol, Wasser) und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base (z.B.
Natriumhydroxid, Natriumethanolat) umgesetzt,

oder

b) Pyridin-Derivate der Formel (XI)



in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Thioharnstoff gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
(z.B. Methanol, Wasser) und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base (z.B.
Natriumhydroxid, Natriumethanolat) oder einer Säure (z.B. Salzsäure oder
Trifluoressigsäure) umgesetzt.

Die bei der Durchführung der Verfahren (a) und (b) als Ausgangsstoffe benötigten
Pyridin-Derivate sind durch die Formeln (X) und (XI) allgemein definiert. In diesen
Formeln stehen R¹, R², X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz
besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit
der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als
bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Pyridin-Derivate der Formeln (X) und (XI) sind bekannt und/oder lassen sich nach
bekannten Verfahren herstellen (vgl. J. Chem. Soc., Dalton Trans. 1999, 3095,
J. Amer. Chem. Soc. 1951, 73, 5614).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) als Ausgangsstoffe benötigten Halogen-Verbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. E¹ steht bevorzugt für -OR¹⁶, -SR¹⁶ oder -NR¹⁷R¹⁸, besonders bevorzugt für -OR¹⁶ oder -SR¹⁶, wobei R¹⁶, R¹⁷ und R¹⁸ jeweils bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Hal¹ steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogen-Verbindungen der Formel (III) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriämid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Acetonitril oder Dimethylformamid.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C , vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C , ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (II) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (III), sowie 1-10 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (B)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenpyrimidine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

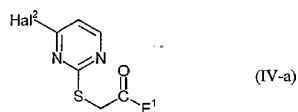
- 57 -

dieser Formel stehen R^1 , R^2 , Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. E^1 steht bevorzugt für $-OR^{16}$, $-SR^{16}$ oder $-NR^{17}R^{18}$, besonders bevorzugt für $-OR^{16}$ oder $-SR^{16}$, wobei R^{16} , R^{17} und R^{18} jeweils bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Hal² steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, ganz besonders bevorzugt für Chlor oder Brom.

Die Halogenpyrimidine der Formel (IV) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. US 3,910,910).

15

Halogenpyrimidine der Formel (IV-a)



in welcher

20

- a) E^1 für Methoxy oder Ethoxy steht und
Hal² für Brom steht,

oder

25

- b) E^1 für Methoxy steht und
Hal² für Chlor steht,

sind neu.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridin-Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel stehen X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. L steht bevorzugt für Sn(n-Bu)₃, Sn(Me)₃, Sn(Phenyl)₃, ZnBr oder ZnCl, besonders bevorzugt für Sn(n-Bu)₃, Sn(Me)₃, Sn(Phenyl)₃ oder ZnBr, ganz besonders bevorzugt für Sn(n-Bu)₃, Sn(Me)₃ oder ZnBr.

Pyridin-Verbindungen der Formel (V) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petroether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid. Besonders bevorzugt verwendet man aromatische Kohlenwasserstoffe, ganz besonders bevorzugt Benzol, Toluol oder Xylol.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man im allgemeinen einen Palladium-Katalysator ein, der wiederum mit oder ohne Zusatz von weiteren Liganden verwendet werden kann. Vorzugsweise verwendet man als Katalysator PdCl₂(dppf) [dppf = 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocene], Pd(PPh₃)₄, PdCl₂(PPh₃)₂, PdCl₂(CH₃CN)₂, Pd₂(dba)₃ [dba = Dibenzylidenaceton] oder

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 59 -

$\text{Pd}(\text{OAc})_2$, besonders bevorzugt $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$, $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$, $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$, oder $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, ganz besonders bevorzugt $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ oder $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$.

Als Liganden kommen Triarylphosphine, Trialkylphosphine oder Arsine in Frage.
5 Vorzugsweise verwendet man dppf , PPh_3 , $\text{P}(\text{t-Bu})_3$, Pcy_3 oder AsPh_3 , besonders bevorzugt dppf .

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen
10 arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C , vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (IV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss
15 an Verbindung der Formel (V), sowie 1-5 Mol% an Katalysator ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt und das Rohprodukt nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell vorhandenen
20 Verunreinigungen befreit.

Verfahren (C)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-c) allgemein definiert. In
25 dieser Formel stehen R^1 , R^2 , X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. E^3 steht bevorzugt für
30 $-\text{OR}^{16}$, wobei R^{16} bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 60 -

Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

5 Die Pyridylpyrimidine der Formel (I-c) fallen unter die Definition der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und werden nach einem der Verfahren (A) oder (B) hergestellt.

10 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Zwischenprodukte entstehenden Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-d) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹⁷ und R¹⁸ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders
20 bevorzugt etc. genannt wurden.

Amine der Formel (VI) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

25 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alko-
30 hole, ganz besonders bevorzugt Methanol oder Ethanol.

Als wasserabsorbierendes Reagenz kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils alle üblichen Dehydratisierungsreagenzien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Carbodiimide. Besonders bevorzugt verwendet man Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder N-(3-Dimethylaminopropyl)-N'-ethyl-carbodiimid (EDC).

Als Base kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) wird im allgemeinen 1 Mol an Verbindung der Formel (I-c) in der ersten Stufe zunächst mit einer Base behandelt und in der zweiten Stufe mit 1 Mol oder einem leichten Überschuss an Verbindung der Formel (VI), sowie 1-1.5 Mol% an wasserabsorbierendem Reagenz versetzt. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt und das Rohprodukt nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (D)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-f) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n, Z und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang

mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Die Pyridylpyrimidine der Formel (I-f) fallen unter die Definition der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und werden zum Beispiel nach einem der Verfahren (A) oder (B) hergestellt.

Als Oxidationsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) kommen alle üblichen zur Schwefeloxidation verwendbaren Oxidationsmittel infrage. Insbesondere geeignet sind Wasserstoffperoxid, organische Persäuren, wie beispielsweise Peressigsäure, m-Chlorperbenzoesäure, p-Nitroperbenzoesäure oder Luftsauerstoff.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) kommen ebenfalls inerte organische Lösungsmittel infrage. Vorzugsweise verwendet man Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Hexan oder Petrolether; chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, 1,2-Dichlorethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff oder Chlorbenzol; Ether, wie Diethylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran; Carbonsäuren, wie Essigsäure oder Propionsäure; oder dipolare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Aceton, Essigsäureethylester oder Dimethylformamid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (D) kann gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels durchgeführt werden. Als solche kommen alle üblicherweise verwendbaren organischen und anorganischen Säurebindemittel infrage. Vorzugsweise verwendet man Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, -acetate oder -carbonate, wie beispielsweise Calciumhydroxid, Natriumhydroxid, Natriumacetat oder Natriumcarbonat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (D) kann gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Katalysators durchgeführt werden. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Schwefeloxidationen gebräuchlichen Metallsalz-Katalysatoren infrage.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 63 -

Beispielhaft genannt sei in diesem Zusammenhang Ammoniummolybdat und Natriumwolframat.

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +70°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und +50°C.

10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (I-f) im allgemeinen 0,8 bis 1,2 Mol, vorzugsweise äquimolare Mengen Oxidationsmittel ein, wenn man die Oxidation des Schwefels auf der Sulfoxidstufe unterbrechen will. Zur Oxidation zum Sulfon setzt man pro Mol an Verbindung der Formel (I-f) im allgemeinen 1,8 bis 3,0 Mol, vorzugsweise doppelt molare Mengen an Oxidationsmittel ein. Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung
15 und Isolierung der Endprodukte erfolgt nach üblichen Verfahren.

Verfahren (E)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

25

Die Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

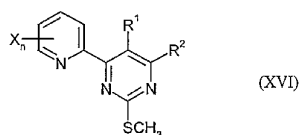
c) Methylthio-Derivate der Formel (XVI)

30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 64 -



in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit einem Oxidationsmittel (z.B. m-Chlorperbenzoesäure) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Dichlormethan) umgesetzt.

10

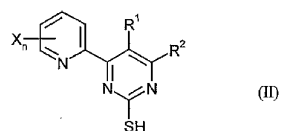
Die bei der Durchführung des Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Methylthio-Derivate sind durch die Formel (XVI) allgemein definiert. In dieser Formel steht R^1 , R^2 , X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15

Methylthio-Derivate der Formel (XVI) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

d) Thiole der Formel (II)

20



in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit einem Methylierungsreagenz (z.B. Iodmethan) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Acetonitril) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Kaliumcarbonat) umgesetzt.

5

Thiole der Formel (II) wurden bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) beschrieben.

10

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Z und R⁹ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15

Amine der Formel (VIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

20

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid, Tetrahydrofuran oder Dimethylsulfoxid.

30

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen

in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (VIII), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (F)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (E) beschrieben.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxy-Verbindungen sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der 5 erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester 15 wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid.

20 Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie 25 Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, 30 Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C , vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C , ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (IX), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (G)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridin-Derivate der Formeln (X) und (XI) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (A) beschrieben.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) als Ausgangsstoffe benötigten Amidine sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Amidine der Formel (XII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alko-

5 hole, ganz besonders bevorzugt Methanol oder Ethanol.

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammonium-

10 hydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Alkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat.

15 Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallalkoholate, ganz besonders bevorzugt Natriummethanolat.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

20

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (X) oder (XI) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (XII), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen ver-

25 fährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von

30 eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

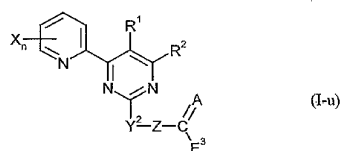
- 70 -

Verfahren (H)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-k) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y² steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder NR⁹.

Pyridylpyrimidine der Formel (I-k) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen, die sich zum Beispiel herstellen lassen, indem man

e) Ester der Formel (I-u)



in welcher

R¹, R², X, n, Y², A und E³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einer Base (z.B. Natriumhydroxid) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Methanol) behandelt.

Pyridylpyrimidine der Formel (I-u) sind ebenfalls Teil dieser Erfindung und können über Verfahren (A) oder (B) hergestellt werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxide sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel steht M bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der
5 erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Hydroxide der Formel (XIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril. Besonders bevorzugt verwendet
15 man Wasser oder Alkohole.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C, vorzugsweise zwischen
20 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (I-k) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (XIII) ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach
25 üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.
30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

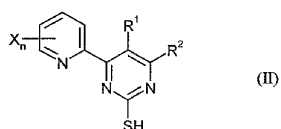
- 72 -

Verfahren (J)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrile sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R^1 , R^2 , X , n , Y und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Nitrile der Formel (XIV) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

f) Thiole der Formel (II)



in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit chlorierten Nitrilen der Formel (XVII)

20



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Toluol) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Natriumhydroxid) umgesetzt.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 73 -

Die bei der Durchführung des Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (II) wurden bereits bei der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) beschrieben.

- 5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten chlorierten Nitrile sind durch die Formel (XVII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt
10 etc. genannt wurden.

Chlorierte Nitrile der Formel (XVII) sind bekannt.

- 15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) benötigten Trialkylzinnazide sind bekannt. Bevorzugt verwendet man Trimethylzinnazid oder Tri(n-butyl)zinnazid.

- Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugs-
20 weise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether,
25 Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie
30 Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Toluol.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 74 -

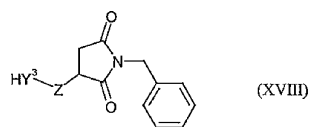
Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (XIV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss eines Trialkylzinnazids ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und einengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (K)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-n) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R^1 , R^2 , X, n und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y^2 steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder NR^9 .

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

g) Verbindungen der Formel (XVIII)



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

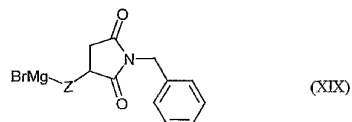
- 75 -

Y^3 für Sauerstoff, Schwefel oder $-NR^9$ - steht, wobei R^9 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

oder

5

Grignard-Verbindungen der Formel (XIX)

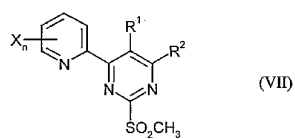


in welcher

10

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

mit Methylsulfonylpyrimidinen der Formel (VII)



15

in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umgesetzt.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 76 -

Die bei der Durchführung des Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formeln (XVIII) und (XIX) allgemein definiert. In diesen Formeln steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der

5 erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (XVIII) und Grignard-Verbindungen der Formel (XIX) lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10

Verbindungen der Formel (VII) wurden bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung des Verfahrens (E) beschrieben.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether,

15 Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid, Tetrahydrofuran oder Dimethylsulfoxid.

20

Als Katalysator setzt man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) alle für eine Hydrierungsreaktion üblichen Katalysatoren ein. Vorzugsweise verwendbar sind Palladium- oder Platin-Katalysatoren, besonders bevorzugt Palladium/Aktivkohle.

25

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen

30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 77 -

arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C , vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C .

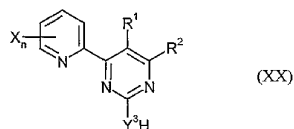
- Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (I-n) im allgemeinen 1-10 Mol% eines Katalysators ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (L)

- Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) als Ausgangsstoffe benötigten Keto-Verbindungen sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R^1 , R^2 , X , n und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y^2 steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder NR^9 .

Keto-Verbindungen der Formel (XV) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

- h) Verbindungen der Formel (XX)



in welcher

WO 02/067684

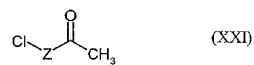
PCT/EP02/01403

- 78 -

R^1 , R^2 , X, n und Y^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Methylketonen der Formel (XXI)

5



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

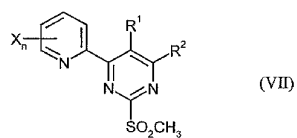
10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umsetzt,

oder

15

i) Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



in welcher

20

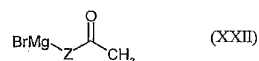
R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Grignard-Verbindungen der Formel (XXII)

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 79 -



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umgesetzt.

- 10 Die bei der Durchführung des Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formel (XX) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R^1 , R^2 , X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y^3 steht bevorzugt für Schwefel, Sauerstoff oder NR^9 .
- 15

Die Verbindungen der Formel (XX) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannte Verfahren herstellen.

- 20 Die bei der Durchführung des Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Methylketone sind durch die Formel (XXI) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- 25

Methylketone der Formel (XXI) sind bekannt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (i) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (E) beschrieben.

- 5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (i) als Ausgangsstoffe benötigten Grignard-Verbindungen sind durch die Formel (XXII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- 10

Grignard-Verbindungen der Formel (XXII) sind bekannt.

- 15 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan;
- 20 Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan.
- 25

- Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (XV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss
- 30 an Ammoniumcarbonat und 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Kaliumcyanid ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen ver-

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 81 -

führt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

5

Bei der Durchführung aller erfindungsgemäßen Verfahren arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblüttoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen

15

normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

20

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera* spp.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

25

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Acheta domesticus*, *Grylotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

30

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..

Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinea* spp..

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 82 -

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

5

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

10

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

20

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllioides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp.,

25

30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 83 -

Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

5 Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

10 Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

15 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

20 Aus der Klasse der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcopes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

25 Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

30 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch eine hervorragende Wirkung gegen Raupen, Käferlarven, Spinnmilben, Blattläuse und Minierfliegen aus.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobizide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbarer oder nicht schützbarer Pflanzensorten.

Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielsweise Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum-
5 erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie
10 Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methyl-ethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare
15 Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktio-
20 nierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabak-
25 stengeln;

als Emulgier- und/oder schaum-erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxy-ethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxy-
30 ethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate;

als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

10 Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung
20 mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

25

Besonders günstige Mischpartner sind z.B. die folgenden:

Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol,
30 Azoxystrobin,
Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

- Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazin, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufaneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,
- 5 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,
- 10 Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Flua-
zinam, Flumetover, Fluorimid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumecyclohex, Guaza-
tin, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,
- 15 Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipcnazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irunamycin, Isoprothiolan, Isovalendione,
- Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,
- 20 Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomyacin, Myclobutanil, Myclozolin,
- 25 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthion, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
- 30 Quinconazol, Quintozen (PCNB), Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

- Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicy-
 ofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,
 Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol,
 Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
- 5 Uniconazol,
 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
 Zarilamid, Zineb, Ziram sowie
 Dagger G, OK-8705, OK-8801,
 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- 10 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor- β -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-metylen]-1H-1,2,4-tria-
 zol-1-ethanol,
 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
- 15 (E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
 {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-
 isopropylester
 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrol-2,5-dion,
- 20 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
 1-[(Diiodomethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
- 25 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropanecarboxamid,
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
- 30 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,

- 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 2-Aminobutan,
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 5 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
 2-Phenylphenol(OPP),
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 10 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
 15 8-Hydroxychinolinsulfat,
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl]-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-
 20 hydrochlorid,
 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
 Kaliumhydrogencarbonat,
 Methantetrathiol-Natriumsalz,
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 25 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 30 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,

- N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl-cyclopropanecarboxamid,
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
 5 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin-Natriumsalz,
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
 10
- Bakterizide:**
- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,
 Oethilnon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Teclof-
 talam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.
 15
- Insektizide / Akarizide / Nematizide:**
- Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,
 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
 20 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis,
 Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb,
 Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin,
 Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocar-
 boxim, Butylpyridaben,
 25 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloetho-
 carb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos,
 Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin,
 Clocythrin, Cloethocarb, Clofentazine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin,
 Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,
 30 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon,
 Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton,
 Docusat-sodium, Dofenapyn,

- Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomophthora spp., Eprinomectin, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrinfos,
- Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim,
- 5 Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluzuron, Flubrocyclothrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,
- Granuloseviren
- 10 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene, Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin, Kempolyederviren
- Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
- Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
- 15 Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos, Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron
- Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M
- Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,
- 20 Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
- Quinalphos,
- 25 Ribavirin
- Salithion, Sebufos, Selamectin, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos, Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermethrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatrithos, Thiocyclam hydrogen oxalate,
- 30 Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocyclothrins, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 92 -

- Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii
 YI 5302
 Zeta-cypermethrin, Zolaprofos
- 5 (1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat
 (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat
 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin
- 10 2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
 3-Methylphenyl-propylcarbammat
- 15 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
 4-Chlor-2-[(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon
 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon
 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon
- 20 Bacillus thuringiensis strain EG-2348
 Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid]
 Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-ester
 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
- 25 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
 Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbammat
 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid
- 30 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N"-nitro-guanidin
 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid
 N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 93 -

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

5

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe

10

gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise

15

zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

20

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekalkten Unterlagen aus.

25

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls

30

in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch über additive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte

herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT“-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotr® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen.

- 5 Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

- 10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

- 15 Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phthirus spp., Solenopotes spp..

- 20 Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

- 25 Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocera sowie Brachycerina z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

- 30 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 97 -

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp..

5

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

10

Aus der Ordnung der Actiniedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

15

Beispielsweise zeigen sie gute Wirksamkeit gegen die Entwicklungsstadien von Zecken, gegen Fliegen und gegen Flöhe.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

25

30

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen
 5 (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markie-
 10 rungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in einer
 15 Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Außerdem wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.
 20

Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie
 25 *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*
 30 *Dinoderus minutus*.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 99 -

Hautflügler wie

Sirex juvencus, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Termiten wie

- 5 *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*.

Borstenschwänze wie *Lepisma saccharina*.

10

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

15

Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft zu verstehen:

20

Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

30

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit mindestens

einem Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Binde- oder Fixiermittels, Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

5

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

10

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

15

Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölarziges schwer flüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

20

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölarzige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölarzige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralöhlhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

25

Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dgl. zum Einsatz.

30

In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindelöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise α -Monochlornaphthalin, verwendet.

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder öartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, dass das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und dass das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches oder ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycolether, Ester oder dgl. zur Anwendung.

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes verwendet.

Das als Bindemittel verwendete Kunstharz kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dgl. eingesetzt werden.

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällen vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 103 -

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

5 Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

10 Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der WO 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

15 Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid und Triflumuron, sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolyfluanid, 3-Iod-2-propinylbutylcarbamate, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

20 Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken, Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

25 Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Ledamorphia (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorphia (Seepocken), wie Balanus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige
30 Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 104 -

Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise *Ectocarpus* sp. und *Ceramium* sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflussekrebse) zusammengefasst werden, besondere Bedeutung zu.

5

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

10

Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-*n*-butylzinnlaurat, Tri-*n*-butylzinchlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinchlorid, Tri-*n*-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdädisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyl titanat, Phenyl-

15

(bipyridin)-wismutchlorid, Tri-*n*-butylzinfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamoylzinkethylenbisthiocarbamat, Zinkoxid, Kupfer(I)-ethylen-bisdithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphthenat und Tributylzinhalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Verbindungen entscheidend reduziert werden.

20

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

25

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

Algizide wie

30

2-*tert*.-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 105 -

Fungizide wie

Benzo[*b*]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamate, Tolyfluanid und Azole wie

5 Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

Molluskizide wie

Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb; oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie

10 4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Dimethylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutylstannoxan, 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachlorisophthalonitril, Tetramethylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

15 Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.

Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten des weiteren die üblichen Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* **1985**, 37, 730-732 und Williams, *Antifouling Marine Coatings*, Noyes, Park Ridge, **1973** beschrieben.

Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.

25

Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittelsystem, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wässrigen System, Vinylchlorid/Vinylacetat-Copolymerensysteme in Form wässriger Dispersionen oder in Form von organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke, trocknende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination

30

mit Teer oder Bitumina, Asphalt sowie Epoxy-Verbindungen, geringe Mengen Chlorkautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.

Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam. Zu diesen Schädlingen gehören:

- 20 Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. *Buthus occitanus*.
- Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.
- 25 Aus der Ordnung der Araneae z.B. *Aviculariidae*, *Araneidae*.
- Aus der Ordnung der Opiliones z.B. *Pseudoscorpiones chelifera*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.
- Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.
- 30 Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..
- Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus* spp..

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 107 -

- Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.
- Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.
- Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. *Acheta domesticus*.
- Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.
- Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Kaloterms* spp., *Reticulitermes* spp.
- 10 Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.
- Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- 15 Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.
- 20 Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.
- Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp.,
- 25 *Tetramorium caespitum*.
- Aus der Ordnung der Anoptura z.B. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.
- Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.
- 30 Die Anwendung im Bereich der Haushaltsinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern, Carbamaten,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 108 -

Pyrethroiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.

5 Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel- und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködem oder Köderstationen.

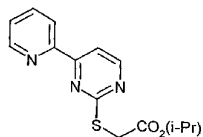
10

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Stoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 109 -

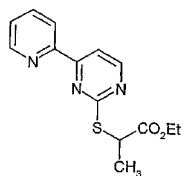
HerstellungsbeispieleBeispiel 1

5

0,57 g (3 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 1,66 g (12 mmol) Kaliumcarbonat werden in 30 ml Acetonitril vorgelegt. Nach Zugabe von 0,41 g (3 mmol) 2-Chloressigsäureisopropylester wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch unter vermindertem Druck eingeeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

Man erhält 0,72 g (79 % d. Th.) an Isopropyl-{{4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl}thio}-acetat als Oel.

15 HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,56.

Beispiel 2

20

35,6 mg (0,188 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 104 mg (0,752 mmol) Kaliumcarbonat werden in 5 ml Tetrahydrofuran vorgelegt. Nach Zugabe von

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 110 -

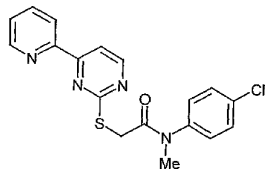
34,0 mg (0,188 mmol) 2-Brompropionsäureethylester wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung werden 0,5 ml Wasser und 2 ml Essigsäureethylester zugesetzt, 30 min gerührt und das Reaktionsgemisch über eine Extrelut-Kieselgelkartusche gegeben und anschließend unter vermindertem Druck eingeeengt.

- 5 Man erhält 41 mg (70 % d. Th.) an Ethyl-2-{{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}-propanoat.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,74.

Beispiel 3

10



- 0,57 g (3 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 1,66 g (12 mmol) Kaliumcarbonat werden in 30 ml Acetonitril vorgelegt. Nach Zugabe von 0,65 g (3 mmol) N-(4-Chlorphenyl)-N-Methyl-2-chloracetamid wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

- 20 Man erhält 1,09 g (81 % d. Th.) an N-(4-Chlorphenyl)-N-methyl-2-{{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetamid.

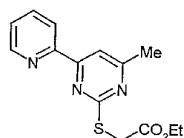
HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,73.

Fp. 142°C.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

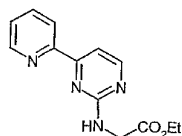
- 111 -

Beispiel 4

- 5 0,30 g (1,04 mmol) Ethyl-[(4-brom-6-methyl-2-pyrimidinyl)thio]acetat, 0,38 g (1,04 mmol) 2-(Tributylstannyl)pyridin und 0,06 g (0,05 mmol) Tetrakis(triphenylphosphin)palladium werden unter Argon in 10 ml Xylol vorgelegt und 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeeengt und das Rohprodukt an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan) chromatographiert.
- 10 Man erhält 0,215 g (70 % d. Th.) an Ethyl-[(4-methyl-6-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl)thio]acetat.
- HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,45.

Beispiel 5

15



- 0,71 g (3 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und 0,33 g (3 mmol) Triethylamin werden in 30 ml Ethanol vorgelegt, mit 0,46 g (3,3 mmol) Glycineethyl-ester-Hydrochlorid versetzt und für 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch unter vermindertem Druck eingeeengt, in Dichlormethan aufgenommen, mit Natriumhydrogencarbonatlösung und Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet
- 20

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 112 -

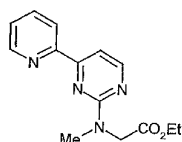
und unter vermindertem Druck eingeengt. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton 95:5) chromatographiert.

Man erhält 0,12 g (13 % d. Th.) an Ethyl-N-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]glycinat.

HPLC Log P (pH 2,3) = 1,14.

5 Fp. 85°C.

Beispiel 6



10

0,41 g (1,74 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und 0,48 g (3,49 mmol) Kaliumcarbonat werden in 20 ml DMF vorgelegt, mit 0,29 g (1,92 mmol) N-Methyl-glycinethylester-Hydrochlorid versetzt und für 16 h bei 80°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeengt, in Dichlormethan aufgenommen, mit Natriumhydrogencarbonatlösung und Zitronensäurelösung

15

gewaschen, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton 95:5) chromatographiert.

Man erhält 0,14 g (30 % d. Th.) an Ethyl-N-methyl-N-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]glycinat als Oel.

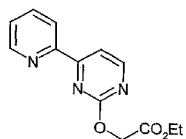
20

HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,66.

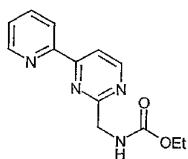
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 113 -

Beispiel 7

- 5 0,71 g (3 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin werden in 3 ml Glykolsäureethylester vorgelegt. Anschließend werden bei einer Temperatur von kleiner 35°C portionsweise 0,18 g (4,5 mmol) Natriumhydrid (60 %ig) zugesetzt. Man rührt 30 min bei Raumtemperatur nach, versetzt dann mit Wasser und extrahiert mit Dichlormethan. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton
- 10 95:5) chromatographiert.
- Man erhält 0,39 g (46 % d. Th.) an Ethyl-{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]oxy}acetat.
- HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,73
- Fp. 48-53°C

15 Beispiel 8

- 0,88 g (5 mmol) 3-(Dimethyl-amino)-1-(2-pyridinyl)-2-propen-1-on, 0,91 g (5 mmol)
- 20 Methyl-2-amino-2-iminoethylcarbamate-Hydrochlorid und 0,68 g (10 mmol) Natriumethylat werden in 20 ml Ethanol vorgelegt und für 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeengt, in Dichlormethan auf-

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

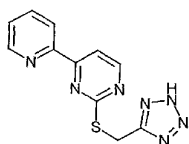
- 114 -

genommen, mit Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt.

Man erhält 0,35 g (25 % d. Th.) an Ethyl-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]methylcarbammat.

5 HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,14.

Beispiel 9



10

0,6g (2,6 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thioacetonitril und 0,54g (2,6 mmol) Trimethylzinnazid werden in 30 ml Toluol für 16 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Zur Aufarbeitung wird eingeengt, in Natronlauge (10%ig in Wasser) gelöst und zur Entfernung unlöslicher Bestandteile filtriert. Das Filtrat wird mit Salzsäure (10%ig in Wasser) auf pH 4 eingestellt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt. Zur Entfernung letzter Spuren von Zinnderivaten wird das Rohprodukt in Dichlormethan gelöst und 5 Stunden mit einer gesättigten Kaliumfluoridlösung verrührt. Die organische Phase wird erneut getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt.

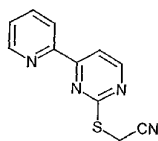
15

20 Man erhält 0,4g (57% d. Th.) an 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thiomethyl-tetrazol.
Fp. 162°C.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

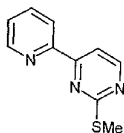
- 115 -

Herstellung von AusgangsstoffenNitrile der Formel (XIV)

5

- 0,95g (5 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol, 0,75g (10 mmol) Chloracetonitril und 2,46g (30 mmol) Natriumacetat werden in 30 ml Ethanol 6 Stunden unter Rückfluss gekocht und anschließend eingeeengt. Nach Verteilung zwischen Dichlormethan und Wasser wird die organische Phase abgetrennt, getrocknet und eingeeengt.
- Man erhält 0,95g (75% d. Th.) an 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thioacetonitril.
- HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,68.

- 15 Methylthio-Derivate der Formel (XVI)



- 4,73 g (25 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 5,18 g (37,5 mmol) Kaliumcarbonat werden in 50 ml Acetonitril vorgelegt. Man tropft 3,55 g (25 mmol) Iodmethan zu und rührt für 16 h bei 40°C nach. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

20

WO 02/067684

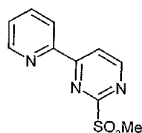
PCT/EP02/01403

- 116 -

Man erhält 4,45 g (81 % d. Th.) 2-(Methylthio)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin.

HPLC: Log P (pH, 2,3) = 1,93.

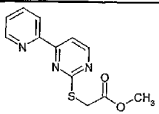
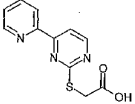
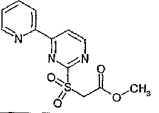
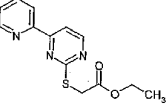
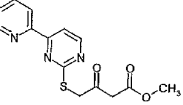
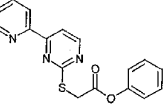
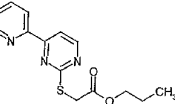
5 Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

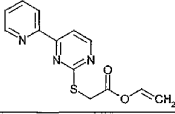
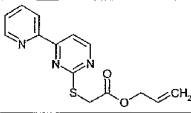
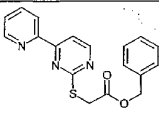
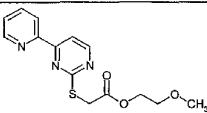
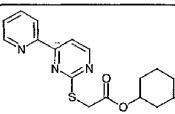
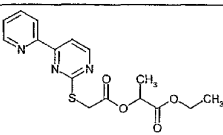
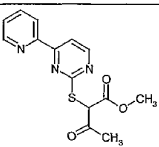


10 4,07 g (20 mmol) 2-(Methylthio)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin werden in 100 ml Dichlormethan gelöst. Man setzt unter Eiskühlung portionsweise 10,85 g (44 mmol) m-Chlorperbenzoesäure (70 %ig) zu und rührt für 16 h bei Raumtemperatur. Die organische Phase wird nacheinander mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und Natriumhydrogensulfidlösung gewaschen, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

15 Man erhält 3,6 g (53 % d. Th.) an 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin.
HPLC: Log P (pH 2,3) = 0,99.

Die in der folgenden Tabelle aufgeführten Verbindungen können entsprechend einem der oben beschriebenen erfindungsgemäßen Verfahren hergestellt werden.

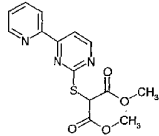
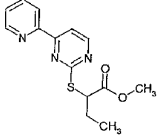
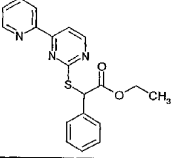
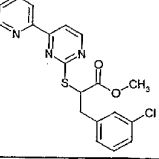
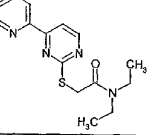
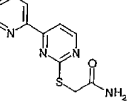
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
10		1.81	95
11		1.14	181
12		1.37	125
13		2.17	78-80
14		1.76	
15		2.88	
16		2.76	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
17		2.34	108
18		2.40	68
19		2.99	88
20		1.97	
21		3.53	
22		2.58	
23		2.34	95

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

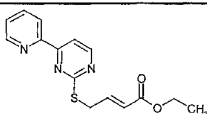
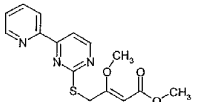
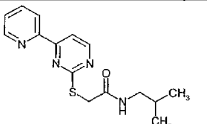
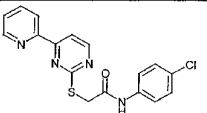
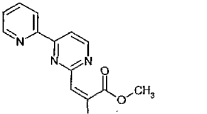
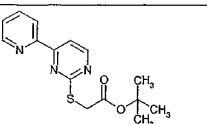
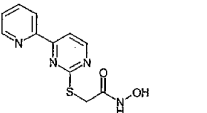
- 119 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
24		2.16	
25		2.68	
26		3.50	118
27		3.84	
28		1.80	120
29		0.69	172

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

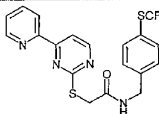
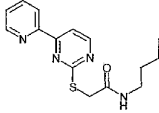
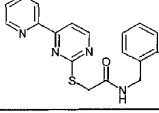
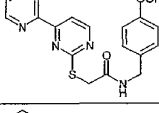
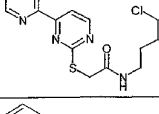
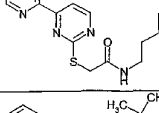
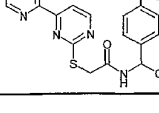
- 120 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
30		2.92	
31		2.70	
32		1.81	
33		2.58	
34		1.89	183
35		2.96	86
36		0.55	157

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

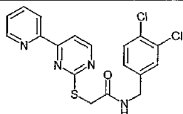
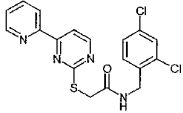
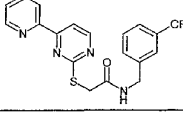
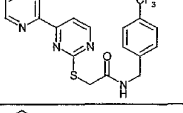
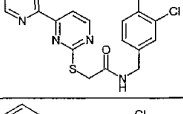
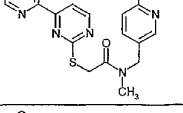
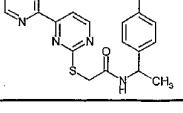
- 121 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
37		2.93	
38		2.96	
39		2.72	
40		2.76	
41		2.83	
42		2.82	
43		3.40	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 122 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
44		2.64	
45		2.69	
46		2.62	
47		2.64	
48		2.42	
49		2.01	
50		2.58	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

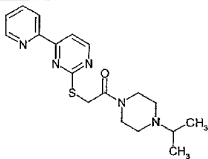
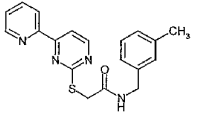
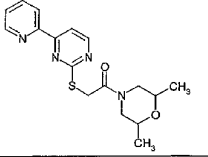
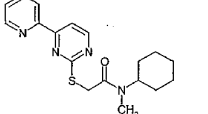
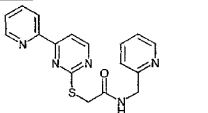
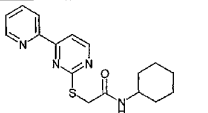
- 123 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
51		2.58	
52		1.94	
53		1.71	
54		2.38	
55		2.00	
56		2.56	
57		2.48	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

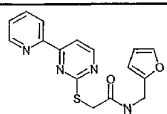
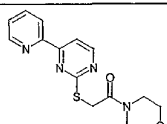
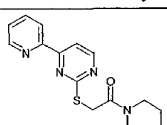
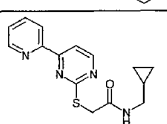
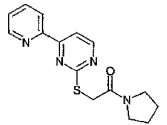
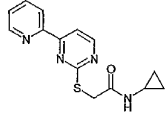
- 124 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
58		0.95	
59		2.29	
60		1.94	
61		2.67	
62		1.14	
63		2.31	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

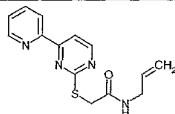
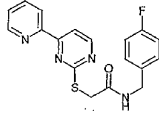
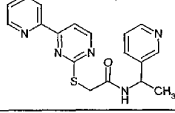
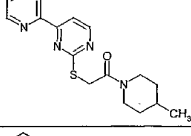
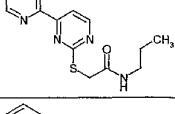
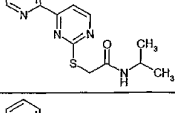
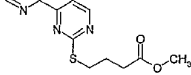
- 125 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
64		1.82	
65		1.55	
66		2.09	
67		1.83	
68		1.75	
69		1.56	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 126 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
70		1.65	
71			
72			
73			
74			
75			
76		2.35	

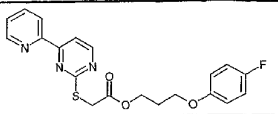
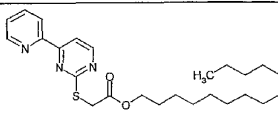
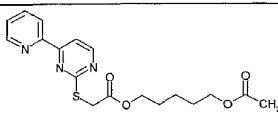
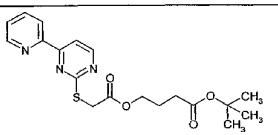
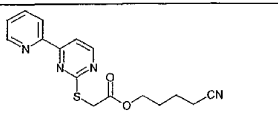
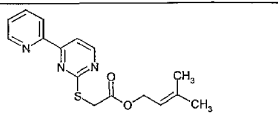
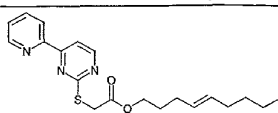
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
77		3.46	136
78		2.13	87-95
79		2.68	
80		3.96	
81			
82			
83		3.37	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
84		2.72	
85		6.15	
86		7.22	
87			
88		3.86	
89		3.56	
90			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

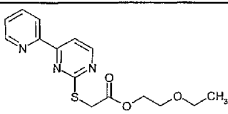
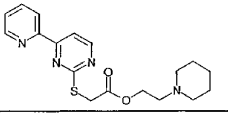
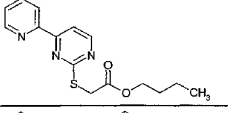
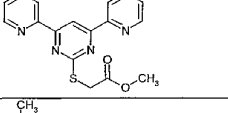
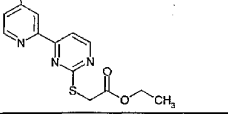
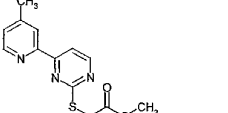
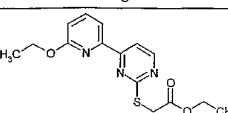
- 129 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
91		3.59	
92			
93		2.82	
94		3.48	
95		2.29	
96		3.18	
97			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 130 -

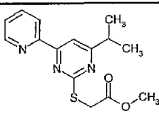
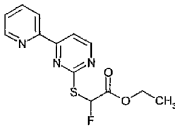
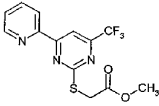
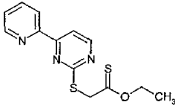
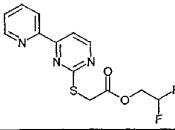
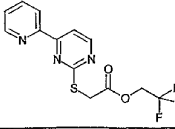
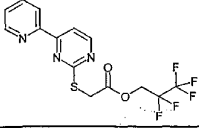
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
98		2.34	
99		1.04	
100		3.07	
101		2.81	117
102		2.20	60
103		1.80	105
104		3.67	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 131 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
105		2.46	
106		3.01	
107		3.50	
108		0.89	
109		3.57	
110		1.13	
111		3.19	

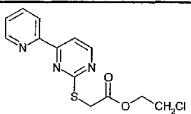
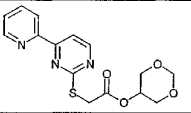
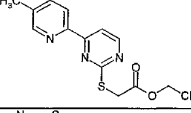
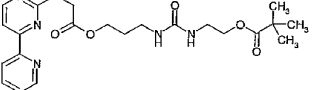
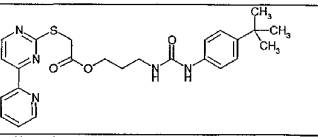
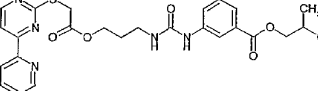
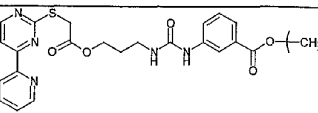
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
112		3.11	
113		2.55	
114		3.34	
115		3.30	
116		2.25	
117		2.69	
118		3.24	

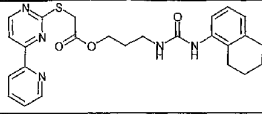
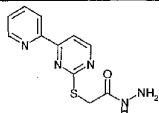
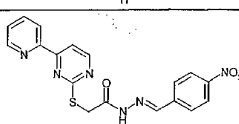
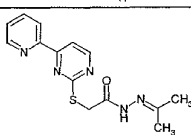
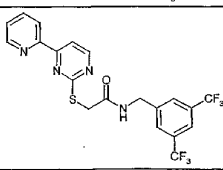
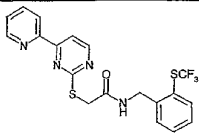
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp/°C
119		3.37	
120		3.59	
121		3.06	
122		2.26	
123		2.78	
124		2.31	
125		3.31	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 134 -

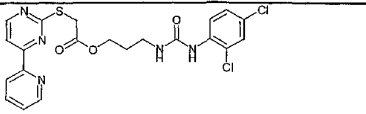
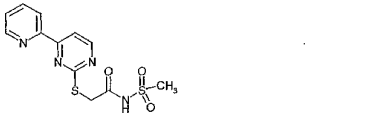
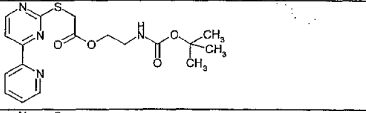
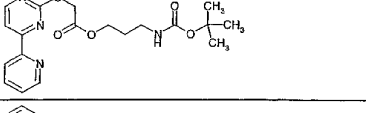
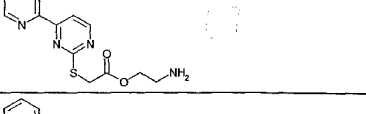
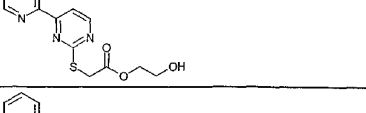
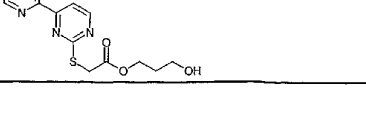
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
126		2.29	
127		1.76	
128		2.50	
129		2.51	
130		3.51	
131		3.45	
132			

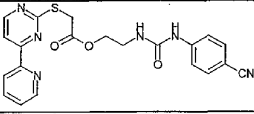
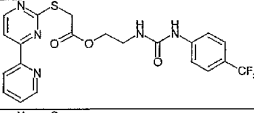
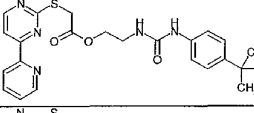
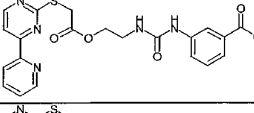
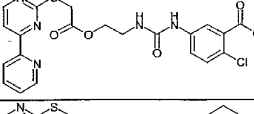
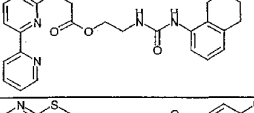
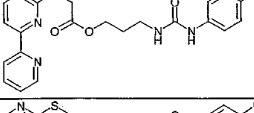
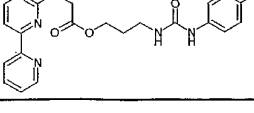
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
133		3.06	
134		0.43	184
135		2.23	220
136		0.44	195
137		3.22	
138		2.92	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 136 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2,3)	Fp./°C
139		3.20	
140		1.13	
141		2.63	
142		2.79	
143			
144			
145			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
146		2.3	
147		3.04	
148		3.35	
149		3.01	
150		4.95	
151		2.94	
152		2.45	
153		3.2	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

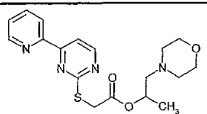
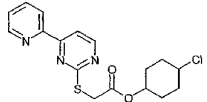
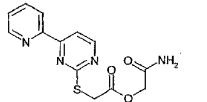
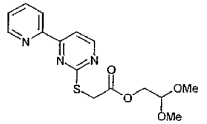
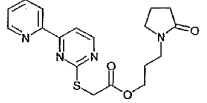
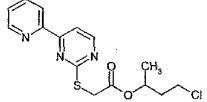
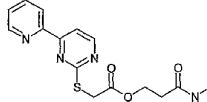
- 138 -

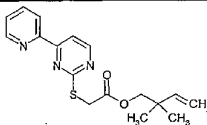
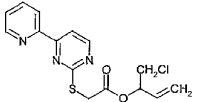
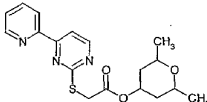
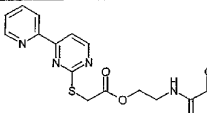
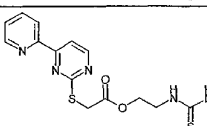
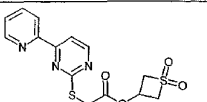
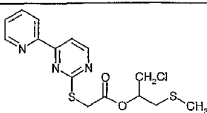
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
154		3.60	
155			
156			
157			
158		1.98	
159		4.00	
160		1.59	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 139 -

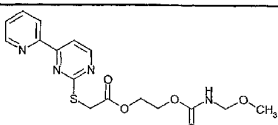
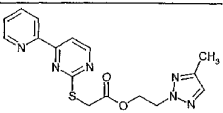
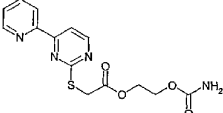
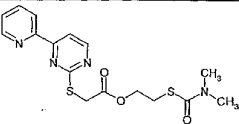
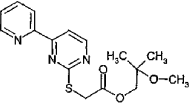
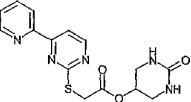
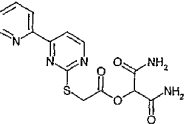
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
161		1.16	
162			
163		1.11	
164		2.05	
165		1.64	
166			
167			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2,3)	Fp./°C
168		3.48	
169			
170			
171			
172		1.79	
173		1.67	
174			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

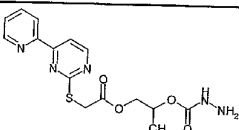
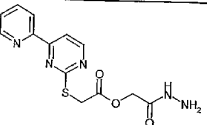
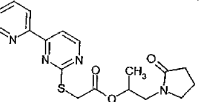
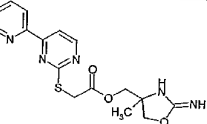
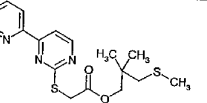
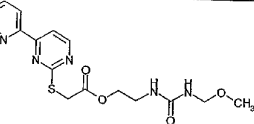
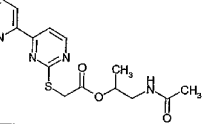
- 141 -

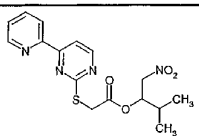
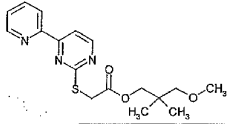
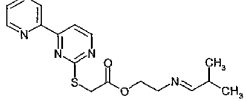
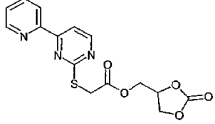
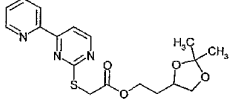
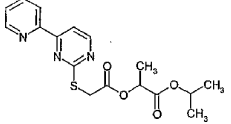
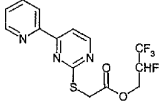
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
175		1.64	
176		1.93	
177		1.41	
178		2.20	
179		2.29	
180			
181			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 142 -

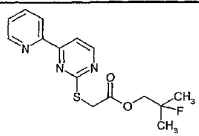
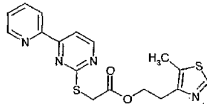
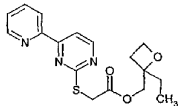
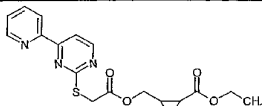
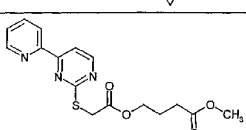
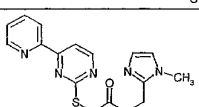
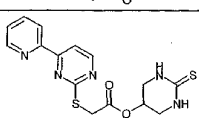
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
182			
183			
184			
185			
186		3.46	
187			
188		1.97	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
189			
190		3.05	
191		2.02	
192		1.63	
193		2.46	
194		2.95	
195		2.72	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 144 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
196		2.66	
197		1.79	
198		2.20	
199		2.64	
200		2.21	
201		1.02	
202			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
203		2.78	
204		1.20	
205		3.81	
206		1.64	
207		2.61	
208			
209		1.32	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

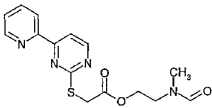
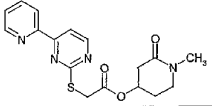
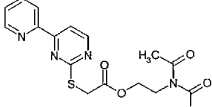
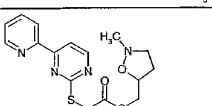
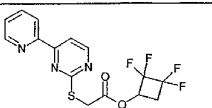
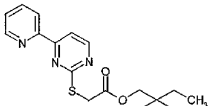
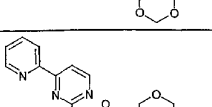
- 146 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2,3)	Fp./°C
210		1.42	
211		2.75	
212		2.13	
213		1.42	
214		2.13	
215		3.48	
216		2.04	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

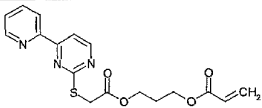
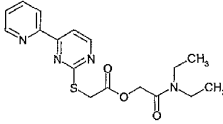
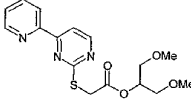
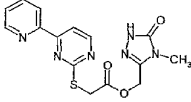
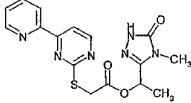
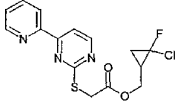
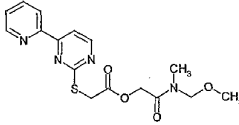
- 147 -

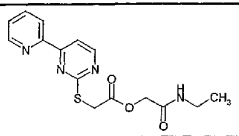
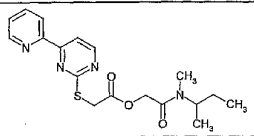
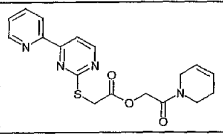
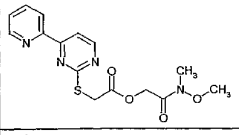
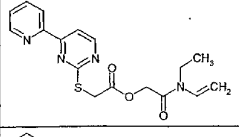
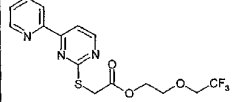
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
217		1.40	
218			
219			
220		1.12	
221		3.00	
222		2.51	
223			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 148 -

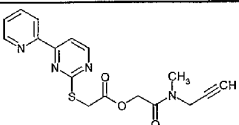
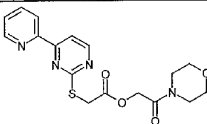
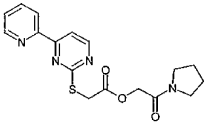
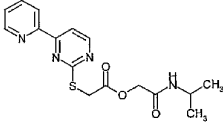
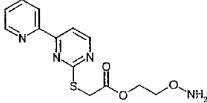
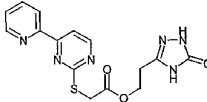
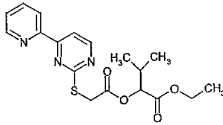
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
224		2.49	
225			
226			
227			
228			
229			
230		1.96	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
231		1.97	
232			
233			
234		1.97	
235			
236		2.70	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

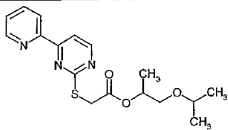
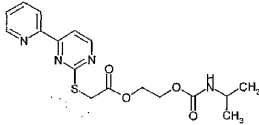
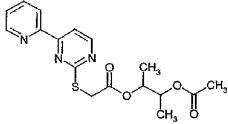
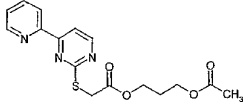
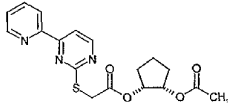
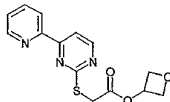
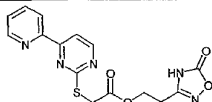
- 150 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
237			
238			
239			
240			
241			
242			
243		3.20	

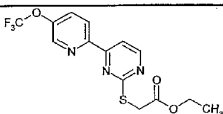
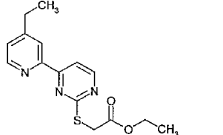
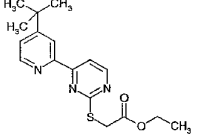
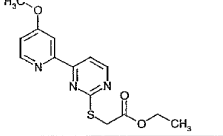
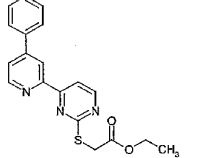
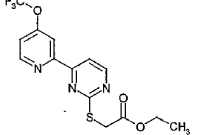
WO 02/067684

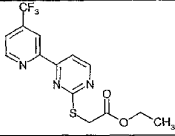
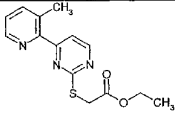
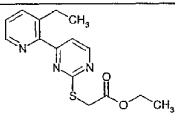
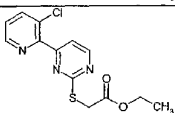
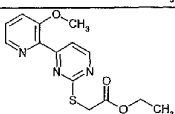
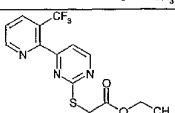
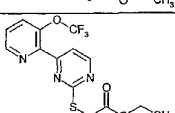
PCT/EP02/01403

- 151 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
244			
245		2.19	
246		2.54	
247			
248		2.65	
249		1.69	
250		1.97	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
251			
252		2.25	
253		3.19	
254		2.98	
255			
256		3.23	
257		3.48	

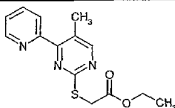
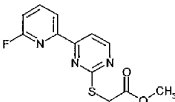
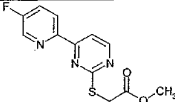
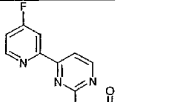
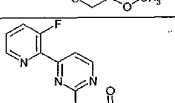
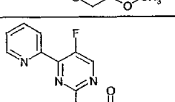
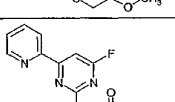
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
258			
259		2.69	
260			
261		1.62	
262		3.54	
263			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
264			
265		1.85	
266		2.22	
267			
268		1.34	
269		2.53	
270			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 155 -

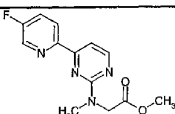
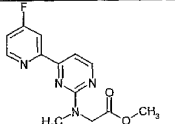
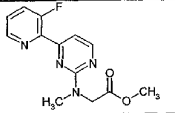
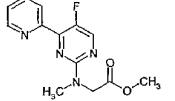
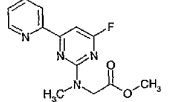
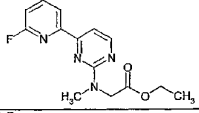
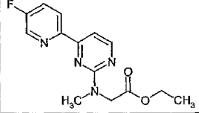
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
271		2.18	64-65
272			
273			
274			
275			
276			
277			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 156 -

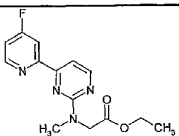
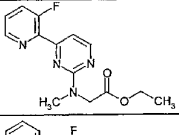
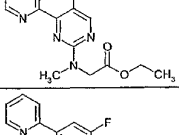
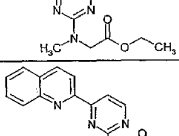
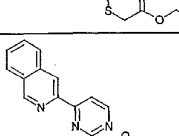
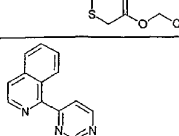
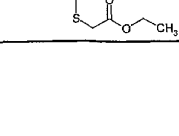
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
278			
279			
280			
281		2.04	
282			
283			
284			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
285			
286			
287			
288			
289			
290			
291			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

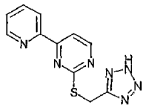
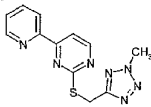
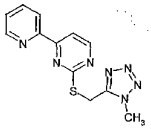
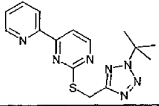
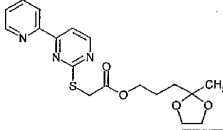
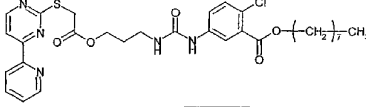
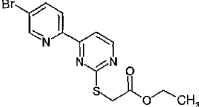
- 158 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
292			
293			
294			
295			
296		3.49	
297			
298		2.51	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 159 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2,3)	Fp./°C
299		1.17	162
300		1.59	
301		1.24	
302		2.69	
303		2.57	
304		5.37	
305		3.39	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

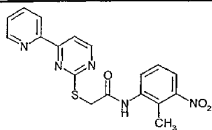
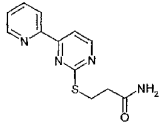
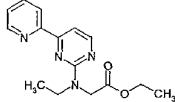
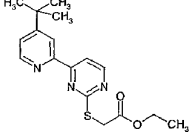
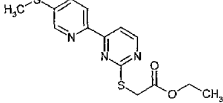
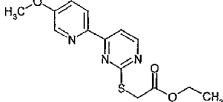
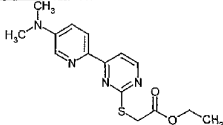
- 160 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp, °C
306		2.77	
307		3.31	
308		2.25	
309		2.16	
310		1.93	
311		3.39	
312		3.61	

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

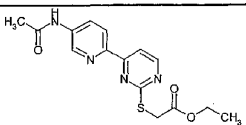
- 161 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
313		2.28	
314		0.96	
315		2.13	
316		3.55	
317		1.68	
318			
319			

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 162 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
320			

- 5 Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

10

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

15

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 163 -

AnwendungsbeispieleBeispiel A5 **Aphis gossypii-Test**

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Baumwollblätter (*Gossypium hirsutum*), die stark von der Baumwollblattlaus (*Aphis gossypii*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

20 Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

25

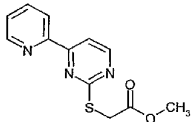
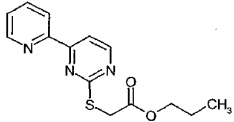
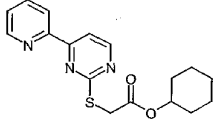
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 164 -

Tabelle A
pflanzenschädigende Insekten
Aphis gossypii-Test

5

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
	200	85
	200	85
	200	90

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 165 -

Beispiel B**Franklinella-Test**

- 5 Lösungsmittel: 3 Gewichtsteile Dimethylformamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

- 10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator
und verdünnt das Konzentrat auf die gewünschte Konzentration.

- 15 Gurkenpflanzen (*Cucumis sativus*), die stark von allen Stadien der Thripse (*Franklinella occidentalis*) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der
gewünschten Konzentration gespritzt.

- Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Thripse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Thripse abgetötet wurden.

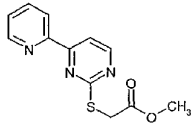
- 20 Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden
Tabelle hervor.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 166 -

Tabelle B
pflanzenschädigende Insekten
Franklinella-Test

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 ^d
 <chem>CCOC(=O)CS1=NC2=CC=CC=C2N=C1</chem>	1000	99

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 167 -

Beispiel C**Meloidogyne-Test**

- 5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 10 Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, Meloidogyne incognita-Ei-Larvensuspension und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

- Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass keine Gallen gefunden wurden; 0 %
15 bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der der unbehandelten Kontrolle entspricht.

- Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.
20

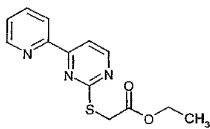
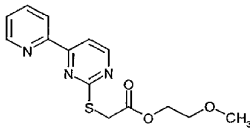
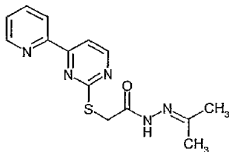
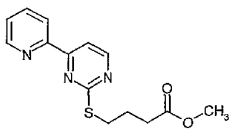
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 168 -

Tabelle C-1
pflanzenschädigende Nematoden
Meloidogyne -Test

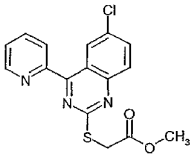
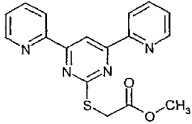
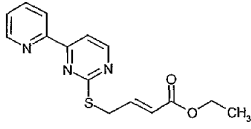
Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 ^d
	20	90
	20	90
	20	98
	20	90

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 169 -

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 ^d
	20	98
	20	95
	20	100

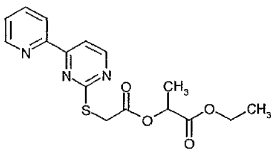
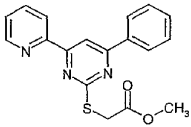
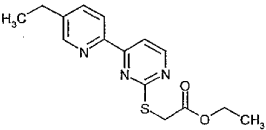
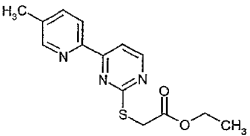
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 170 -

Tabelle C-2
pflanzenschädigende Nematoden
Meloidogyne -Test

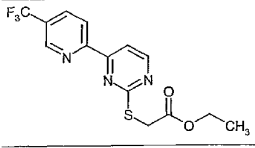
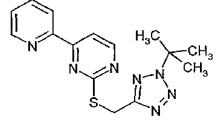
Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 2 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 ^d
	20	80
	20	100
	20	90
	20	90

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 171 -

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 ^d
 <chem>CCOC(=O)CSC1=NC2=CC=CC=C2N1</chem>	20	100
 <chem>CC(C)(C)N1C2=CC=CC=C2N1SC3=NC4=CC=CC=C4N3</chem>	20	90

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 172 -

Beispiel D**Myzus-Test**

- 5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.
- 10 Kohlblätter (*Brassica oleracea*), die stark von der Pfirsichblatlaus (*Myzus persicae*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

- Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.
- 15

Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

20

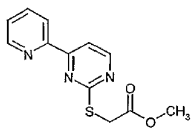
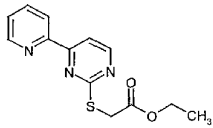
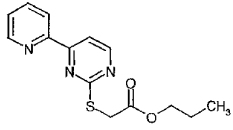
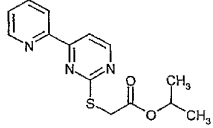
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 173 -

Tabelle D-1
pflanzenschädigende Insekten
Myzus- Test

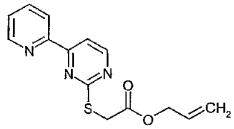
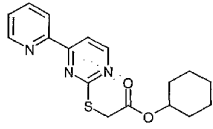
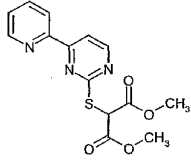
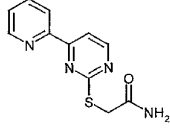
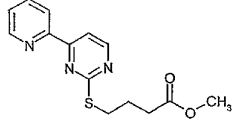
Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
	100	100
	1000	100
	1000	95
	1000	100

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

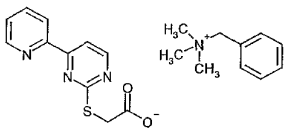
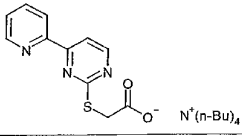
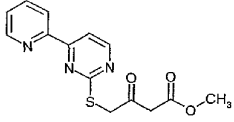
- 174 -

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
	1000	95
	1000	100
	100	95
	1000	95
	1000	100

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 175 -

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
	1000	100
	1000	100
	200	95

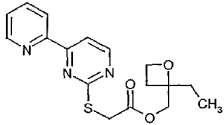
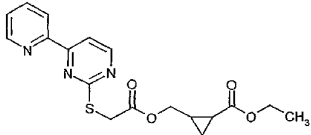
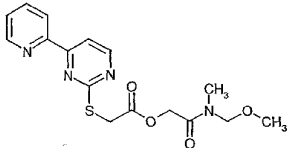
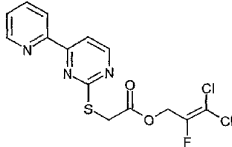
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 176 -

Tabelle D-2
pflanzenschädigende Insekten
Myzus- Test

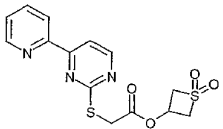
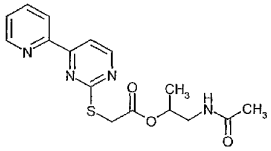
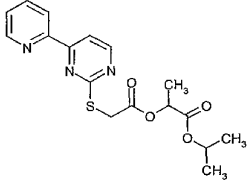
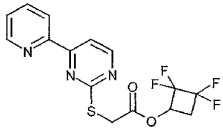
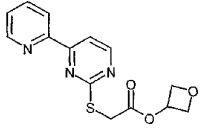
Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 2 Gewichtsteil Alkylaryl/polyglykoether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
	500	98
	500	98
	500	98
	500	100

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

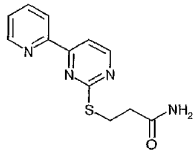
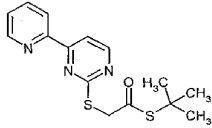
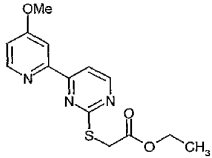
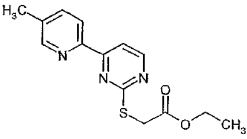
- 177 -

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
	500	100
	500	95
	500	95
	500	100
	500	95

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 178 -

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
	500	80
	500	95
	500	90
	500	98

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 179 -

Beispiel E**Phaedon-Larven-Test**

5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

20

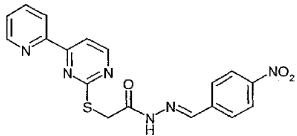
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 180 -

Tabelle E-1
pflanzenschädigende Insekten
Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel:	30	Gewichtsteile	Dimethylformamid
5 Emulgator:	1	Gewichtsteil	Alkylarylpolyglykoether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 ^d
 <chem>O=[N+]([O-])c1ccc(cc1)/N=C/NC(=O)CS2N=CN=C2c3ccncc3</chem>	1000	100

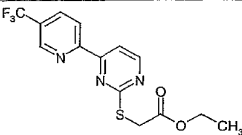
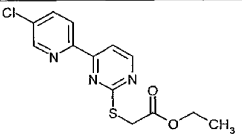
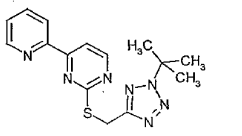
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 181 -

Tabelle E-2
pflanzenschädigende Insekten
Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 2 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 ^d
	500	100
	500	100
	500	100

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 182 -

Beispiel F**Spodoptera frugiperda-Test**

- 5 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
 Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurms (*Spodoptera frugiperda*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

 Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

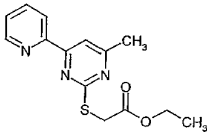
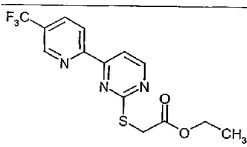
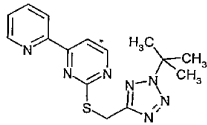
20 Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 183 -

Tabelle F
pflanzenschädigende Insekten
Spodoptera frugiperda -Test

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 ^d
	500	100
	500	100
	500	100

Beispiel G**Diabrotica balteata** – Test (Larven im Boden)

Grenzkonzentrations-Test / Bodeninsekten - Behandlung transgener Pflanzen

5

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykoether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Die Wirkstoffzubereitung wird auf den Boden gegossen. Dabei spielt die Konzentration des Wirkstoffs in der Zubereitung praktisch keine Rolle, entscheidend ist allein die Wirkstoffgewichtsmenge pro Volumeneinheit Boden, welche in ppm (mg/l) angegeben wird. Man füllt den Boden in 0,25 l Töpfe und lässt diese bei 20°C stehen.

20

Sofort nach dem Ansatz werden je Topf 5 vorgekeimte Maiskörner der Sorte YIELD GUARD (Warenzeichen von Monsanto Comp., USA) gelegt. Nach 2 Tagen werden in den behandelten Boden die entsprechenden Testinsekten gesetzt. Nach weiteren 7 Tagen wird der Wirkungsgrad des Wirkstoffs durch Auszählen der aufgelaufenen Maispflanzen bestimmt (1 Pflanze = 20% Wirkung).

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 185 -

Beispiel II**Heliothis virescens - Test** (Behandlung transgener Pflanzen)

- 5 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Ge-
 wichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen
10 Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte
 Konzentration.

 Sojabtriebe (Glycine max) der Sorte Roundup Ready (Warenzeichen der Monsanto
 Comp. USA) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten
15 Konzentration behandelt und mit der Tabakknospenraupe *Heliothis virescens* besetzt,
 solange die Blätter noch feucht sind.

 Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %,
 dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wur-
20 den.

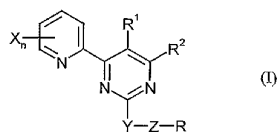
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 186 -

Patentansprüche

1. Pyridylpyrimidine der Formel (I)



5

in welcher

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, Cycloalkyl; oder für gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,

15

R¹ und R² außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl substituiert sein kann,

20

X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Hetero-

25

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 187 -

cyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht;

5 oder wenn n für 2, 3 oder 4 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann,

10 n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2, 3 oder 4 steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-\text{S}(\text{O})_p-$ oder $-\text{NR}^3-$ steht,

15 p für 0, 1 oder 2 steht,

Z für $-(\text{CH}_2)_r-$, $-(\text{CH}_2)_t-(\text{CHR}^{10})-(\text{CH}_2)_w-$, $-(\text{CH}_2)_r-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_t-$, $-(\text{CH}_2)_r-\text{O}-(\text{CH}_2)_t-$, $-(\text{CH}_2)_r-\text{S}(\text{O})_p-(\text{CH}_2)_t-$, $-(\text{CH}_2)_t-\text{N}(\text{R}^{11})-(\text{CH}_2)_t-$ oder $-(\text{CH}_2)_t-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{C}(\text{R}^{13})-(\text{CH}_2)_w-$ steht,

20 r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,

t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

25 R für die Gruppierung

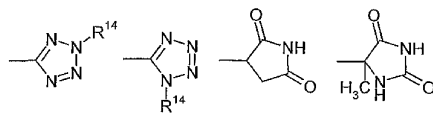


oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 188 -



steht,

- 5 A für Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁵ steht,
- E für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M, -S-M oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,
- 10 M für gegebenenfalls durch Alkyl, Aryl oder Arylalkyl substituiertes Ammonium oder für ein Alkalimetallion steht,
- M außerdem für ein Erdalkalimetallion steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 15 R³ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 20 R⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl oder Alkylcarbonyl steht,
- 25 R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Oxamoyl steht,
- R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für Alkyliden; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen;

- 5 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann,
- R⁶ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl oder Arylalkyl steht,
- 10 R⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,
- R⁸ für Alkyl oder Halogenalkyl steht,
- 15 R⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 20 R¹⁰ für Halogen, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für Aryl oder Arylalkyl, welche ihrerseits im Arylteil durch Halogen oder Alkyl substituiert sein können, steht,
- 25 R¹¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- R¹² und R¹³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl oder Alkoxy stehen,
- 30 R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

- R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Cyano oder Dialkylamino steht,
- 5 R¹⁶ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxy-carbonyl, Alkyl-carbonyloxy, Alkenyl-carbonyloxy, Oxyalkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkyl-carbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,
- 10 15 R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten
- 20 zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- R¹⁷ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- 25 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,
- 30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 191 -

R¹⁸ außerdem für jeweils gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl substituiertes Alkyl oder Alkenyl steht,

5

R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,

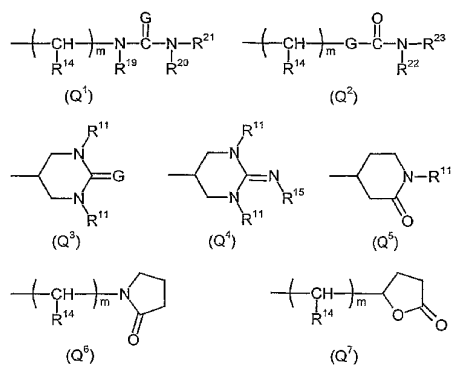
10

R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 bis 2 weitere Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann, stehen,

15

Q für eine der folgenden Gruppierungen

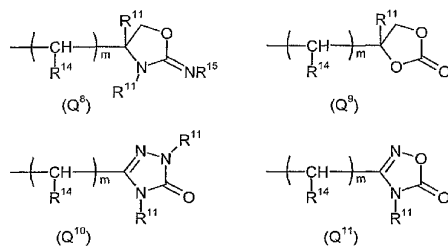
20



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 192 -



steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen,

m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder gemeinsam für Alkylen stehen,

R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Alkylcarbonyloxy oder Alkoxy substituiertes Alkyl; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylen substituiertes Aryl steht,

R²² für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

R²³ für Wasserstoff, Amino, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht.

2. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- 5 R^{16} für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxyalkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, $-\text{CONR}^4\text{R}^5$, $-\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{ONR}^4\text{R}^5$, $-\text{C}(\text{R}^{14})=\text{N}-\text{OR}^{14}$ substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für $-\text{NR}^4\text{R}^5$ oder für einen der Reste Q steht,
- 15 R^{18} für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^3$, $-\text{OR}^{14}$ oder $-\text{NR}^4\text{R}^5$ steht.
- 20
3. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- 25 R^1 und R^2 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Halogenalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Halogenalkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkylthio}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Halogenalkylthio}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Alkenyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Alkynyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Alkenyloxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Halogenalkenyloxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Alkinyloxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Halogenalkinyloxy}$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^3$, $-\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{COR}^6$, $-\text{CO}_2\text{R}^7$, $-\text{CSR}^6$, $-\text{CONR}^4\text{R}^5$, $-\text{NHCO}_2\text{R}^8$, $\text{C}_3\text{-C}_7\text{-Cycloalkyl}$; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden
- 30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 194 -

- 5 durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl oder 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, stehen,
- 10 R¹ und R² außerdem gemeinsam für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann,
- 15 X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkynyloxy, C₂-C₆-Halogenalkynyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₇-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6- gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, steht;
- 20 oder wenn n für 2 oder 3 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann,
- 25 n für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 oder 3 steht,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 195 -

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p-$ oder $-NR^9-$ steht,

p für 0, 1 oder 2 steht,

5 Z für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$, $-(CH_2)_t-C(O)-(CH_2)_t-$,
 $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-S(O)_p-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-N(R^{11})-(CH_2)_t-$
 oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ steht,

r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,

10

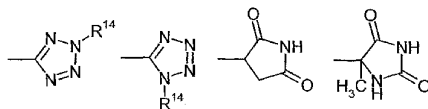
t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

R für die Gruppierung



15

oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



20

steht,

A für Sauerstoff, Schwefel oder NR^{15} steht,

E für $-OR^{16}$, $-SR^{16}$, $-O-M$, $-S-M$ oder $-NR^{17}R^{18}$ steht,

25

M für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C_1-C_6 -Alkyl, Aryl oder Aryl- C_1-C_6 -alkyl substituiertes Ammonium

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 196 -

oder für ein Lithiumkation (Li^+), ein Natriumkation (Na^+) oder ein Kaliumkation (K^+) steht,

5 M außerdem für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,

10 R³ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4
15 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,

20 R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl steht,

R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Oxamoyl steht,

25 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für C₁-C₆-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen,
30

R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 197 -

ungesättigten Heterocyclen stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann,

- 5 R⁶ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,
- 10 R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,
- R⁸ für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht,
- 15 R⁹ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclen oder Heterocyclen-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,
- 20 R¹⁰ für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein können, steht,
- 25 R¹¹ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,
- 30

R¹² und R¹³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy stehen,

R¹⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht,

R¹⁵ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Cyano oder Di(C₁-C₆-alkyl)amino steht,

R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₆-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₆-alkyl)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,

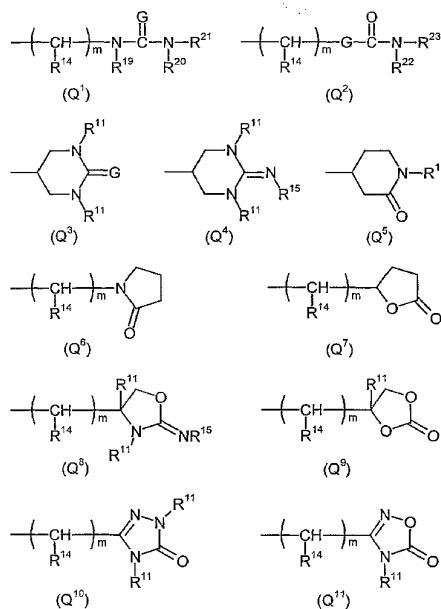
R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte

Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,

- 5 R¹⁷ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,
- R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl; oder
 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder ver-
 schieden durch Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 10 C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-
 Halogenalkylthio, Oxy(C₁-C₆-alkyl)oxy substituiertes C₃-C₇-
 Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl,
 Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4
 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0
 15 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³,
 -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,
- R¹⁸ außerdem für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden
 durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-
 20 C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-
 Alkoxycarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxycarbonyl substituiertes C₁-C₆-
 Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl steht,
- R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich
 25 oder verschieden substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-
 C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-
 C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benach-
 barte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-
 atome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben
 30 genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden
 können,

R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclen, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann, stehen,

Q für eine der folgenden Gruppierungen



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 201 -

steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen,

- 5 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,
- 10 G für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder gemeinsam für C₂-C₄-Alkylen stehen,
- 15 R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₁₀-Alkoxy carbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl steht,
- 20 R²² für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl steht,
- R²³ für Wasserstoff, Amino, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl steht.
- 25 4. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 3, in welcher
- R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxy car-
- 30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 202 -

bonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₆-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocycl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,

R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht.

5. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 203 -

5 C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl; oder für
 10 jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, stehen,

15 R¹ und R² außerdem gemeinsam für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, stehen,

20 X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl,
 25 -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, steht,

30 oder wenn n für 2 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für C₃-C₄-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen steht, wobei die Koh-

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 204 -

lenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann,

5 n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p-$ oder $-NR^9-$ steht,

10 p für 0, 1 oder 2 steht,

Z für $-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$, $-(CH_2)_t-C(O)-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-S(O)_p-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_t-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ steht,

15

r für 1, 2, 3 oder 4 steht,

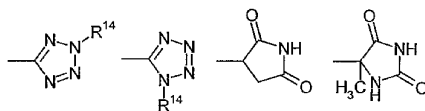
t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

20 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe

25



steht,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 205 -

- A für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- E für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M, -S-M oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,
- 5 M für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Phenyl, Benzyl oder Phenylethyl substituiertes Ammonium oder für ein Natriumkation (Na⁺) oder ein Kaliumkation (K⁺) steht,
- 10 M außerdem für ein Magnesiumkation (Mg²⁺) oder ein Calciumkation (Ca²⁺) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 15 R³ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,
- 25 R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl steht,
- 30 R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder

Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Oxamoyl steht,

- 5 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für C₁-C₄-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Benzyliden steht,
- 10 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, steht,
- 15 R⁶ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,
- 20 R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,
- 25 R⁸ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- 30 R⁹ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder

5

10

15

15

20

25

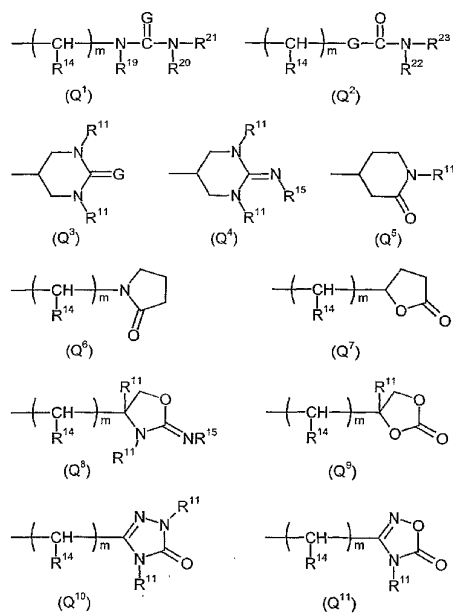
30

- 5 -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q steht,
- 10
- 15 R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkynyl steht,
- 20
- R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche
- 25 jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- 30 R¹⁷ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht,

- 5 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl; oder
 für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
 verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-
 Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-
 Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder
 10 Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9
 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy
 substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl,
 Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, welche
 15 jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte
 Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome
 enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,
- 20 R¹⁸ außerdem für jeweils einfach bis vierfach, gleich oder verschieden
 durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-
 Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder
 Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9
 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₂-C₄-
 Alkenyloxycarbonyl substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl;
 25 oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl,
 gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituier-
 tes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl steht,
- 30 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
 verschieden substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-
 C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-
 alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benach-
 barte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-
 atome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben
 genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden
 können,

R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclen, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, stehen,

Q für eine der folgenden Gruppierungen



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 211 -

steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen steht,

- 5 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,
- 10 G für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder gemeinsam für C₂-C₃-Alkylen stehen,
- 15 R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₄-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Brom-
- 20 atomen, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₈-Alkoxy-carbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl steht,
- R²² für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl steht,
- 25 R²³ für Wasserstoff, Amino, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl steht.
6. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 5, in welcher
- 30 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor-

- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₄-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q steht,
- R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht.

7. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, Amino, Cyclopentyl, Cyclohexyl; jeweils gegebenenfalls durch Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Pyridinyl, Furyl, Furfuryl stehen,
- R¹ und R² außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH-, -CH=CCl-CH=CH- stehen,
- X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -CH=CH₂, -C≡CH, Amino, -NHMe, -NMe₂, -CHO, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, -NHCOMe, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl; oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH- steht,

WO 02/067684

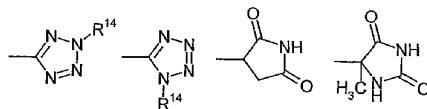
PCT/EP02/01403

- 214 -

- 5 X außerdem für Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, i-Propylthio steht,
- n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,
- Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p$ - oder $-NR^9$ - steht,
- p für 0, 1 oder 2 steht,
- 10 Z für $-CH_2$ -, $-(CH_2)_2$ -, $-(CH_2)_3$ -, $-(CH_2)_4$ -, $-(CHR^{10})$ -, $-CH_2-C(O)-CH_2$ -, $-CH_2-NH$ -, $-CH=CH$ -, $-CH_2-CH=CH$ -, $-CH=C(OH)$ -, $-CH=C(OMe)$ -, $-CH_2-C(OMe)=CH$ - steht,
- Z außerdem für $-CH_2-C(OEt)=CH$ - steht,
- 15 R für die Gruppierung



- 20 oder für ein Carbonsäureisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



steht,

- 25 A für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- E für $-OR^{16}$ -, $-SR^{16}$ -, $-O-M$ oder $-NR^{17}R^{18}$ steht,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 215 -

- M für Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium oder für ein Natriumkation (Na^+) oder ein Kaliumkation (K^+) steht,
- 5 M außerdem für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 10 R⁴ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe steht,
- R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Propargyl, Methoxy, Methoxymethyl, -COMe, -COEt, t-Butoxycarbonyl, Oxamoyl steht,
- 15 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für Ethyliden, i-Propyliden, s-Butyliden, Nitrobenzyliden stehen,
- 20 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Piperidin, Thiomorpholin, Pyrrolidin, Tetrahydropyridin, der gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl substituiert sein kann, stehen,
- 25 R⁸ für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H oder für -CF₂CHFCF₃ steht,
- 30 R⁹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CH₂CF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 216 -

- 5 R¹⁰ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe, -COEt, -CO₂Me, -CO₂Et, Cyclohexyl; Phenyl oder Benzyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiert sein können steht,
- 10 R¹¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl steht,
- 15 R¹⁴ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl oder t-Butyl steht,
- 20 R¹⁵ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl oder Cyano steht,
- 25 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, -O-(CH₂)₂-O-, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -CH=N-OCH₃ substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-
- 30

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 217 -

- methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -CO₂Me, -CO₂Et, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazolylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxidethylethyl; oder für einen der Reste Q steht,
- R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl steht,
- R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 218 -

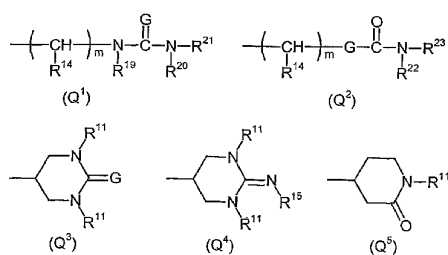
- 5 Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxidethylethyl steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- 10 R¹⁷ für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,
- 20 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH₂-O-substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für -SO₂Me, -SO₂Et oder -NR⁴R⁵ steht,
- 25
- 30 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃,

Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl steht,

R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl ausgewählt werden können,

R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Piperazin, Morphin, Piperidin, Pyrrolidin, welcher gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl substituiert sein kann, steht,

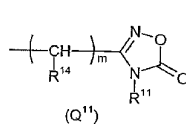
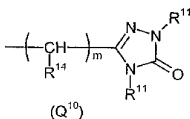
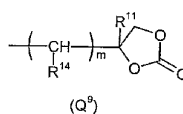
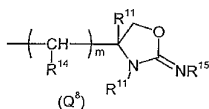
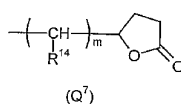
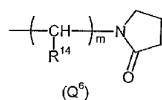
Q für eine der folgenden Gruppierungen



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 220 -



- 5 steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen steht,
- 10 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,
- 15 G für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, oder gemeinsam für -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃- steht,
- 20 R²¹ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach durch t-Butyl-carbonyloxy oder Methoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Chlor,

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 221 -

Cyano, Methyl, Ethyl, t-Butyl, Trifluormethyl, s-Butyloxycarbonyl, t-Butyloxycarbonyl, n-Octyloxycarbonyl, -(CH₂)₄- substituiertes Phenyl steht,

- 5 R²² für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Methoxymethyl steht,
- R²³ für Wasserstoff, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl oder Methoxymethyl steht.
- 10 8. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 7, in welcher
- X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHF₂CF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHF₂CF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -CH=CH₂, -C≡CH, Amino, -NHMe, -NMe₂, -CHO, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, -NHCOMe, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl; oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH- steht,
- 15 Z für -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CHR¹⁰)-, -CH₂-C(O)-CH₂-, -CH₂-NH-, -CH=CH-, -CH₂-CH=CH-, -CH=C(OH)-, -CH=C(OMe)-, -CH₂-C(OMe)=CH- steht,
- 20 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano,
- 25
- 30

Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$,
 Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio,
 Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl,
 Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, $-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-$, Oxetanyl,
 5 Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy,
 $-\text{CONR}^4\text{R}^5$, $-\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{ONR}^4\text{R}^5$, $-\text{CH}=\text{N}-\text{OCH}_3$ substituiertes Methyl,
 Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl,
 Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-
 Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl,
 10 Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis
 dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl,
 Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, $-\text{CF}_3$,
 $-\text{CCl}_3$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CClF}_2$, $-\text{CHCl}_2$, $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$, $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CF}_2\text{CHF}_2$, $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$, $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$,
 15 $-\text{CF}_2\text{CHF}_2$, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-
 methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, $-\text{CO}_2\text{Me}$,
 $-\text{CO}_2\text{Et}$, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl,
 Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclo-
 hexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl,
 20 Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentyl-
 ethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl,
 Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl,
 Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl,
 Tetrahydropyranlyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazo-
 25 lanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl,
 Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl,
 Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl,
 Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolyl-
 methyl, Tetrahydropyranlylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxid-
 30 methyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanyl-
 ethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl,
 Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl,

WO 02/067684

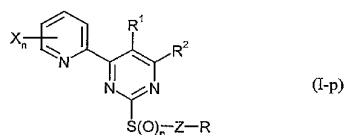
PCT/EP02/01403

- 223 -

Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxidylethyl; oder für einen der Reste Q steht,

- 5 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, 10 Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH₂-O-substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für -SO₂Me, -SO₂Et oder -NR⁴R⁵ steht.

- 15 9. Pyridylpyrimidine der Formel (I-p)

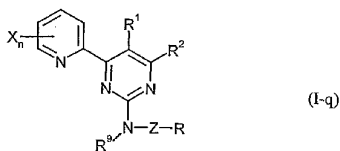


in welcher

R¹, R², X, n, p, Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

20

10. Pyridylpyrimidine der Formel (I-q)



in welcher

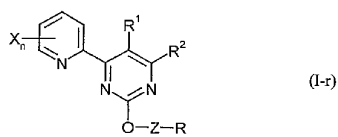
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 224 -

R^1 , R^2 , X , n , Z , R und R^9 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

11. Pyridylpyrimidine der Formel (I-r)

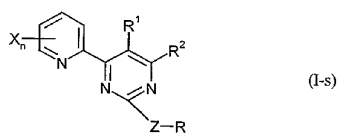


5

in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

- 10 12. Pyridylpyrimidine der Formel (I-s)

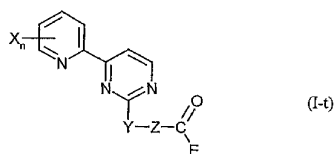


in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

15

13. Pyridylpyrimidine der Formel (I-t)



in welcher

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 225 -

X für Methyl, Ethyl, Chlor, Brom, $-\text{CF}_3$, Methoxy oder Trifluormethoxy steht,

n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,

Y für $-\text{S}-$ oder $-\text{NR}^9-$ steht,

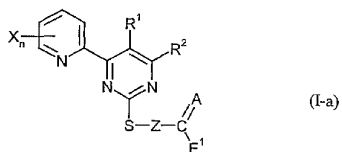
Z für $-\text{CH}_2-$ oder $-(\text{CH}_2)_2-$ steht,

E für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, i-Butoxy, s-Butoxy, t-Butoxy, $-\text{NH}-\text{SO}_2\text{Me}$ oder $-\text{NH}-\text{SO}_2\text{Et}$ steht,

R^9 für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

14. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet,

dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-a)



in welcher

R^1 , R^2 , X, n, Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

E^1 für $-\text{OR}^{16}$, $-\text{SR}^{16}$ oder $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ steht,

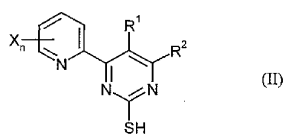
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 226 -

erhält, indem man

A) Thiole der Formel (II)



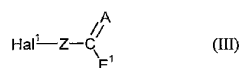
5

in welcher

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

10

mit Halogen-Verbindungen der Formel (III)



in welcher

15

Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

E¹ die oben angegebenen Bedeutungen hat,Hal¹ für Halogen steht,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
enenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt,

oder

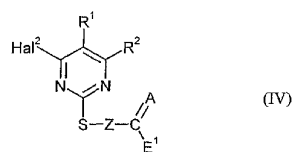
25

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 227 -

B) Halogenpyrimidine der Formel (IV)



in welcher

5

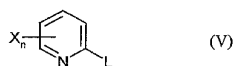
R¹, R², Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

E¹ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

10

Hal² für Halogen steht,

mit Pyridin-Verbindungen der Formel (V)



15

in welcher

X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

L für Sn(Alkyl)₃, Sn(Aryl)₃, ZnBr oder ZnCl steht,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt,

oder

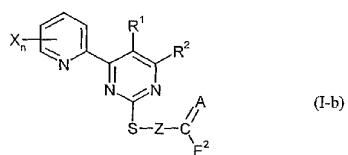
25

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 228 -

C) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-b)



in welcher

5

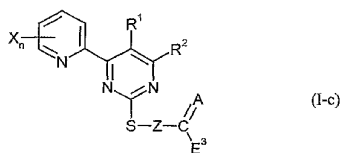
R^1 , R^2 , X , n , Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

E^2 für $-NR^{17}R^{18}$ steht,

10

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-c)



15

in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

20

E^3 für $-OR^{16}$ steht, wobei R^{16} die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

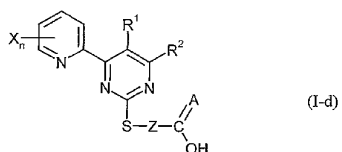
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 229 -

in einer ersten Stufe gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels mit einer Base behandelt und die entstandene Verbindung der Formel (I-d)

5

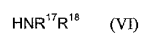


in welcher

10

R^1 , R^2 , X , n , Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

in einer zweiten Stufe mit Aminen der Formel (VI)



15

in welcher

R^{17} und R^{18} die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines wasserabsorbierenden Reagenzes umsetzt,

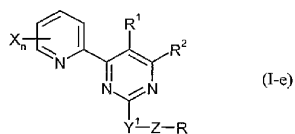
oder

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 230 -

D) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-e)



in welcher

5

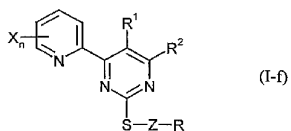
R^1 , R^2 , X , n , Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

Y^1 für -SO- oder -SO₂- steht,

10

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-f)



15

in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit einem Oxidationsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oxidiert,

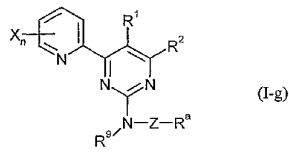
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 231 -

oder

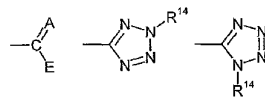
E) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-g)



in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z und R^9 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

R^a für eine der folgenden Gruppierungen steht



in welcher

R^{14} die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

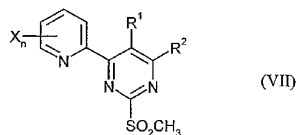
erhält, indem man

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 232 -

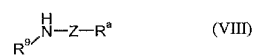


in welcher

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Aminen der Formel (VIII)



in welcher

10

Z und R⁹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

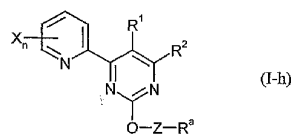
15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

oder

20

F) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-h)



WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 233 -

in welcher

R^1 , R^2 , X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

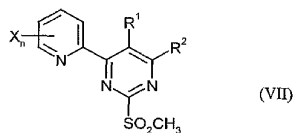
5

R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

10

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

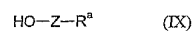


in welcher

15

R^1 , R^2 , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX)



20

in welcher

Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

WO 02/067684

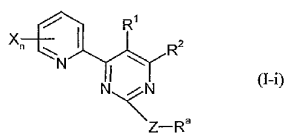
PCT/EP02/01403

- 234 -

oder

G) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-i)

5



in welcher

R^1 , R^2 , X , n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

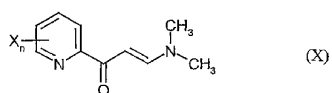
10

R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

15

Pyridin-Derivate der Formel (X)



in welcher

20

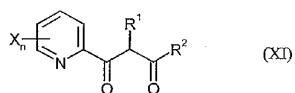
X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

oder Pyridin-Derivate der Formel (XI)

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 235 -

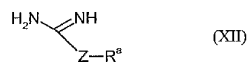


in welcher

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Amidinen der Formel (XII)



in welcher

10

Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

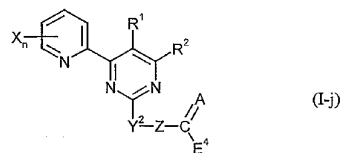
15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

oder

20

H) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-j)



in welcher

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 236 -

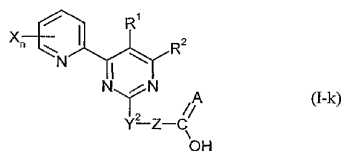
Y² für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR⁹- steht,

E⁴ für -O-M oder -S-M steht und

5 R¹, R², X, n, Z, A und M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

10 Pyridylpyrimidine der Formel (I-k)



in welcher

15 R¹, R², X, n, Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20 mit Hydroxiden der Formel (XIII)

M OH⁻ (XIII)

in welcher

25 M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

WO 02/067684

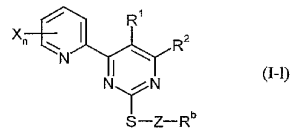
PCT/EP02/01403

- 237 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

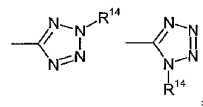
5 J) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-I)



in welcher

10 R¹, R², X, n, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

R^b für eine der folgenden Gruppierungen steht



15

worin R¹⁴ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

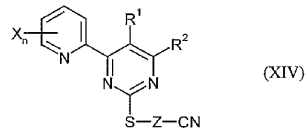
20

Nitrile der Formel (XIV)

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 238 -



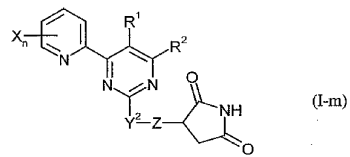
in welcher

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen
haben

mit Trialkylzinnaaziden gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün-
nungsmittels umgesetzt,

oder

K) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-m)



in welcher

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen
haben,

Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

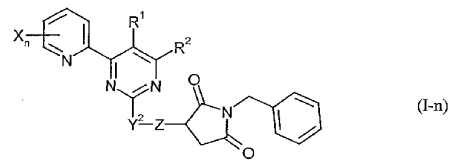
erhält, indem man

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 239 -

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)



in welcher

5

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

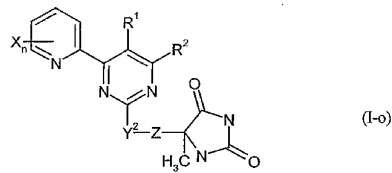
10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

oder

15

L) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-o)



in welcher

20

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

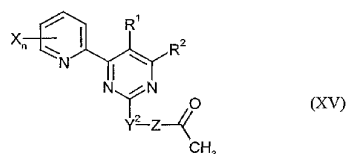
- 240 -

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

Keto-Verbindungen der Formel (XV)



in welcher

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

mit Ammoniumcarbonat und Kaliumcyanid gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

20

15. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
16. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.

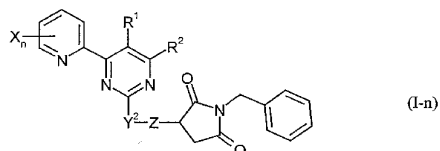
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 241 -

17. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.
- 5 18. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
19. Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)

10



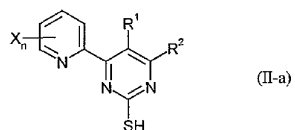
in welcher

Y² für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR⁹- steht,

15

R¹, R², X, n, Z und R⁹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

20. Thiole der Formel (II-a)



20

in welcher

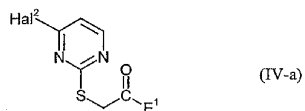
WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 242 -

R^1 , R^2 , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, mit der Maßgabe, dass wenigstens einer der Reste R^1 , R^2 oder X nicht für Wasserstoff steht.

- 5 21. Halogenpyrimidine der Formel (IV-a)



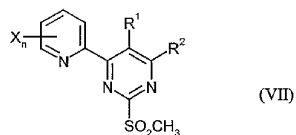
in welcher

- 10 a) E^1 für Methoxy oder Ethoxy steht und
 Hal^2 für Brom steht,

oder

- 15 b) E^1 für Methoxy steht und
 Hal^2 für Chlor steht.

22. Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



20

in welcher

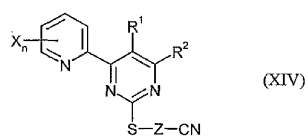
R^1 , R^2 , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 243 -

23. Nitrile der Formel (XIV)

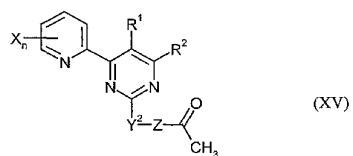


in welcher

5

 R^1 , R^2 , X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

24. Keto-Verbindungen der Formel (XV)



10

in welcher

 Y^2 für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR⁹- steht,

15

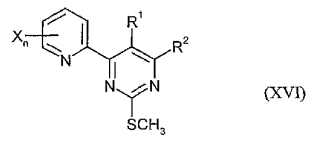
 R^1 , R^2 , X, n, Z und R⁹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

WO 02/067684

PCT/EP02/01403

- 244 -

25. Methylthio-Derivate der Formel (XVI)



in welcher

5

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No. PCT/EP 02/01403
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A01N43/54 A01N43/647 A01N43/653 A01N43/707 A01N43/74 A01N43/76 A01N43/78 A01N43/80 C07D401/04 C07D401/14 C07D405/14 C07D409/14 C07D417/14 C07D413/14 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 A01N C07D 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, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 532 (P-1619), 24 September 1993 (1993-09-24) & JP 05 143796 A (IKUO NAGATA), 11 June 1993 (1993-06-11) Zweite Verbindung in der linken Spalte page 877	1-8, 12, 13
X	WO 00 61586 A (AKZO NOBEL NV ; ADANG ANTON EGBERT PETER (NL); GERRITSMAN GERRILDINA) 19 October 2000 (2000-10-19) example 16 --- -/--	1-8, 12, 13
☒ 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 relating 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. *Z* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
2 May 2002		08/05/2002
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentplan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel: (+31-70) 340-2240, Tx: 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Fritz, M

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1999)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No. PCT/EP 02/01403
C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	SAR ET AL.: "Synthesis, Oxidation and Claisen Rearrangement of 4-(Allyloxy)phenyl-1,4-dihydropyridines and -pyrimidines" ACH MODELS CHEM., vol. 131, no. 3-4, 1994, pages 363-376, XP001070105 Verbindung 11h page 366	25
X	CORONA DEL L ET AL.: "SYNTHESIS AND IN VITRO STUDY OF PLATELET ANTIAGGREGANT ACTIVITY OF 2(4)-IMIDAZOL-1-YL-4(2)-CYCLOALKYLAMINO PYRIMIDINES" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR, vol. 26, 1991, pages 729-733, XP002064599 ISSN: 0223-5234 Erste Verbindung in Scheme 2 page 730	21
A	DE 40 31 798 A (HOECHST AG) 9 April 1992 (1992-04-09) the whole document	1-25
P,X	WO 01 87849 A (KANE JOHN L ;QIAO SHUANG (US); VINICK FRED (US); GENZYME CORP (US)) 22 November 2001 (2001-11-22) page 39, line 6 - line 22	25

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family membersInternational Application No.
PCT/JP 02/01403

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 05143796	A	11-06-1993	NONE
WO 0061586	A	19-10-2000	AU 3816600 A 14-11-2000 BR 0009558 A 19-02-2002 CZ 20013605 A3 13-03-2002 WO 0061586 A1 19-10-2000 EP 1171443 A1 16-01-2002 NO 20014824 A 04-10-2001
DE 4031798	A	09-04-1992	DE 4031798 A1 09-04-1992
WO 0187849	A	22-11-2001	AU 5969101 A 26-11-2001 WO 0187849 A2 22-11-2001

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP02/01403

Continuation of box I.2

The search yielded already in the initial phase a very large number of novelty-destroying documents for claim 1. These documents are so numerous that it is impossible to establish for what subject matter protection could be justifiably sought for the totality of the claims. (Art. 6 PCT). For this reason a meaningful search covering the entire scope of protection sought is impossible. The search was therefore restricted to:

The compounds (I) as defined in claim 1, wherein the term "bioisoster" (used in the definition of R) represents the groups (i.e. -C(=A)-E and the structural formulae on page 188) actually indicated in said claim.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims, or parts of claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). EPO policy, when acting as an International Preliminary Examining Authority, is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case, irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report (Article 19 PCT) or during any Chapter II procedure whereby the applicant provides new claims.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT					Internationales Abkürzungen PCT/EP 02/01403
A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES					
IPK 7	A01N43/54	A01N43/647	A01N43/653	A01N43/707	A01N43/74
	A01N43/76	A01N43/78	A01N43/80	C07D401/04	C07D401/14
	C07D405/14	C07D409/14	C07D417/14	C07D413/14	
Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK					
B. RECHERCHIERTE GEBIETE					
Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)					
IPK 7 A01N C07D					
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, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data					
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN					
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile				Beitr. Anspruch Nr.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 532 (P-1619), 24. September 1993 (1993-09-24) & JP 05 143796 A (IKUO NAGATA), 11. Juni 1993 (1993-06-11) Zweite Verbindung in der linken Spalte Seite 877				1-8, 12, 13
X	WO 00 61586 A (AKZO NOBEL NV ; ADANG ANTON EGBERT PETER (NL); GERRITSMAN GERRILDA) 19. Oktober 2000 (2000-10-19) Beispiel 16 --- -/-				1-8, 12, 13
☒ 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 signalisiert, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum eines anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt worden sei 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 erfindungsfähiger Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindungsfähiger 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 "Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist					
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche			Abschließendes Datum des internationalen Recherchenberichts		
2. Mai 2002			08/05/2002		
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5910 Patentamt 2 NL - 2260 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016			Bevollmächtigter Bediensteter Fritz, M		

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

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT		Internationales Aktenzeichen PCT/JP 02/01403
C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitr. Anspruch Nr.
X	SAR ET AL.: "Synthesis, Oxidation and Claisen Rearrangement of 4-(Allyloxy)phenyl-1,4-dihydropyridines and -pyrimidines" ACH MODELS CHEM., Bd. 131, Nr. 3-4, 1994, Seiten 363-376, XP001070105 Verbindung 11h Seite 366	25
X	CORONA DEL L ET AL.: "SYNTHESIS AND IN VITRO STUDY OF PLATELET ANTIAGGREGANT ACTIVITY OF 2(4)-IMIDAZOL-1-YL-4(2)-CYCLOALKYLAMINO PYRIMIDINES" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR, Bd. 26, 1991, Seiten 729-733, XP002064599 ISSN: 0223-5234 Erste Verbindung in Scheme 2 Seite 730	21
A	DE 40 31 798 A (HOECHST AG) 9. April 1992 (1992-04-09) das ganze Dokument	1-25
P,X	WO 01 87849 A (KANE JOHN L; QIAO SHUANG (US); VINICK FRED (US); GENZYME CORP (US)) 22. November 2001 (2001-11-22) Seite 39, Zeile 6 - Zeile 22	25

Formblatt PCT/ISA210 (Fortsetzung von Blatt 2) (Juli 1999)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT
 Angaben zu Veröffentlichung, die zur selben Patentfamilie gehören

 Internationales Abzeichen
 PCT/EP 02/01403

Im Recherchenbericht angeführtes Patentsdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
JP 05143796	A	11-06-1993	KEINE
WO 0061586	A	19-10-2000	AU 3816600 A 14-11-2000 BR 0009558 A 19-02-2002 CZ 20013605 A3 13-03-2002 WO 0061586 A1 19-10-2000 EP 1171443 A1 16-01-2002 NO 20014824 A 04-10-2001
DE 4031798	A	09-04-1992	DE 4031798 A1 09-04-1992
WO 0187849	A	22-11-2001	AU 5969101 A 26-11-2001 WO 0187849 A2 22-11-2001

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 02 01403

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Die Recherche ergab in ihrer Anfangsphase eine sehr große Zahl neuheitsschädlicher Verbindungen für Anspruch 1. Diese Zahl ist so groß, daß sich unmöglich feststellen lässt, für was in der Gesamtheit der Patentansprüche eventuell nach zu Recht Schutz begehrt werden könnte (Art. 6 PCT). Aus diesen Gründen erscheint eine sinnvolle Recherche über den gesamten Bereich der Patentansprüche unmöglich. Die Recherche wurde daher beschränkt auf:

Die Verbindungen (I) wie in Anspruch 1 definiert, bei denen der gewählte Ausdruck "Biososter" (verwendet in der Definition von R) nur die in diesem Anspruch tatsächlich darin aufgeführten Gruppierungen (d.h. -C(=A)-E sowie die auf Seite 188 angegebenen Strukturformeln) repräsentiert

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß Patentansprüche, oder Teile von Patentansprüchen, auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, daß die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, daß der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäß Kapitel II PCT neue Patentansprüche vorlegt.

フロントページの続き

(51)Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 413/14	C O 7 D 413/14	
C O 7 D 417/14	C O 7 D 417/14	
// C O 7 B 61/00	C O 7 B 61/00	3 0 0

(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,CH,CY,DE,DK,ES,FI,FR,GB,GR,IE,IT,LU,MC,NL,PT,SE,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,NO,NZ,OM,PH,P L,PT,RO,RU,SD,SE,SG,SI,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VN,YU,ZA,ZM,ZW

(72)発明者 フィシャー, リュディガー
 ドイツ 5 0 2 5 9 プルハイム・ツデンフスフエレン 2 3
 (72)発明者 マウラー, フリッツ
 ドイツ 4 0 7 8 9 モンハイム・ブラームシュトラッセ 3 6
 (72)発明者 エルデレン, クリストフ
 ドイツ 4 2 7 9 9 ライヒリンゲン・ウンテルビュシャーホフ 1 5
 (72)発明者 レゼル, ペーター
 ドイツ 5 1 3 7 1 レーフエルクーゼン・ローアシュトラッセ 9 0 アー

F ターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB01 BB07 BB09 CC29 CC42 CC47 CC52 CC62
 CC72 CC75 CC78 CC81 CC82 CC91 DD03 DD10 DD12 DD31
 EE01
 4H011 AC01 BB09 DA16 DD03 DD04
 4H039 CA42 CD20