

【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 07D 401/04

A 01N 43/54

C 07D 401/14

C 07D 405/14

C 07D 409/14

C 07D 413/14

C 07D 417/14

// C 07B 61/00

【F I】

C 07D 401/04

A 01N 43/54

C

C 07D 401/14

C 07D 405/14

C 07D 409/14

C 07D 413/14

C 07D 417/14

C 07B 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

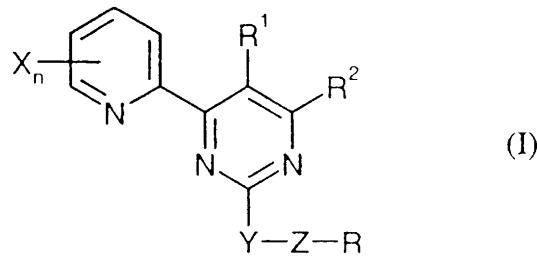
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



【式中、

R¹及びR²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、 $-S(O)_pR^3$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NHC(O_2)R^8$ 、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、 $-S(O)_pR^3$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-COR^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CSR^6$ 、 $-CONR^4R^5$ 、 $-NHC(O_2)R^8$ 、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、

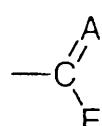
Zは $-(CH_2)_r$ 、 $-(CH_2)_t$ 、 $-(CHR^{10})$ 、 $-(CH_2)_w$ 、 $-(CH_2)_r-C(O)-$ 、 $-(CH_2)_t-O-$ 、 $-(CH_2)_t-C(H_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t$ 、 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t$ 又は $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w$ を示し、

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

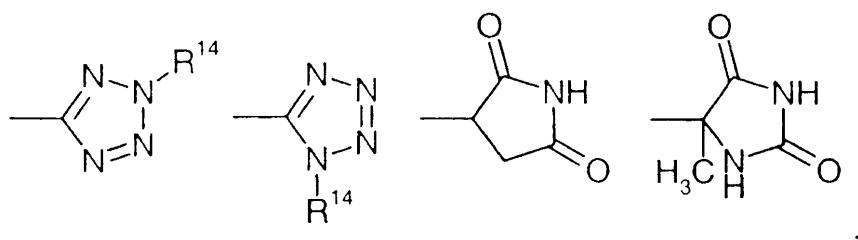
【化2】



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、

R³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、

R⁴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、

R⁵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、

R⁴及びR⁵はさらに一緒に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；

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にな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、

R⁶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、

R⁷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、

R⁸はアルキル又はハロゲノアルキルを示し、

R⁹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、

R¹⁰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できることができる、

R¹¹は水素又はアルキルを示し、

R¹²及びR¹³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、

R¹⁴は水素、アルキル又はハロゲノアルキルを示し、

R¹⁵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、

R¹⁶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-、ジオキサン二ル-、オキサゾリジニル-、ジオキソラニル-、アリールオキシ-、ハロゲノアリールオキシ-、-CONR⁴R⁵-、-NR⁴R⁵-、-ONR⁴R⁵-、-C(R¹⁴)=N-O-R¹⁴-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-置換できることができる

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、

R¹⁶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にヒドロキシリ及びニトロよりなる群から選ばれることができ、

R¹⁷は水素又はアルキルを示し、

R¹⁸は水素、ヒドロキシリ、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 - 、ヒドロキシリ - 、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 R³、- OR¹⁴ 又は - NR⁴ R⁵ を示し、

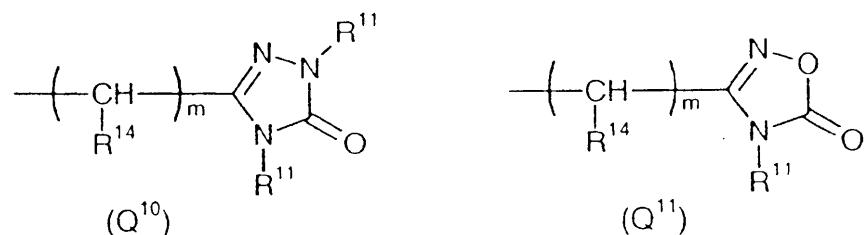
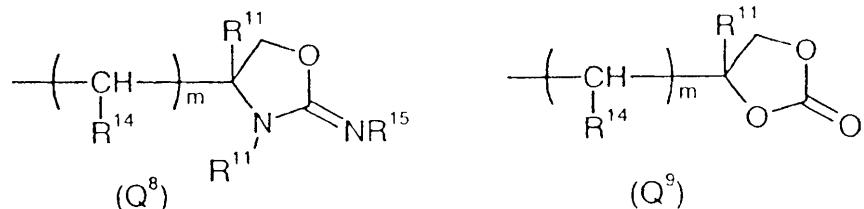
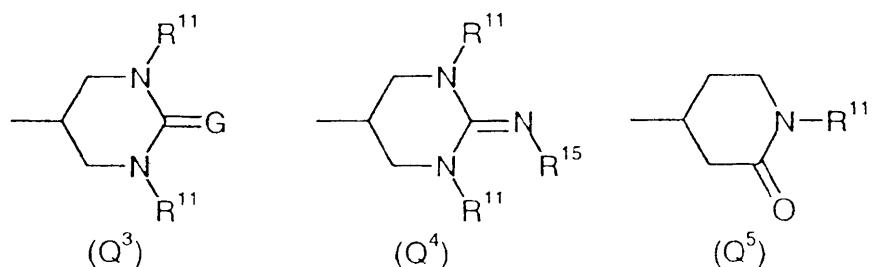
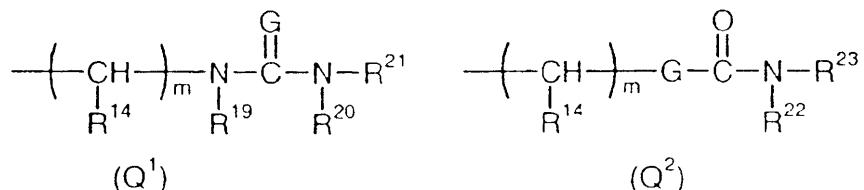
R¹⁸はさらにそれぞれハロゲン、アミノ、ヒドロキシリ、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、アルキルチオ、ハロゲノアルキルチオ、アルコキシカルボニル及びアルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基で置換されているアルキル又はアルケニルを示し、

R¹⁸はさらにそれぞれ場合により置換されているシクロアルキル、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、

R¹⁷及びR¹⁸はさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にになって 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 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ます。

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 - (C H R ¹⁻⁴) - 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、あるいは一緒にアルケンを示す。

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 - 、ハロゲノアルキル - 、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アルキルを示し、R²³は水素、アミノ、アルキル又はアルコキアルキルを示す]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、 $-S(O)_p$ 、 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 - 頁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 - 頁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、

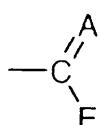
Z が $-(CH_2)_r -$ 、 $-(CH_2)_t -$ 、 $(CHR^{10}) -$ 、 $-(CH_2)_w -$ 、 $-(CH_2)_r - C(O) -$ 、 $-(CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - O -$ 、 $-(CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - S(O)_p -$ 、 $-(CH_2)_t -$ 、 $-(CH_2)_r - N(R^{11}) -$ 、 $-(CH_2)_t -$ 又は $-(CH_2)_t - C(R^{12}) = C(R^{13}) -$ 、 $-(CH_2)_w -$ を示し、

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

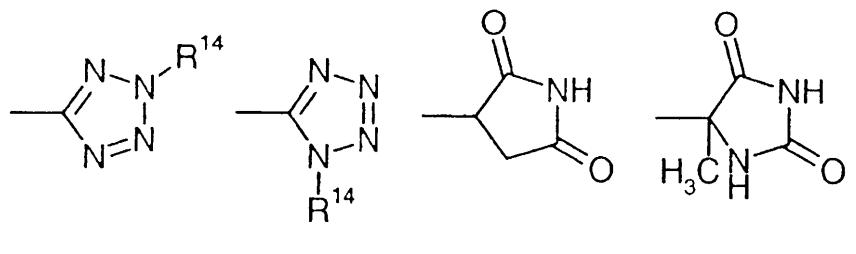
【化 5】



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-O R¹⁶、-SR¹⁶、-O⁻M、-SM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；あるいはそれの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、

R⁴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、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルを示し、

R⁵が水素、アミノ、ホルミル、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロゲノアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ-C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、オキサモイルを示し、

R⁴及びR⁵がさらに一緒になってC₁ - C₆ - 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、C₁ - C₆ - アルキル及びC₁ - C₆ - 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；

R⁴及びR⁵がさらにはそれらが結合している窒素原子と一緒にになって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C₁ - C₆ - 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、

R⁶が水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロゲノアルキル又はアリール-C₁ - C₆ - アルキルを示し、

R⁷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、アリール又はアリール-C₁ - C₆ - アルキルを示し、

R⁸がC₁ - C₆ - アルキル又はC₁ - C₆ - ハロゲノアルキルを示し、

R⁹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；あるいはそれの場合

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-もしくはポリ置換できることができる、

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、ヒドロキシリル、 $C_1 - C_6$ -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、ヒドロキシリル、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、ジオキサン二ル、オキサゾリジニル、ジオキソラニル、アリールオキシ、ハロゲノアリールオキシ、-CONR⁴R⁵、-N(R⁴)₂、-ONR⁴R⁵及び-C(R¹⁴)=N-O-R¹⁴よりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ-もしくはポリ置換できることができる $C_1 - C_6$ -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-もしくはポリ置換でき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-N(R⁴)₂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-もしくはポリ置換できることができる、ここで置換基は上記で挙げたもの他にヒドロキシリ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、ヒドロキシリル、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、ヒドロキシリル、 $C_1 - C_6$ -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-もしくはポリ置換できることができる $C_3 - C_7$ -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 - 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 - アルキルを示すか；あるいは - S (O) _p R³、 - O R¹⁴ 又は - N R⁴ R⁵ を示し、

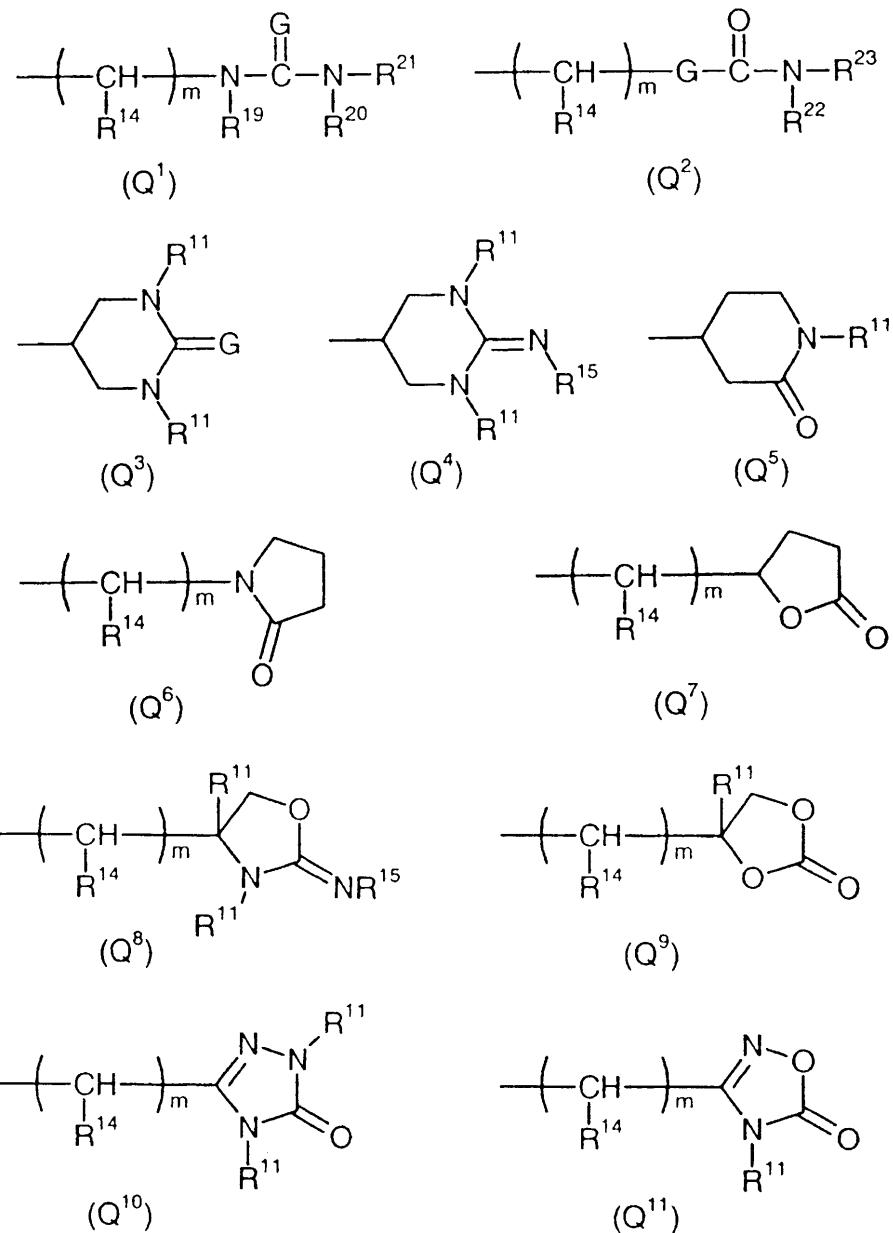
R¹⁸ がさらにそれぞれ場合によりハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - ハロゲノアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル及び C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ - もしくはポリ置換されていることができる C₁ - C₆ - アルキル又は C₂ - C₆ - アルケニルを示し、

R¹⁸ 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 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に他にニトロ及び 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、

R¹⁷ 及び R¹⁸ がさらにそれらが結合している窒素原子と一緒にになって 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 C₁ - C₆ - 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 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 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 - (C H R¹⁴) - 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、

R¹⁹ 及び R²⁰ が互いに独立して水素、C₁ - C₆ - アルキルを示すか、あるいは一緒になって C₂ - C₄ - アルキレンを示し、

R²¹ が水素を示すか、場合により C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ及び C₁ - C₆ - 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 C₁ - C₆ - アルキルを示すか；あるいは場合によりハロゲン、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₁₀ - 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 - 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、

R²² が水素、C₁ - C₆ - アルキル又は C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキルを示し、

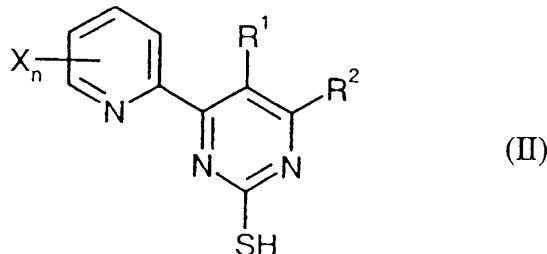
$R^{2,3}$ が水素、アミノ、C₁ - C₆ - アルキル又はC₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキルを示す

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】

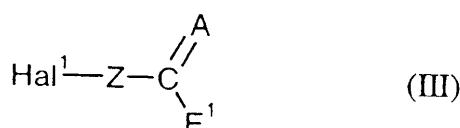


[式中、

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、

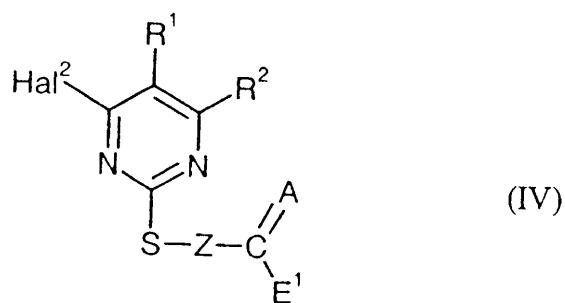
E^1 は - OR¹⁶、- SR¹⁶ 又は - N R¹⁷ R¹⁸ を示し、

Hal¹ はハロゲンを示す]

のハロゲン化合物と、適宜希釀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、

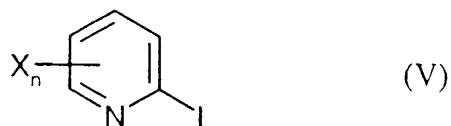
R^1 、 R^2 、 Z 及び A は請求項 1 で示した意味を有し、

E^1 は上記で示した意味を有し、

Hal² はハロゲンを示す]

のハロゲノピリミジンを式(V)

【化22】



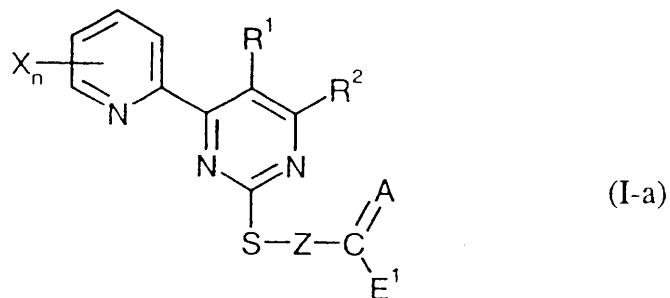
[式中、

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)

【化23】



[式中、

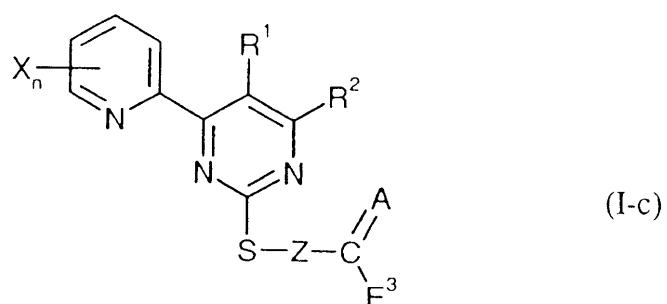
R¹、R²、X、n、Z及びAは請求項1で示した意味を有し、E¹は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

C)式(I-c)

【化24】

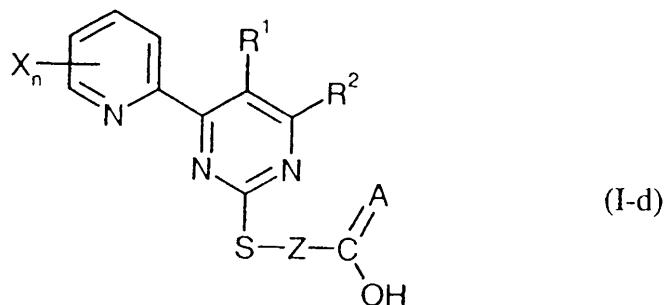


[式中、

R¹、R²、X、n、Z及びAは請求項1で示した意味を有し、E³は-O-R¹⁶を示し、ここでR¹⁶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)

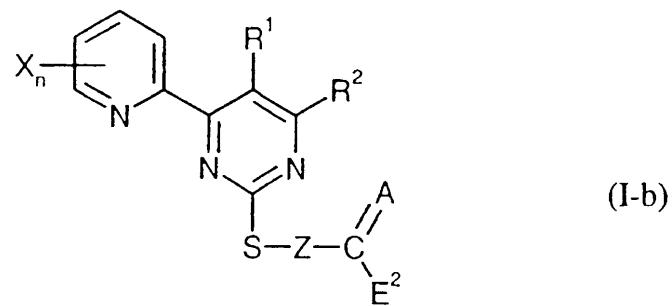
【化25】



[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)
 $HNR^{17}R^{18}$ (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、適宜希釀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26】

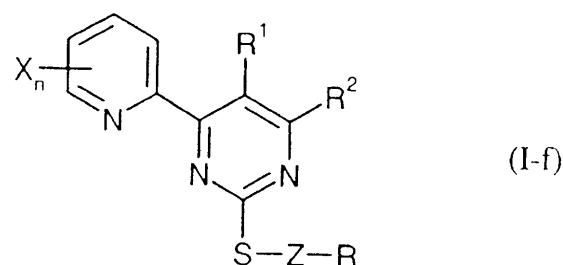


[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び A は請求項1で示した意味を有し、
 E^2 は $-N(R^{17})R^{18}$ を示す]
のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

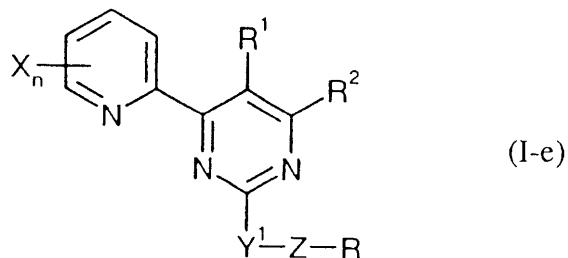
D) 式(I-f)

【化27】



[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、適宜希釀剤の存在下、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28】



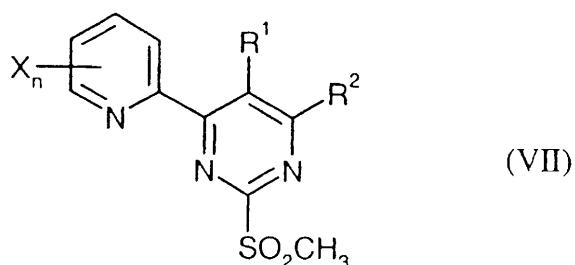
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び R は請求項1で示した意味を有し、
 Y^1 は $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示す]

のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

E)式(VIII)

【化29】



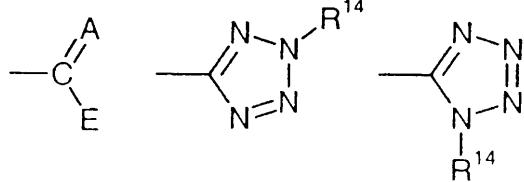
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 及び n は請求項1で示した意味を有する]
のメチルスルホニルピリミジンを式(VIII)

【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31】

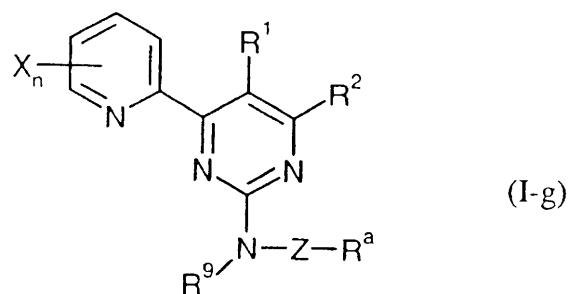


の1つを示し、
ここで

R^{14} は請求項1で示した意味を有する]

のアミンと、適宜希釀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32】



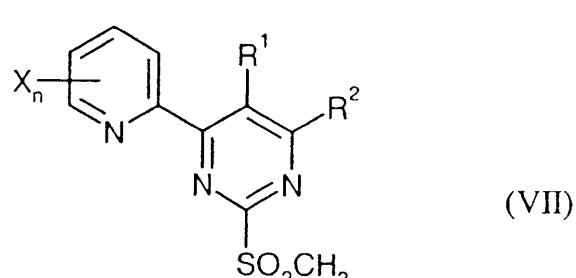
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 及び R^9 は請求項1で示した意味を有し、
 R^a は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

F)式(VII)

【化33】



[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)

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

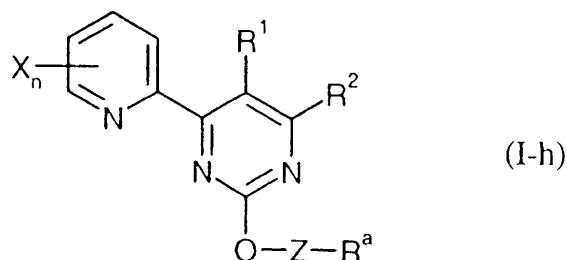
[式中、

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34】



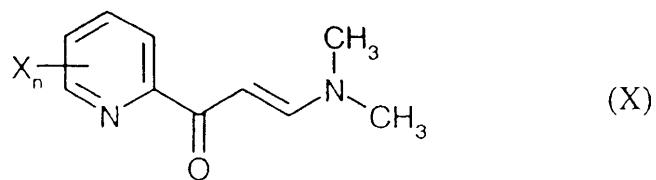
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は請求項1で示した意味を有し、
 R^a は上記で示した意味を有する]

のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

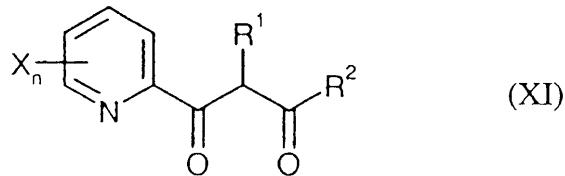
G)式(X)

【化35】



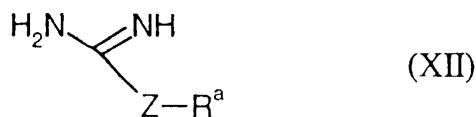
[式中、
X及びnは請求項1で示した意味を有する]
のピリジン誘導体又は式(XI)]

【化36】



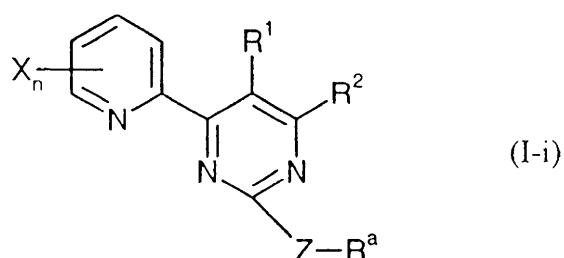
[式中、
R¹、R²、X及びnは請求項1で示した意味を有する]
のピリジン誘導体を式(XII)]

【化37】



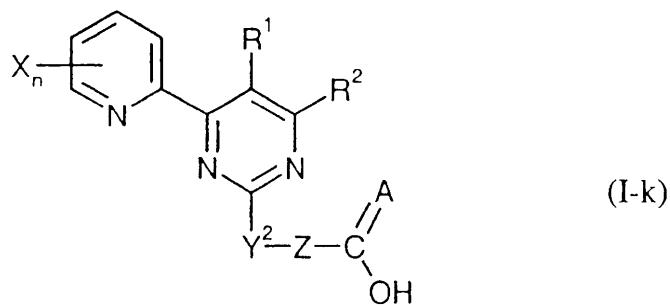
[式中、
Zは請求項1で示した意味を有し、
R^aは上記で示した意味を有する]
のアミジンと、適宜希釀剤の存在下及び適宜塩基の存在下で反応させることにより、式(I-i)]

【化38】

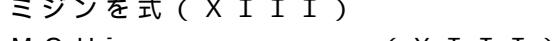


[式中、
R¹、R²、X、n及びZは請求項1で示した意味を有し、
R^aは上記で示した意味を有する]
のピリジルピリミジンを得るか、
あるいは
H)式(I-k)]

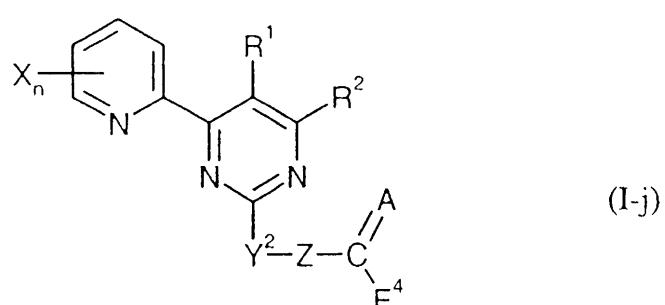
【化39】



[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 $-\text{NR}^9-$ を示す]
のピリジルピリミジンを式(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、適宜希釀剤の存在下で反応させることにより、式(I-j)
【化40】

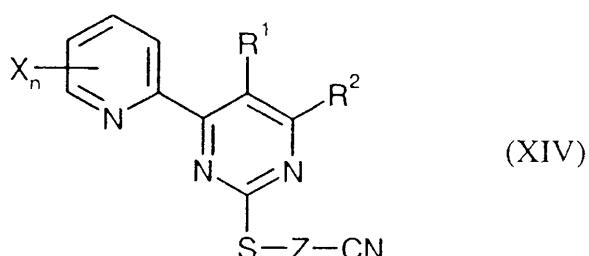


[式中、
 Y^2 は上記で示した意味を有し、
 E^4 は $-\text{O}-\text{M}$ 又は $-\text{S}-\text{M}$ を示し、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Z 、 A 及び M は請求項1で示した意味を有する]
のピリジルピリミジンを得るか、

あるいは

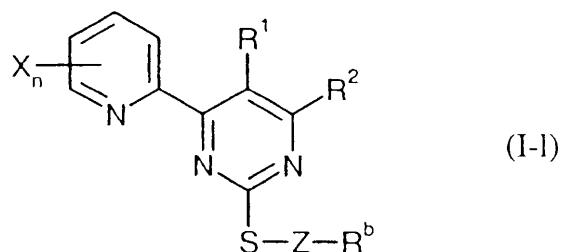
J) 式(XIV)

【化41】



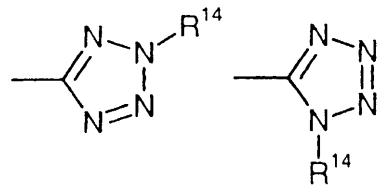
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は請求項1で示した意味を有する]
のニトリルを適宜希釀剤の存在下でトリアルキル錫アジドと反応させることにより、式(I-1)

【化42】



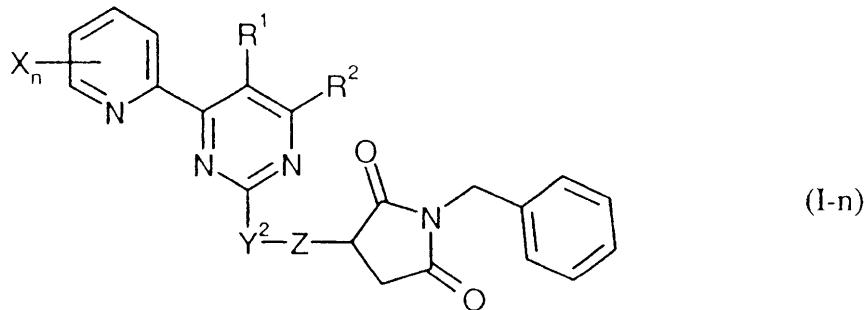
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 、 Y 及び Z は請求項1で示した意味を有し、
 R^{14} は下記の基

【化43】



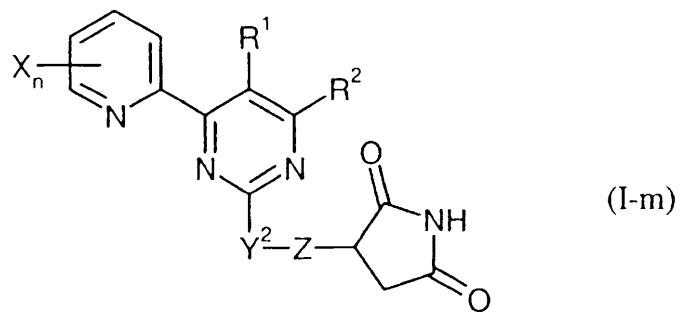
の1つを示し、
 ここで R^{14} は請求項1で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを得るか、
 あるいは
 K)式(I-n)

【化44】



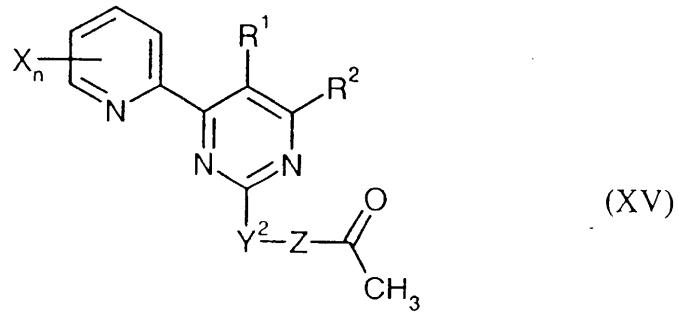
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は請求項1で示した意味を有し、
 Y^2 は上記で示した意味を有する]
 のピリジルピリミジンを適宜希釀剤の存在下及び適宜触媒の存在下で水素化することにより、式(I-m)

【化45】



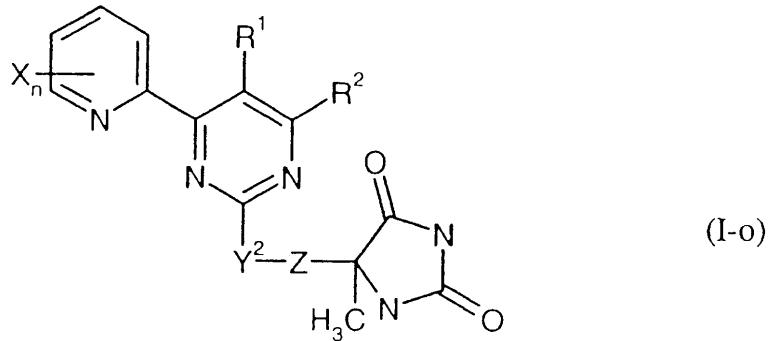
[式中、
 R^1 、 R^2 、 X 、 n 及び Z は請求項1で示した意味を有し、
 Y^2 は上記で示した意味を有する]
のピリジルピリミジンを得るか、
あるいは
L)式(XV)

【化46】



[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釀剤の存在下で炭酸アンモニウム及びシアノ化カリウムと反応させることにより、式(I-o)

【化47】



[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。