

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-524310 (P2004-524310A)

【公表日】平成 16 年 8 月 12 日 (2004.8.12)

【年通号数】公開・登録公報 2004-031

【出願番号】特願 2002-567066 (P2002-567066)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 401/04

A 01 N 43/54

C 07 D 401/14

C 07 D 405/14

C 07 D 409/14

C 07 D 413/14

C 07 D 417/14

// C 07 B 61/00

【F I】

C 07 D 401/04

A 01 N 43/54

C

C 07 D 401/14

C 07 D 405/14

C 07 D 409/14

C 07 D 413/14

C 07 D 417/14

C 07 B 61/00

3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 2 月 7 日 (2005.2.7)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

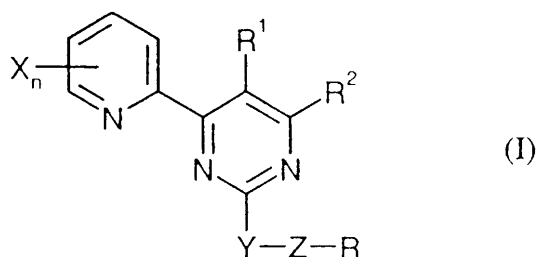
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



[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、 $-S(O)_pR^3$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NHCO_2R^8$ 、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、 $-S(O)_pR^3$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NHCO_2R^8$ 、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、

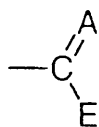
Z は $-(CH_2)_r-$ 、 $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ 、 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ 又は $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ を示し、

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

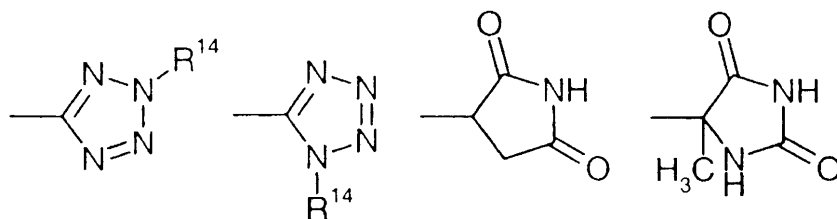
【化 2】



を示すか、

あるいは特に

【化 3】



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 $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 、 $-O^-M$ 、 $-S^-M$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ 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、ハロゲンアルキル、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 - 、ハロゲンアルキル - 、アルコキシ - 、ハロゲンアルコキシ - 、アルキルチオ - 、ハロゲンアルキルチオ - 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、ハロゲンアルキル、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、ハロゲンアルキル、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 - 、ハロゲンアルキル - 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、ハロゲン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、ハロゲンアルキル、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ンアルキルを示し、

R^9 は水素、アルキル、ハロゲンアルキル、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 - 、ハロゲンアルキル - 、アルコキシ - 、ハロゲンアルコキシ - 、アルキルチオ - 、ハロゲンアルキルチオ - 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ンアルキルを示し、

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 - 、ハロゲンアルコキシ - 、アルキルチオ - 、ハロゲンアルキルチオ - 、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 - 、ジオキサニル - 、アリールオキシ - 、ハロゲンアリールオキシ - 、 - CONR⁴R⁵ - 、 - NR⁴R⁵ - 、 - ONR⁴R⁵ - 、 - C(R¹⁴) = N - OR¹⁴ - 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 - 、ハロゲンアルキル - 、アルコキシ - 、ハロゲンアルコキシ - 、アルキルチオ - 、ハロゲンアルキルチオ - 、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 - NR⁴R⁵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 $-S(O)_p R^3$ 、 $-OR^{14}$ 又は $-NR^4 R^5$ を示し、

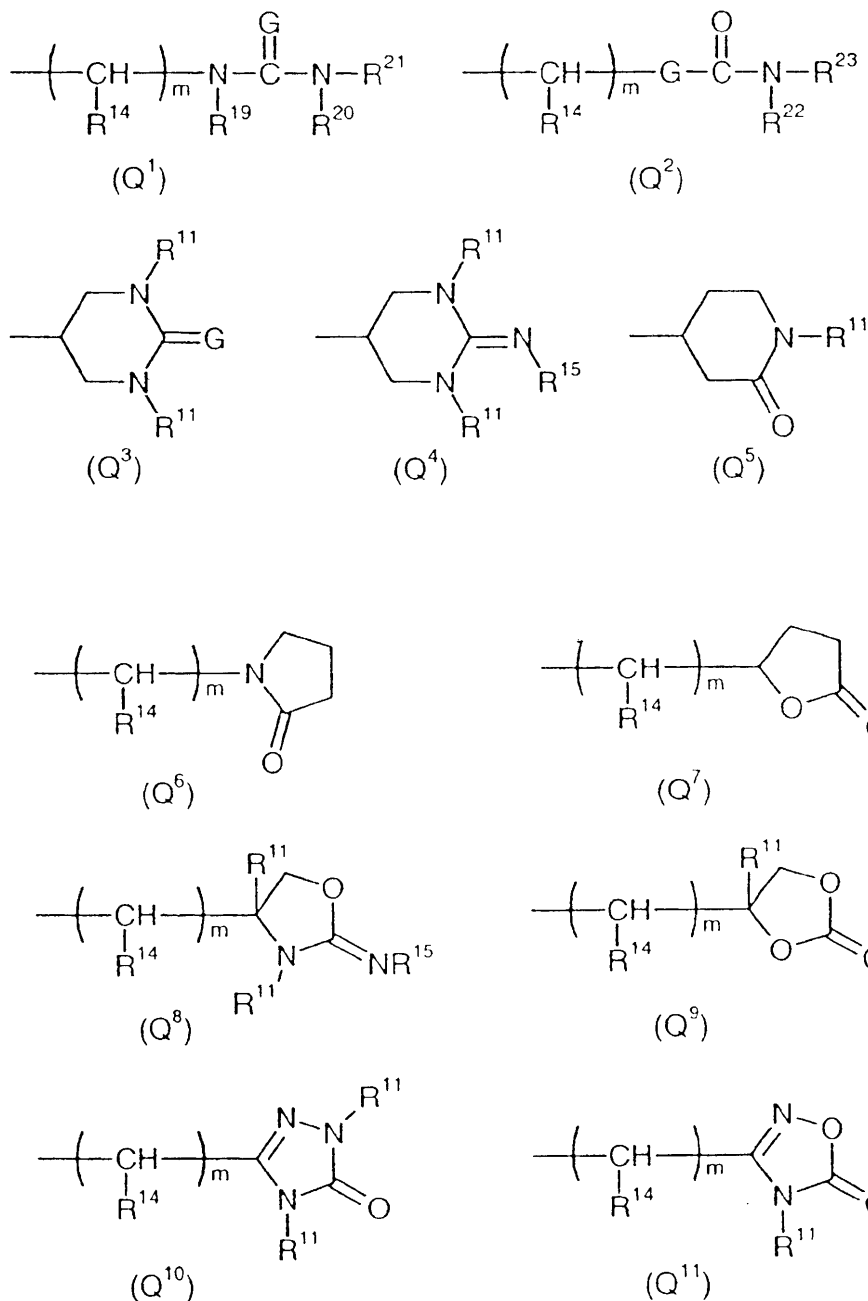
R^{18} はさらにそれぞれハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルコキシカルボニル及びアルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基で置換されているアルキル又はアルケニルを示し、

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、

【化 4】



ここで基 R¹¹ 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 - (CH R¹⁴) - 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、

R¹⁹ 及び R²⁰ 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、

R²¹ 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、

R²² は水素、アルキル又はアルコキシアルキルを示し、

R²³ は水素、アミノ、アルキル又はアルコキシアルキルを示す]

のピリジルピリミジン類。

【請求項 2】

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、 $-S(O)_p$ 、 R^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、

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、

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 $C_3 - C_5$ - 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

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 $-NR^9$ - を示し、

p が 0、1 又は 2 を示し、

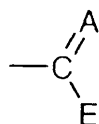
Z が $-(CH_2)_r-$ 、 $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ 、 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ 、 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ 又は $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ を示し、

r が 1、2、3、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

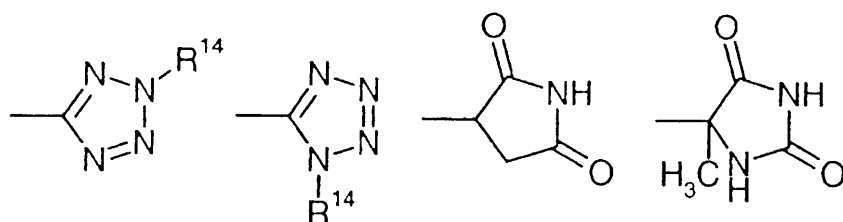
【化 5】



を示すか、

あるいは特に

【化 6】



よりなる群からのカルボン酸バイオイソスター（酸模倣物）を示し、

A が酸素、硫黄又は NR^{15} を示し、

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

M が場合により $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、アリール及びアリール- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルチオ及び $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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-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- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルを示し、

R^4 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルカルボニルを示し、

R^5 が水素、アミノ、ホルミル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルカルボニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル及び $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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-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 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 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルでモノ-もしくはポリ置換されていることができ、

R^6 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキル又はアリール- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルを示し、

R^7 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、アリール又はアリール- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルを示し、

R^8 が $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル又は $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキルを示し、

R^9 が水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -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-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-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-もしくはポリ置換されていることができる $C_1 - C_{10}$ -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-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^{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-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-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 - $S(O)_p R^3$ 、- OR^{14} 又は - $NR^4 R^5$ を示し、

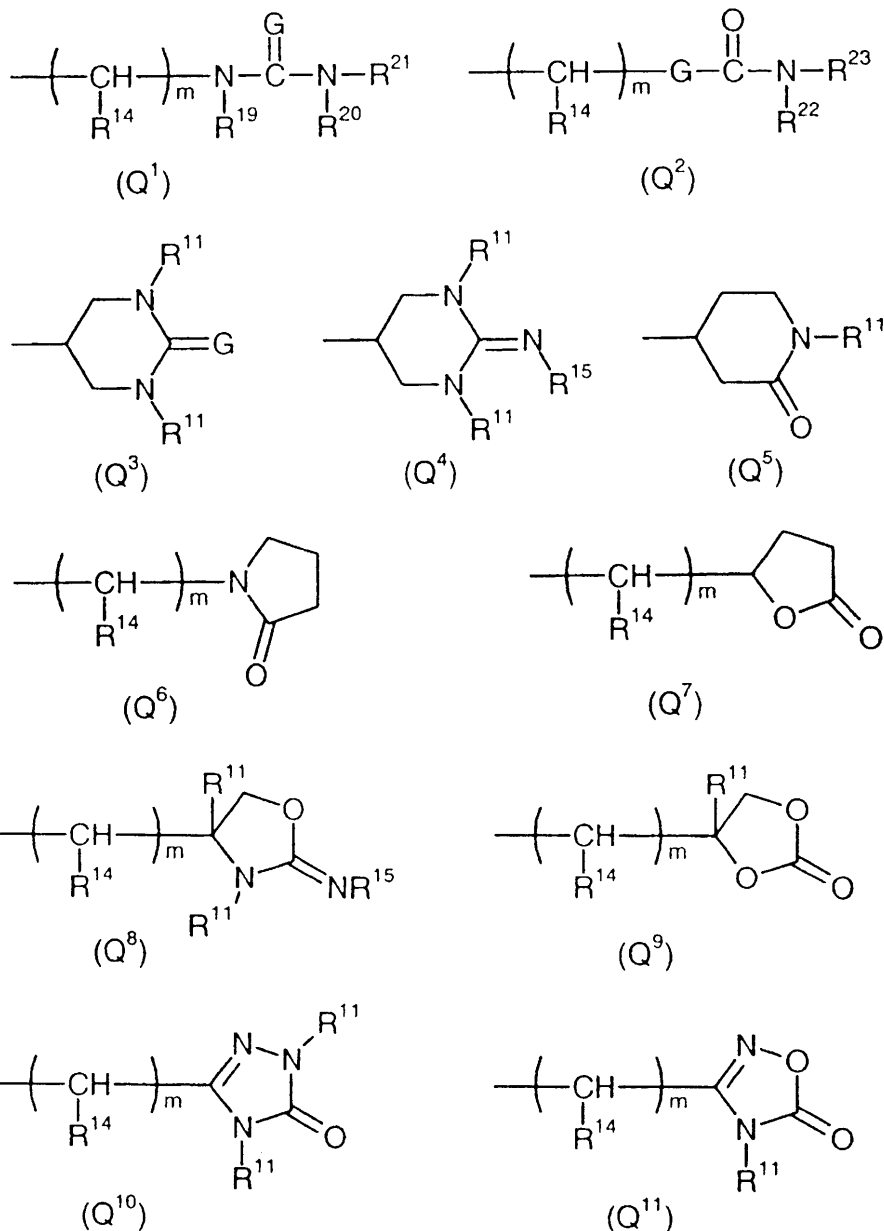
R^{18} がさらにそれぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル及び $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ - もしくはポリ置換されていることができる $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_2 - C_6$ - アルケニルを示し、

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 - 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、

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 - 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】



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、 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 - アルキレンを示し、

R^{21} が水素を示すか、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 - 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} - アルコシカルボニル及び C_3 - 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 - 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、 C_1 - C_6 - アルキル又は C_1 - C_6 - アルコキシ - C_1 - C_6 - アルキルを示し、

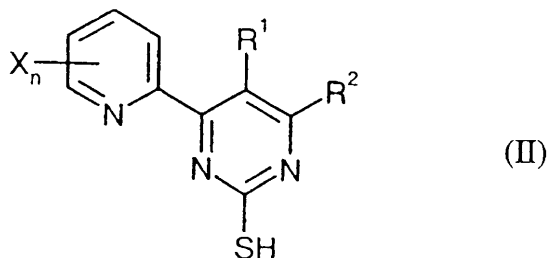
$R^{2,3}$ が水素、アミノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル又は $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキルを示す

請求項 1 に従う式 (I) のピリジルピリミジン類。

【請求項 3】

A) 式 (II)

【化 19】

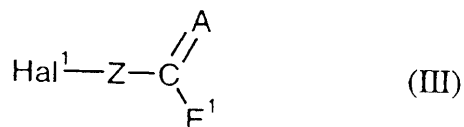


[式中、

R^1 、 R^2 、X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]

のチオールを式 (III)

【化 20】



[式中、

Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、

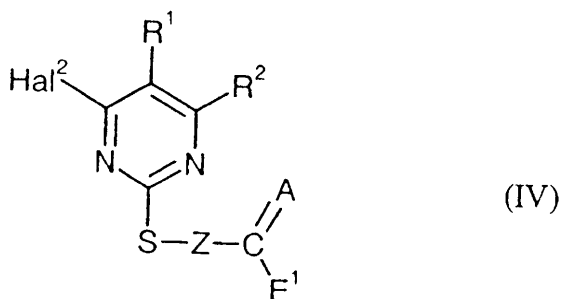
E^1 は $-OR^{16}$ 、 $-SR^{16}$ 又は $-NR^{17}R^{18}$ を示し、

Hal^1 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 (IV)

【化 21】



[式中、

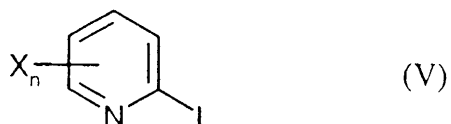
R^1 、 R^2 、Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、

E^1 は上記で示した意味を有し、

Hal^2 はハロゲンを示す]

のハロゲノピリミジンを式 (V)

【化 2 2】



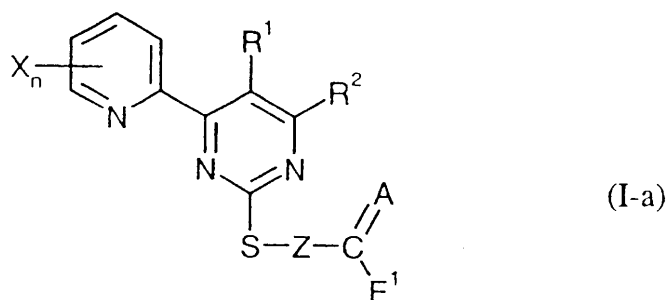
[式中、

X 及び n は請求項 1 で示した意味を有し、

L は S_n (アルキル)₃、 S_n (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)

【化 2 3】



[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、

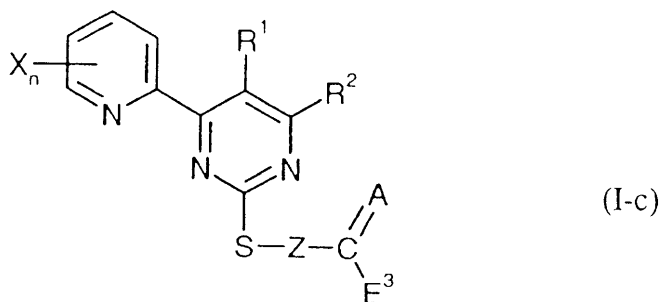
E^1 は上記で示した意味を有する]

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】



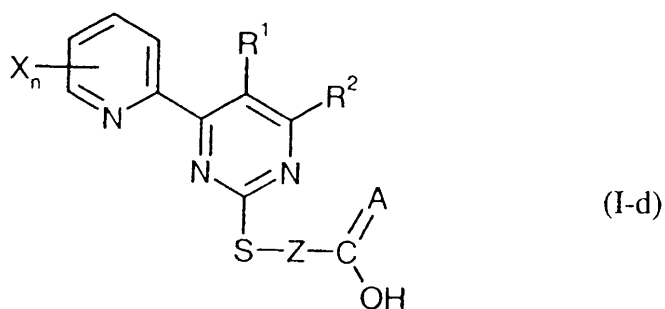
[式中、

R^1 、 R^2 、X、n、Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、

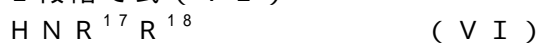
E^3 は $-OR^{16}$ を示し、ここで R^{16} は請求項 1 で示した意味を有する]

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】

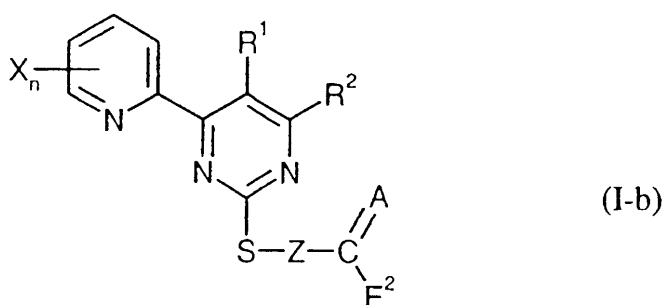


[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有する]
 の化合物を第 2 段階で式 (VI)



[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)

【化 2 6】

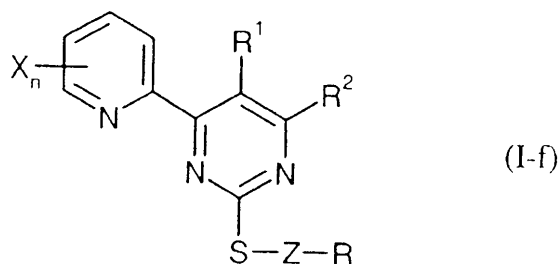


[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、
 E^2 は $-NR^{17}R^{18}$ を示す]

のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは

D) 式 (I - f)

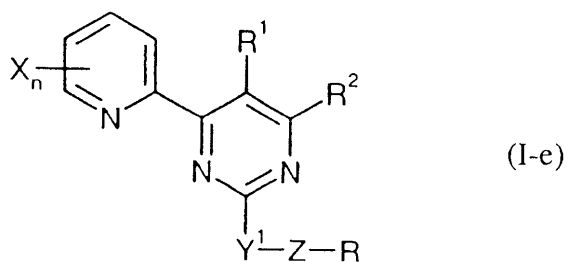
【化 2 7】



[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】



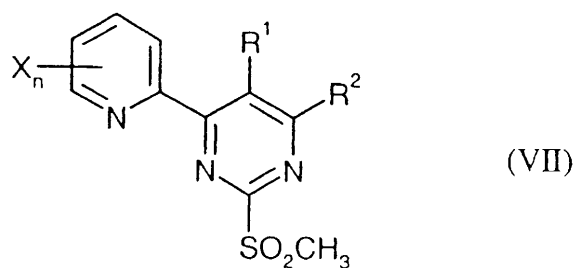
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び R は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^1 は $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示す]

のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

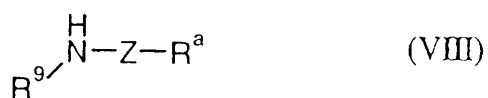
E) 式 (VII)

【化 2 9】



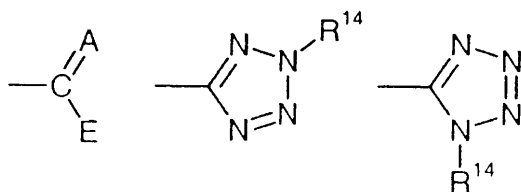
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
 のメチルスルホニルピリミジンを式 (VIII)

【化 3 0】



[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】



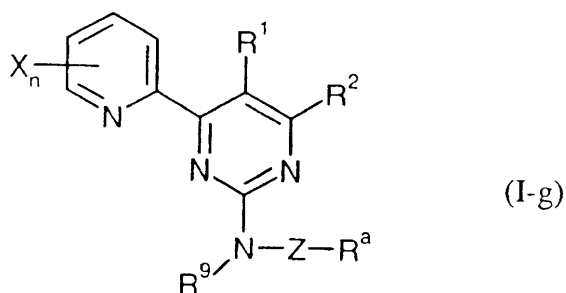
の 1 つを示し、

ここで

R^{14} は請求項 1 で示した意味を有する]

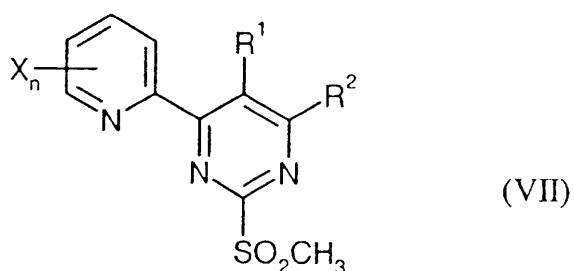
のアミンと、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させることにより、式 (I - g)

【化 3 2】



[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】

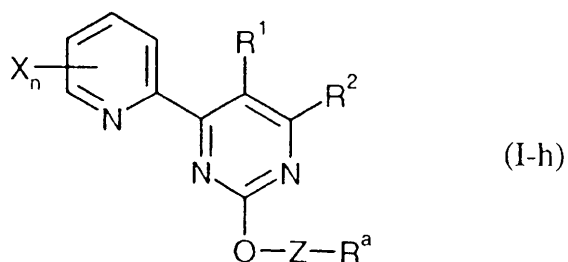


[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
 のメチルスルホニルピリミジンを式 (I X)

$$H O - Z - R^a \quad (I X)$$

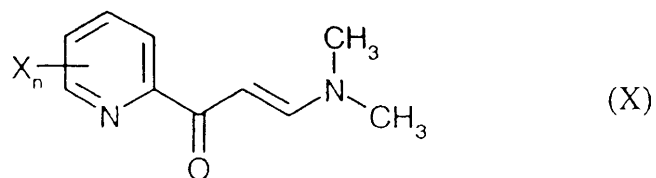
[式中、
 Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 R^a は上記で示した意味を有する]
 のヒドロキシル化合物と、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させることにより、式 (I - h)

【化 3 4】



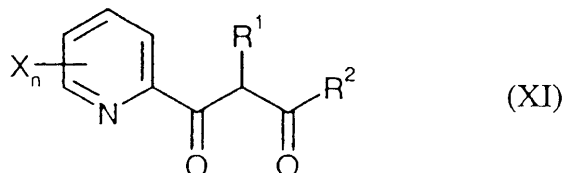
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 R^a は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 G) 式 (X)

【化 3 5】



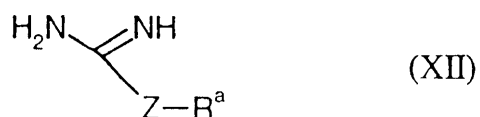
[式中、
X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
のピリジン誘導体又は式 (X I)

【化 3 6】



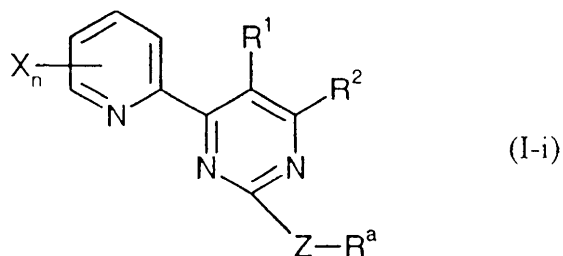
[式中、
R¹、R²、X 及び n は請求項 1 で示した意味を有する]
のピリジン誘導体を式 (X I I)

【化 3 7】



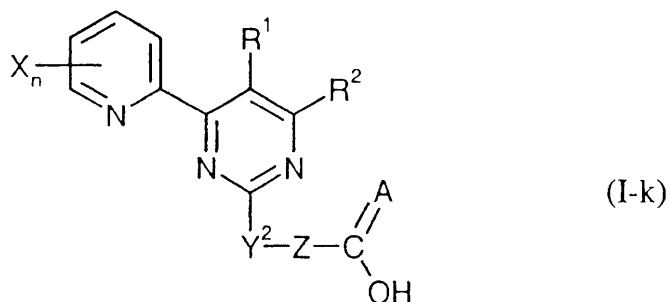
[式中、
Z は請求項 1 で示した意味を有し、
R^a は上記で示した意味を有する]
のアミジンと、適宜希釈剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させることにより、式 (I - i)

【化 3 8】



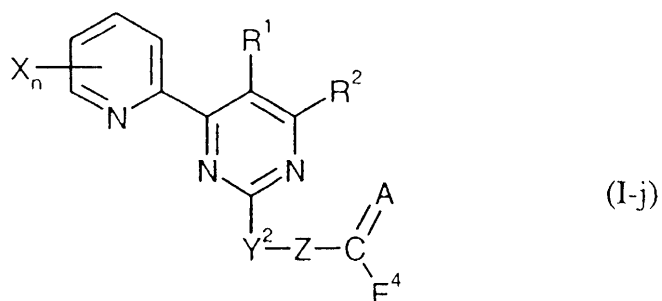
[式中、
R¹、R²、X、n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
R^a は上記で示した意味を有する]
のピリジルピリミジンを得るか、
あるいは
H) 式 (I - k)

【化 3 9】

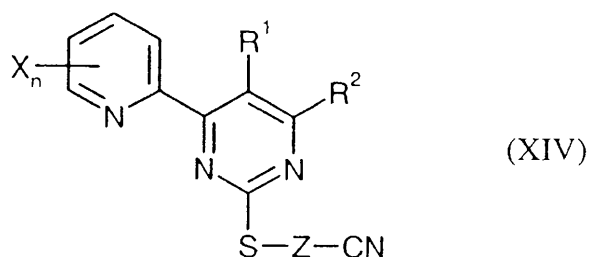


[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^2 は直接結合、酸素、硫黄又は $-NR^9-$ を示す]
 のピリジルピリミジンを式 (XIII) の
 MOH^- (XIII)

[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)
 【化 4 0】

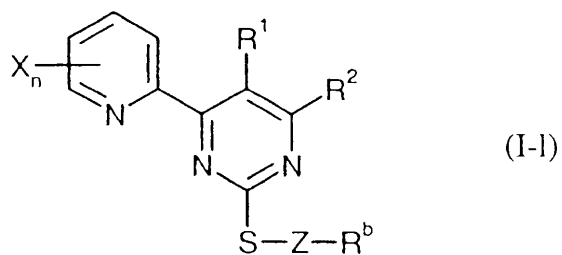


[式中、
 Y^2 は上記で示した意味を有し、
 E^4 は $-O-M$ 又は $-S-M$ を示し、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 、 A 及び M は請求項 1 で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 J) 式 (XIV)
 【化 4 1】



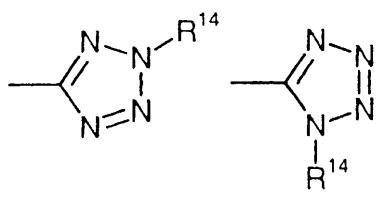
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有する]
 のニトリルを適宜希釈剤の存在下でトリアルキル錫アジドと反応させることにより、式 (I-1)

【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

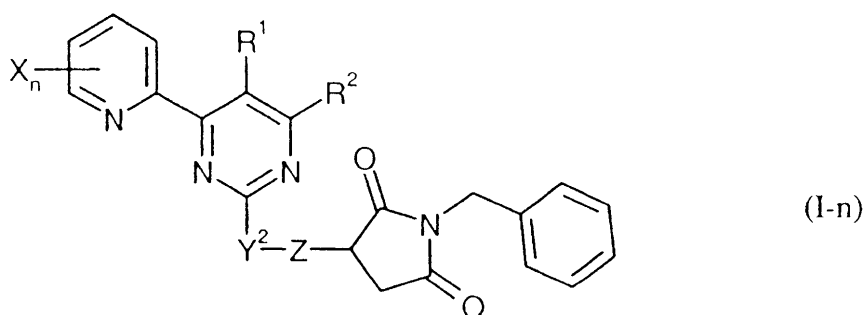
【化 4 3】



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]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは

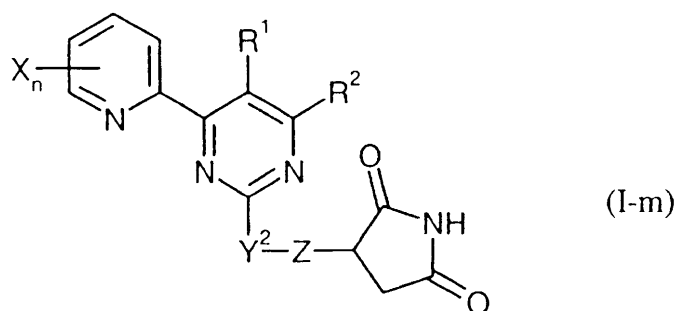
K) 式 (I - n)

【化 4 4】



[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)

【化 4 5】



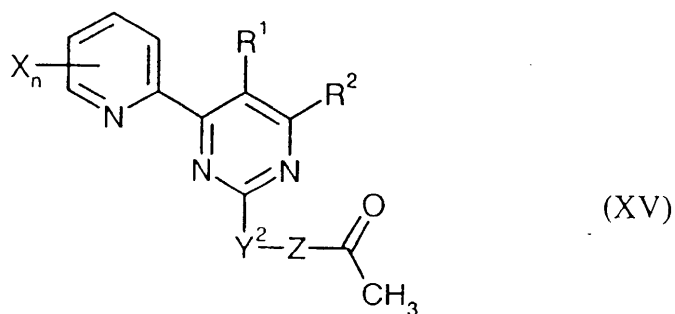
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は請求項 1 で示した意味を有し、
 Y^2 は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

L) 式 (XV)

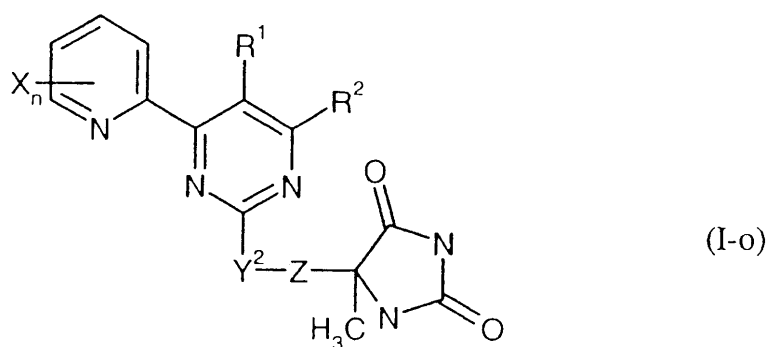
【化 4 6】



[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ことにより、式 (I - o)

【化 4 7】



[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 4】

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。

【請求項５】

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６】

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７】

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。