

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4624510号  
(P4624510)

(45) 発行日 平成23年2月2日(2011.2.2)

(24) 登録日 平成22年11月12日(2010.11.12)

(51) Int. Cl.		F I	
<b>CO7D 513/04</b>	<b>(2006.01)</b>	CO7D 513/04	343
<b>AO1N 43/90</b>	<b>(2006.01)</b>	AO1N 43/90	103
<b>AO1P 5/00</b>	<b>(2006.01)</b>	AO1P 5/00	
<b>AO1P 7/00</b>	<b>(2006.01)</b>	AO1P 7/00	

請求項の数 6 (全 23 頁)

(21) 出願番号	特願平11-316802	(73) 特許権者	591000791
(22) 出願日	平成11年11月8日(1999.11.8)		ワイス・ホールディングズ・コーポレイ ション
(65) 公開番号	特開2000-143668(P2000-143668A)		アメリカ合衆国ニュージャージー州079 40-0874マディソン・ファイブジラ ルダファームス(番地なし)
(43) 公開日	平成12年5月26日(2000.5.26)	(74) 代理人	100091096
審査請求日	平成18年11月1日(2006.11.1)		弁理士 平木 祐輔
(31) 優先権主張番号	09/192648	(74) 代理人	100118773
(32) 優先日	平成10年11月16日(1998.11.16)		弁理士 藤田 節
(33) 優先権主張国	米国(US)	(74) 代理人	100096183
			弁理士 石井 貞次

最終頁に続く

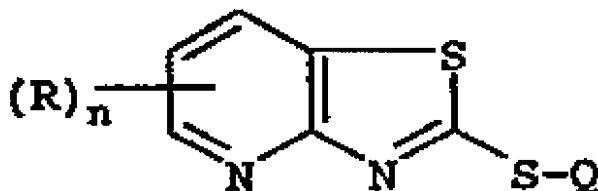
(54) 【発明の名称】 2-(置換チオ)チアゾロー[4,5-b]ピリジン化合物の有害生物防除および寄生虫防除的使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

蠕虫類、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物もしくは寄生虫の防除方法であって、  
構造式 I

【化1】



(I)

[式中、

Rは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $C_1 - C_4$  ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  アルコキシ、 $C_1 - C_4$  ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  アルキルチオ、 $C_1 - C_4$  ハロアルキルチオもしくは $CO_2R_1$  であり；

nは、0, 1, 2もしくは3であり；

Qは、 $C_3 - C_6$  アルケニル、 $C_3 - C_6$  ハロアルケニル、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_7$  シクロアルケニル、 $C_4 - C_7$  ハロシクロ

アルケニル、

場合によっては、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  ハロシクロアルキルもしくは  $CO_2 R_2$  基 1 個によって置換されている  $C_1 - C_6$  アルキル、

場合によっては、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  ハロシクロアルキルもしくは  $CO_2 R_2$  基 1 個によって置換されている  $C_1 - C_6$  ハロアルキルであり；そして

$R_1$  および  $R_2$  は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $CH_2$  ( $C_1 - C_6$  ハロアルキル)、 $C_3 - C_{10}$  アルケニル、 $C_3 - C_{10}$  ハロアルケニル、カチオン、

環においてハロゲン原子 1 ~ 5 個、シアノ基 1 もしくは 2 個、ニトロ基 1 もしくは 2 個、 $C_1 - C_4$  アルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$  ハロアルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$  アルコキシ基 1 ~ 3 個または  $C_1 - C_4$  ハロアルコキシ基 1 ~ 3 個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているベンジル、あるいは

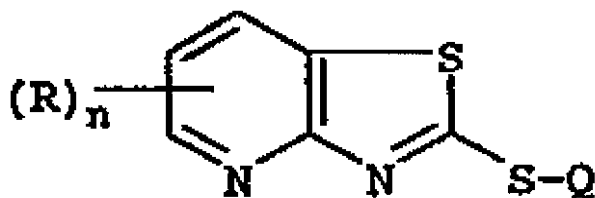
ハロゲン原子 1 ~ 5 個、シアノ基 1 もしくは 2 個、ニトロ基 1 もしくは 2 個、 $C_1 - C_4$  アルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$  ハロアルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$  アルコキシ基 1 ~ 3 個または  $C_1 - C_4$  ハロアルコキシ基 1 ~ 3 個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているフェニルである]

をもつ化合物、ならびにそれらの農学的および/または薬物学的に許容しうる塩の、有害生物防除剤もしくは寄生虫防除剤としての有効量を、該有害生物もしくは寄生虫、またはそれらの食餌供給、生息もしくは繁殖地に接触させることを含むが、但し、該方法はヒトに適用されないという条件である、前記方法。

【請求項 2】

構造式 I

【化 2】



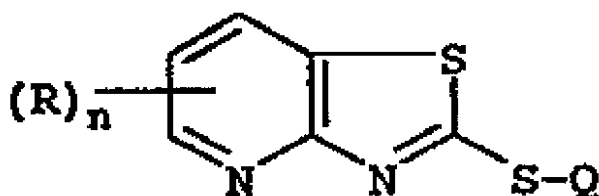
(I)

[ 式中、 $n$ 、 $R$  および  $Q$  は、第 1 項に記述されたとおりである ] をもつ化合物の有害生物防除剤としての有効量を、植物の葉か、またはそれらが生育している土壌もしくは水に適用することを含む、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物による侵襲もしくは寄生からの生育植物の保護方法。

【請求項 3】

構造式 I

【化 3】



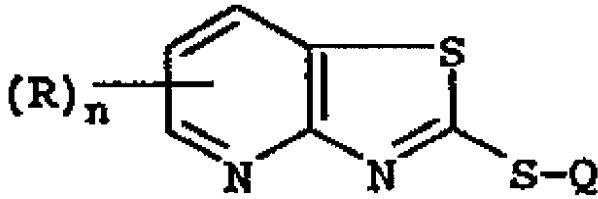
(I)

[ 式中、 $n$ 、 $R$  および  $Q$  は、第 1 項に記述されたとおりである ] をもつ化合物の駆虫剤、殺ダニ剤もしくは内・外寄生虫防除剤としての有効量を、経口的、局所的もしくは非経口的に、ヒトを含まない温血動物もしくは魚類に投与もしくは適用することを含む、蠕虫類、ダニ類もしくは節足動物内・外寄生虫による寄生もしくは感染に対して、該動物もしくは魚類を治療、防除、予防もしくは保護する方法。

## 【請求項4】

農業的もしくは薬物学的に許容しうるキャリアーおよび構造式 I

## 【化4】



(I)

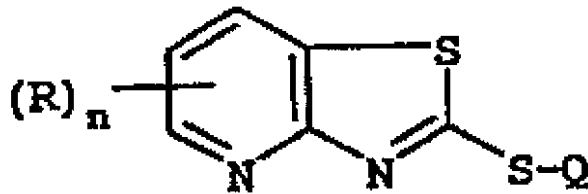
10

[ 式中、 $n$ 、 $R$ および $Q$ は、第1項に記述されたとおりである ] をもつ化合物の有害生物防除剤もしくは寄生虫防除剤としての有効量を含有する、蠕虫類、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物もしくは寄生虫防除のための組成物。

## 【請求項5】

構造式 I a

## 【化5】



(Ia)

20

[ 式中、

$R$ は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $C_1 - C_4$  ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  アルコキシ、 $C_1 - C_4$  ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  アルキルチオ、 $C_1 - C_4$  ハロアルキルチオもしくは  $CO_2 R_1$  であり；

30

$n$ は、0、1、2もしくは3であり；

$Q$ は、 $C_3 - C_6$  ハロアルケニル、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_7$  シクロアルケニル、 $C_4 - C_7$  ハロシクロアルケニル、

$C_3 - C_7$  シクロアルキルもしくは  $C_3 - C_7$  ハロシクロアルキル基1個によって置換されている  $C_1 - C_6$  アルキル、または

場合によっては、 $C_3 - C_7$  シクロアルキルもしくは  $C_3 - C_7$  ハロシクロアルキル基1個によって置換されている  $C_1 - C_6$  ハロアルキルであるが、

但し、 $Q$ が  $CF_2H$  以外であるという条件がある；そして

$R_1$ は、水素、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $CH_2(C_1 - C_6)$  ハロアルキル、 $C_3 - C_10$  アルケニル、 $C_3 - C_10$  ハロアルケニル、カチオン、

40

環においてハロゲン原子1~5個、シアノ基1もしくは2個、ニトロ基1もしくは2個、 $C_1 - C_4$  アルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$  ハロアルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$  アルコキシ基1~3個または  $C_1 - C_4$  ハロアルコキシ基1~3個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているベンジル、あるいは

ハロゲン原子1~5個、シアノ基1もしくは2個、ニトロ基1もしくは2個、 $C_1 - C_4$  アルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$  ハロアルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$  アルコキシ基1~3個または  $C_1 - C_4$  ハロアルコキシ基1~3個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているフェニルである ]

をもつ化合物、ならびにそれらの農学のおよび/または薬物学的に許容しうる塩。

## 【請求項6】

50

2 - [ (ジフルオロメチル)チオ]チアゾロ[4,5-b]ピリジン。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

【0002】

【従来の技術】

線虫類、昆虫類およびダニ類有害生物は、生育期および収穫期の作物を破滅させる。米国において、農作物は、何千ものこれらの有害生物と戦わねばならない。その上、節足動物および蠕虫類寄生虫は、世界規模において、毎年、家畜や伴侶動物分野に対して数億ドルの経済的損失を惹起している。また、節足動物寄生虫は、ヒトにとって煩わしいものであり、そしてヒトや動物において病原体を媒介することもできる。

10

【0003】

今日、市販の有害生物防除剤 (pesticide)、外部寄生虫防除剤 (ecto-parasiticide)、エンデクトシド (endectocide) および駆虫剤 (anthelmintic) を入手できるにもかかわらず、作物、家畜、伴侶動物およびヒトへの損害が発生する。したがって、新規な、より有効な有害生物防除剤、外部寄生虫防除剤、エンデクトシドおよび駆虫剤を創り出すべく研究が進行中である。

【0004】

抗潰瘍剤として有用である、ある種のアゾール誘導体が、欧州特許出願公開第405976号に記述されている。しかしながら、その特許は、そこに記述されているアゾール誘導体に関する有害生物防除もしくは寄生虫防除的利用を何も記述していないし、また示唆していない。

20

【0005】

それ故、本発明の目的は、蠕虫類、線虫類、昆虫類およびダニ類有害生物および寄生虫の防除方法を提供することである。

【0006】

また、本発明の目的は、線虫類、昆虫類およびダニ類の侵襲および寄生によって惹起される損傷からの、生育期および収穫期の作物の保護方法を提供することである。

【0007】

さらなる本発明の目的は、蠕虫類、ダニ類および節足動物内・外寄生虫による寄生および感染に対して、温血動物、魚類およびヒトを治療、防除、予防および保護する方法を提供することである。

30

【0008】

本発明のこれらおよび他の目的は、以下に示されるその記述から一層明らかになるであろう。

【0009】

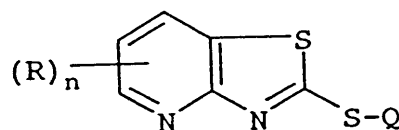
【発明が解決しようとする課題】

本発明は、蠕虫類、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物もしくは寄生虫の防除方法であって、構造式 I

【0010】

40

【化6】



(I)

[式中、

Rは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

50

アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオもしくは $CO_2R_1$ であり；

$n$ は、0, 1, 2もしくは3であり；

$Q$ は、 $C_3 - C_6$ アルケニル、 $C_3 - C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_7$ シクロアルケニル、 $C_4 - C_7$ ハロシクロアルケニル、場合によっては、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキルもしくは $CO_2R_2$ 基1個によって置換されている $C_1 - C_6$ アルキル、

場合によっては、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキルもしくは $CO_2R_2$ 基1個によって置換されている $C_1 - C_6$ ハロアルキルであり；そして

$R_1$ および $R_2$ は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $CH_2$ ( $C_1 - C_6$ ハロアルキル)、 $C_3 - C_{10}$ アルケニル、 $C_3 - C_{10}$ ハロアルケニル、カチオン、環においてハロゲン原子1~5個、シアノ基1もしくは2個、ニトロ基1もしくは2個、 $C_1 - C_4$ アルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基1~3個または $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ基1~3個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているベンジル、あるいは

ハロゲン原子1~5個、シアノ基1もしくは2個、ニトロ基1もしくは2個、 $C_1 - C_4$ アルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル基1~3個、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基1~3個または $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ基1~3個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているフェニルである]

をもつ2-(置換チオ)チアゾロ[4, 5-b]ピリジン化合物、ならびにそれらの農学的および/または薬物学的に許容しうる塩の、有害生物防除剤もしくは寄生虫防除剤としての有効量を、該有害生物もしくは寄生虫、またはそれらの食餌供給、生息もしくは繁殖地に接触させることを含む方法を提供する。

#### 【0011】

また、本発明は、それらの化合物を含有する有害生物防除もしくは寄生虫防除組成物を含む。有利なことに、2-(置換チオ)チアゾロ[4, 5-b]ピリジン化合物、およびそれらを含む組成物が、線虫類有害生物の防除のために特に有用であることが見い出された。

#### 【0012】

##### 【課題を解決するための手段】

本発明は、蠕虫類、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物もしくは寄生虫の防除方法であって、式Iの2-(置換チオ)チアゾロ[4, 5-b]ピリジン化合物の有害生物防除剤もしくは寄生虫防除剤としての有効量を、該有害生物もしくは寄生虫、またはそれらの食餌供給、生息もしくは繁殖地に接触させることを含む方法を提供する。

#### 【0013】

線虫類の防除のために特に有用である式I化合物は、なかんずく、

2-[(4, 4, 3-トリフルオロ-3-ブテニル)チオ]チアゾロ[4, 5-b]ピリジン；

2-[(プロモジフルオロメチル)チオ]チアゾロ[4, 5-b]ピリジン；および

2-[(ジフルオロメチル)チオ]チアゾロ[4, 5-b]ピリジンを含む。

#### 【0014】

また、本発明は、植物の葉か、またはそれらが生育している土壌もしくは水に、式Iの2-(置換チオ)チアゾロ[4, 5-b]ピリジン化合物の有害生物防除剤としての有効量を適用することを含む、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物による侵襲もしくは寄生からの生育植物の保護方法を提供する。

#### 【0015】

本発明の式I化合物は、植物寄生性線虫類、および土壌中に遊離して生活している線虫類の防除のために有用である。植物寄生性線虫類は、限定されるものではないが、外部寄生虫、例えばキシフィネマ種(Xiphinema spp.)、ロンギドラス種(Longidorus spp.)およびトリコドラス種(Trichodorus spp.)；半寄生虫、例えばチレンキュラス種(Tylench

10

20

30

40

50

hulus spp.) ; 移住性内部寄生虫、例えばプラチレンカス種 (Pratylenchus spp.)、ラドホラス種 (Radopholus spp.) およびスクテロネマ種 (Scutellonema spp.) ; 定住性寄生虫、例えばヘテロデラ種 (Heterodera spp.)、グロボデラ種 (Globodera spp.) およびメロイドジーン種 (Meloidogyne spp.) ; そして幹および葉内部寄生虫、例えばジチレンカス種 (Ditylenchus spp.)、アフエレンコイデス種 (Aphelenchoides spp.) およびヒルシュマニエラ種 (Hirshmaniella spp.) を包含する。

【0016】

また、式 I の 2 - (置換チオ)チアゾロ [4, 5 - b]ピリジン化合物は、昆虫類および/またはダニ類有害生物を防除するために有用である。本発明の式 I 化合物によって防除される昆虫類は、限定されるものではないが、鱗翅類 (Lepidoptera)、例えばタバコ・バッドウォーム (budworm)、キャベツ・シャクトリムシ、ワタ・ボールウォーム (bollworm)、ビート・ヨトウムシ、サザンヨトウムシおよびダイヤモンドバックモス (diamondbackmoth) ; 同翅類 (Homoptera)、例えばアブラムシ、ヒメヨコバイ、プラントホッパー (planthopper) およびホワイトフライ (whitefly) ; アザミウマ類 (Thysanoptera)、例えばスリップス ; 甲虫類 (Coleoptera)、例えばボールゾウムシ、コロラドポテト・ビートル (beetle)、サザントウモロコシ・ネキリムシ (rootworm)、ウエスタントウモロコシ・ネキリムシおよびカラシ・ビートル ; および直翅類 (Orthoptera)、例えばイナゴ、コオロギ、バッタおよびゴキブリを包含する。本発明の化合物によって防除されるダニ類は、限定されるものではないが、ハダニ類 (mite)、例えばナミハダニ、カーミンハダニ (carminespidermite)、バンクグラスハダニ (bankgrassmite)、イチゴ・ハダニ、カンキツ・サビダニおよびレプロシスマイト (leprosismite) を包含する。

【0017】

実施においては、線虫類、昆虫類および/またはダニ類の侵襲および寄生から植物を保護するために、植物か、または植物が生育中か生育する前の土壌もしくは水に適用される場合には、一般に、水もしくはその他の液状キャリアーに分散された式 I 化合物約 0.1 ppm ~ 約 10,000 ppm、好ましくは約 1 ppm ~ 約 5,000 ppm が効果的である。

【0018】

また、本発明の 2 - (置換チオ)チアゾロ [4, 5 - b]ピリジン化合物は、有効成分の割合約 0.1 kg/ha ~ 4.0 kg/ha を提供するために十分な量において、植物の葉および/または該植物が生育中か生育する前の土壌もしくは水に適用される場合、線虫類、昆虫類および/またはダニ類有害生物を防除するために効果的である。

【0019】

本発明の式 I 化合物は、単独で使用される場合、生育期および収穫期の両方の農作物の線虫類、昆虫類および/またはダニ類有害生物を防除するために効果的であるけれども、また、それらが、限定されるものではないが、他の殺線虫剤、殺虫剤および/または殺ダニ剤を含む、農業において使用される他の生物学的薬剤と組み合わせて使用されてもよい。例えば、本発明の式 I 化合物は、ピレトロイド、ホスフェート類、カルバメート類、シクロロジエン、バチルス・チューリンジエンシス (Bacillus thuringiensis) (Bt) の内毒素、ホルムアミジン、フェノールスズ化合物、塩素化炭化水素、ベンゾイルフェニル尿素、ピロール等との結合物もしくは組み合わせ物において効果的に使用することができる。

【0020】

本発明の化合物は、乳剤原液、フロアブル原液もしくは水和剤として製剤化されてもよく、これらは、水もしくは他の適当な極性溶媒により、一般にイン・サイチューで希釈され、次いで、希薄噴霧液として適用される。また、該化合物は、乾式圧縮された粒剤、粒状製剤、粉剤、粉剤濃厚物、懸濁剤原液、ミクロ乳剤およびそれに類するものに製剤化されてもよく、これらすべては、それ自体、必要な植物保護を提供するために、種子、土壌、水および/または葉に適用される。本発明のそのような製剤もしくは組成物は、1種以上

10

20

30

40

50

の農業的に許容しうる不活性の、固形もしくは液状キャリアーと混合された本発明の式I化合物（またはその組み合わせ物）を含む。それらの組成物は、有害生物防除剤として有効量の該化合物もしくは化合物類を含有し、この量は、特定の化合物、標的有害生物および使用方法に応じて変えることができる。当業者は、有害生物防除剤としての有効量がどれだけであるか、過度の実験なしに容易に決定することができる。

【0021】

また、本発明は、蠕虫類、ダニ類および節足動物内・外寄生虫による寄生および感染に対して、ヒトを含む温血動物、および魚類を治療、防除、予防および保護する方法であって、式Iの2 - (置換チオ)チアゾロ[4, 5 - b]ピリジン化合物の駆虫剤、殺ダニ剤もしくは内・外寄生虫防除剤としての有効量を、経口的、局所的もしくは非経口的に、該動物に投与もしくは適用することを含む方法を提供する。

10

【0022】

上記方法は、特に、温血動物、例えばウシ、ヒツジ、ブタ、ラクダ、シカ、ウマ、家禽、魚類、ウサギ、ヤギ、イヌおよびネコ、ならびにヒトにおける蠕虫類、ダニ類および節足動物内・外寄生虫の寄生および感染を防除および予防するために有用である。

【0023】

寄生虫症は、多くの農場および伴侶動物において見いだされる広範な疾病であり、そして世界中に、かなりの経済的損失を引き起こしている。有意な損害を惹起する蠕虫類は、通常、吸虫もしくは扁形虫として知られる綱・吸虫類 (Trematoda) のメンバー、特に、属・ファシオーラ (Fasciola)、ファシオロイデス (Fascioloides)、パラムフィストムム (Paramphistomum)、ヂクロコエリウム (Dicrocoelium)、オイリトレマ (Eurytrema)、オフィストルキス (Ophisthorchis)、ファシオロプシス (Fasciolopsis)、エチノストマ (Echinostoma) およびパラゴニムス (Paragonimus) のメンバーである。また、寄生虫症は、線虫類として言及される虫群によって惹起される。線虫類は、腸管、心臓、肺臓および血管を含む、それらが住み着く器官の壁および組織に重篤な損傷を惹起し、そして貧血の1次病因である。もし処置せずに放置すれば、それらは、感染動物に死をもたらすであろう。もっとも普通に温血動物の感染因子であることが分かっている線虫類は、属・ヘモンカス (Haemonchus)、オステルタジア (Ostertagia)、クーペリア (Cooperia)、エスファガストムム (Oesphagostomum)、ネマトジラス (Nematodirus)、ジクチオカウルス (Dictyocaulus)、トリキュリス (Trichuris)、ジロフィラリア (Dirofilaria)、アンシクロストマ (Ancylostoma)、アスカリス (Ascaris) などのメンバーを含む。有利には、本発明の式I化合物は、寄生虫症の病原因子に対して有用である。

20

30

【0024】

蠕虫類を防除する外に、本発明の式I化合物は、内部寄生節足動物の寄生、例えばウシのウジおよび胃のウマバエ幼虫を防除する。その上、限定されるものではないが、シラミ、ダニ、マダニ、鼻ウマバエ幼虫、ヒツジシラミバエ (k e d)、サシバエ (b i t i n g f l y)、m u s c o i d f l y、ハエ、蠅蛆症バエ幼虫、ツツガムシ (c h i g g e r)、ブヨ、カおよびノミを含む、温血動物および魚類におけるダニ類および節足動物外部寄生虫の寄生が、本発明の2 - (置換チオ)チアゾロ[4, 5 - b]ピリジン化合物によって防除、予防もしくは駆除されるであろう。また、本発明の式I化合物は、目・アカリホルメス (Acariformes) およびパラシチホルメス (Parasitiformes) のダニを含む、温血動物哺乳類および家禽に寄生するダニを防除するために使用されてもよい。本発明の式I化合物によって防除されてもよい節足動物外部寄生虫は、限定されるものではないが、刺すシラミ (b i t t i n g l i c e)、吸うシラミ (s u c k i n g l i c e)、ウマバエ、サシバエ、ブヨ、カおよびノミを含む。刺すシラミは、ハジラミ類 (Mallophaga)、例えばボピコラ・ボピス (Bovicola bovis)、トリコデクテス・カニス (Trichodectes canis) およびダミリナ・オピス (Damilina ovis) のメンバーを含む。吸うシラミは、シラミ類 (Anoplura)、例えばヘマトピナス・オイリステルナス (Haematopinus eurysternus)、ヘマトピナス・スイス (Haematopinus suis)、リノグナタス・ピツリ (Linognathus vituli) およびソレノポテス・カピラタス (Solenopotes capillatus) のメ

40

50

ンバーを含む。サシバエは、ヘマトビア (Haematobia) のメンバーを含む。

【0025】

温血動物への経口投与では、式I化合物は、動物飼料、動物飼料プレミックス、濃厚動物飼料、丸剤、液剤、ペースト剤、懸濁剤、飲剤、ゲル剤、錠剤、巨丸剤およびカプセル剤として製剤化されてもよい。さらに、式I化合物は、動物に対してそれらの飲用水において投与されてもよい。経口投与では、選ばれた製剤は、式I化合物1日当たり約0.01 mg/kg ~ 100 mg/kg 動物体重を、動物に提供すべきである。

【0026】

あるいはまた、式I化合物は、動物に対して非経口的に、例えばルーメン内、筋肉内、静脈内もしくは皮下注射によって投与されてもよい。式I化合物は、皮下注射のためには、生理学的に許容しうるキャリアー中に分散もしくは溶解されてもよい。さもなくば、式I化合物は、皮下投与のために移植体に製剤化されてもよい。さらに、式I化合物は、動物に対して経皮的に投与されてもよい。非経口投与では、選ばれた製剤は、式I化合物1日当たり約0.01 mg/kg ~ 100 mg/kg 動物体重を、動物に提供すべきである。

10

【0027】

また、式I化合物は、浸漬剤、ダスト剤、粉剤、首輪 (collars)、メダル (medallions)、噴霧剤および振りかけ (pour-on) 製剤の剤形で、局所的に動物に適用されてもよい。局所適用では、浸漬剤および噴霧剤は、通常、式I化合物約0.5 ppm ~ 5,000 ppm、好ましくは約1 ppm ~ 3,000 ppmを含有する。さらに、式I化合物は、動物、特に四足獣、例えばウシおよびヒツジ用のイアー・タグとして製剤化されてもよい。

20

【0028】

また、本発明の式I化合物は、限定されるものではないが、駆虫剤、例えばベンズイミダゾール、ピペラジン、レバミソール、ピランテル、プラジカンテル等；エンデクトシド (endectocides)、例えばアベルメクチン、ミルベマイシン等；外部寄生虫防除剤、例えばアリアルピロール、有機ホスフェート類、カルバメート類、フィプロニルを含む - 酪酸阻害剤、ピレトロイド、スピノサッド、イミダクロプリド等；昆虫の成長調整剤、例えばピリプロキシフェン、シロマジン等；およびキチンシンターゼ阻害剤、例えばフルフェノクスロンを含むベンゾイル尿素、を含む1種以上の他の殺寄生虫化合物との組み合わせ物または結合物 (conjunction) において使用されてもよい。

30

【0029】

また、式I化合物は、効力を増進し、スペクトルを拡大し、そして寄生虫防除のための簡便な方法を提供するために、1種以上の慣用の相乗剤、例えばピペロニルブトキシド、N-オクチルビスクロヘプテンジカルボキシイミド、ピリジン-2,5-ジカルボン酸ジプロピルおよび1,5a,6,9,9a,9b-ヘキサヒドロ-4a(4H)-ジベンゾフランカルボキシアルデヒドとの組み合わせ物もしくは結合物において使用されてもよい。

【0030】

本発明の寄生虫防除組成物は、1種以上の薬物的および/または農業的に許容しうる不活性な固形もしくは液状キャリアーと混合された本発明の式I化合物(またはその組成物)を含む。それらの組成物は、寄生虫防除剤として有効量の該化合物もしくは化合物類を含有する。当業者は、寄生虫防除剤としての有効量がどれだけであるか、過度の実験なしに容易に決定することができる。

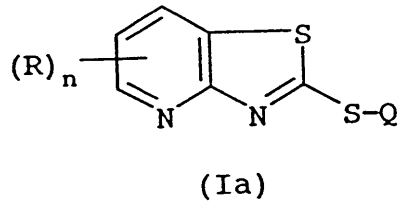
40

【0031】

また、本発明は、構造式I a

【0032】

【化7】



[ 式中、

R は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオもしくは $CO_2R_1$ であり；

n は、0, 1, 2もしくは3であり；

Q は、 $C_3 - C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_7$ シクロアルケニル、 $C_4 - C_7$ ハロシクロアルケニル、

$C_3 - C_7$ シクロアルキルもしくは $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル基 1 個によって置換されている $C_1 - C_6$ アルキル、または

場合によっては、 $C_3 - C_7$ シクロアルキルもしくは $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル基 1 個によって置換されている $C_1 - C_6$ ハロアルキルであるが、

但し、Q が $CF_2H$ 以外であるという条件がある；そして

$R_1$  は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $CH_2(C_1 - C_6$ ハロアルキル)、 $C_3 - C_{10}$ アルケニル、 $C_3 - C_{10}$ ハロアルケニル、カチオン、

環においてハロゲン原子 1 ~ 5 個、シアノ基 1 もしくは 2 個、ニトロ基 1 もしくは 2 個、 $C_1 - C_4$ アルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基 1 ~ 3 個または $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ基 1 ~ 3 個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているベンジル、あるいは

ハロゲン原子 1 ~ 5 個、シアノ基 1 もしくは 2 個、ニトロ基 1 もしくは 2 個、 $C_1 - C_4$ アルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基 1 ~ 3 個または $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ基 1 ~ 3 個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているフェニルである ]

をもつ新規な 2 - (置換チオ)チアゾロ [ 4 , 5 - b ]ピリジン化合物、ならびにそれらの農学的および/または薬物学的に許容しうる塩を提供する。

【 0 0 3 3 】

さらに、本発明は、2 - [ (ジフルオロメチル)チオ ]チアゾロ [ 4 , 5 - b ]ピリジンを提供する。

【 0 0 3 4 】

前記ハロゲンの例は、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素である。用語「 $C_1 - C_4$ ハロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ ハロアルキル」、「 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ」、「 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ」、「 $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル」、「 $C_3 - C_6$ ハロアルケニル」、「 $C_3 - C_{10}$ ハロアルケニル」および「 $C_4 - C_7$ ハロシクロアルケニル」は、それぞれ、1 個以上のハロゲン原子によって置換されている $C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ基、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 - C_6$ アルケニル基、 $C_3 - C_{10}$ アルケニル基および $C_4 - C_7$ シクロアルケニル基として定義される。先の式 I および式 Ia において使用されるように、カチオンは、アルカリ金属、アルカリ土類金属、マンガン、銅、鉄、亜鉛、コバルト、鉛、銀、ニッケル、アンモニウムもしくは有機アンモニウムを示す。アルカリ土類金属は、カルシウムおよびマグネシウムを含む。有機アンモニウムカチオンは、限定されるものではないが、モノアルキルアンモニウム、ジアルキルアンモニウム、トリアルキルアンモニウム、テトラアルキルアンモニウム、モノアルケニルアンモニウム、ジアルケニルアンモニウム、トリアルケニルアンモニウム、モノアルキニルアンモニウム、ジアルキニルアンモニウム、モノアルカノールアンモニウム、ジアルカノールアンモニウム、 $C_5 - C_6$ シクロアルキルアンモニウム、ピペリ

10

20

30

40

50

ジニウム、モルホリニウム、ピロリジニウム、ベンジルアンモニウム等を含む。

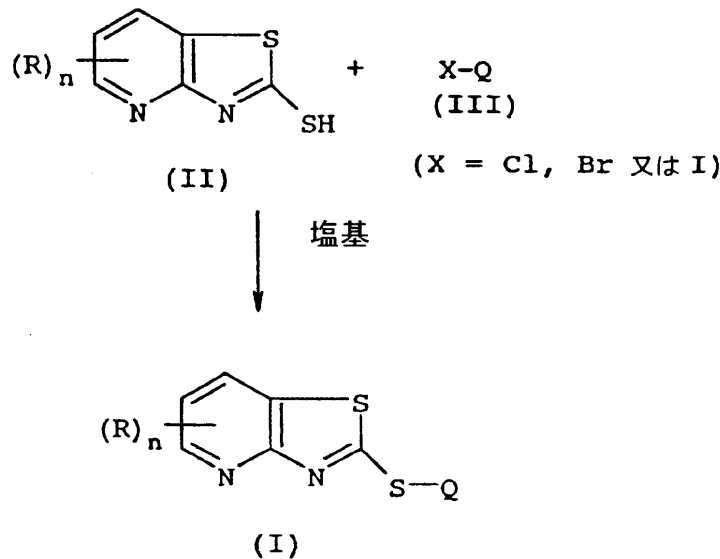
【0035】

本発明の式 I 化合物は、流れ図 I において以下に示めされるように、構造式 II をもつ 2-チオールチアゾロ[4,5-b]ピリジン化合物と、構造式 III をもつ求電子化合物および塩基を、溶媒の存在下で反応させることによって製造されてもよい。

【0036】

【化 8】

### 流れ図 I



さらに、式 I のある種の化合物は、当業者には既知の慣用操作を用いて、式 I の他の化合物に転化されてもよい。

【0037】

式 II の出発化合物は、当該技術分野において既知であり、そして K. Smith らにより *Sulfur Letters*, 18(2), pages 79-95 (1995) において記述される操作によって製造されてもよい。

【0038】

本発明のさらなる理解を容易にするために、先ず、次の実施例が、その特定の詳細をより具体的に説明するために提示される。本発明は、請求の範囲に定義されることを除き、それによって限定されるべきでない。

【0039】

【実施例】

実施例 1 - 6

2 - [(4, 4, 3-トリフルオロ-3-ブテニル)チオ]チアゾロ[4, 5-b]ピリジンの製造

【0040】

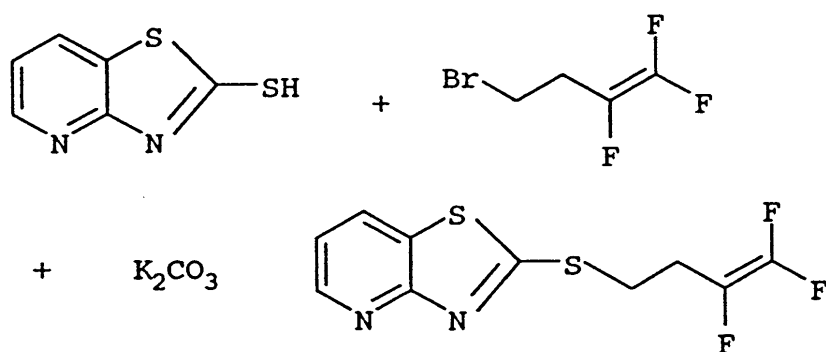
【化 9】

10

20

30

40



10

窒素下で、N, N - ジメチルホルムアミド中チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - チオール ( 6 . 2 g , 0 . 0 3 7 m o l ) 溶液を、1, 1, 2 - トリフルオロ - 4 - ブロモブテン ( 8 . 3 g , 0 . 0 4 6 m o l ) および炭酸カリウム ( 1 . 5 g ) と処理し、60 に加熱して、24 時間攪拌し、冷却し、そして水中に注ぐ。得られる混合水溶液を、ジエチルエーテルで抽出する。有機抽出液を、無水硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして真空濃縮して残渣を得る。シリカゲルと 9 : 1 ヘキサン / 酢酸エチル溶液を用いる残渣のカラムクロマトグラフィーにより、無色油状物として表題の生成物 ( 8 . 9 g , 収率 6 4 % ) を得る。

【 0 0 4 1 】

20

 $C_{10}H_7F_3N_2S_2$ 

計算値：C, 43.47 ; H, 2.55 ; N, 10.14 %。

【 0 0 4 2 】

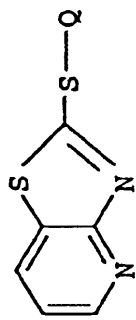
実測値：C, 43.46 ; H, 2.58 ; N, 10.14 %。

【 0 0 4 3 】

実施例 1 に記述されるものと本質的に同じ操作を用いて、次の化合物が得られる：

【 0 0 4 4 】

【 表 1 】



実施例	Q	色/状態	融点°C	元素分析		
				C%	H%	N%
2	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	赤色 液体		計算値 51.90	3.87	13.45
				実測値 52.22	3.94	13.18
3		Lt. 黄色 固体	39.5-42.0	計算値 54.02	4.53	12.60
				実測値 54.24	5.39	12.51
4	$\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$	白色 固体	68-71	計算値 44.98	3.36	11.66
				実測値 44.93	3.54	11.63
5	$\text{CH}_2\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	白色 固体	70-72	計算値 47.23	3.96	11.01
				実測値 47.52	4.18	10.82
6	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	Lt. 黄色 液体		計算値 49.23	4.51	10.44
				実測値 49.50	4.61	10.38

10

20

30

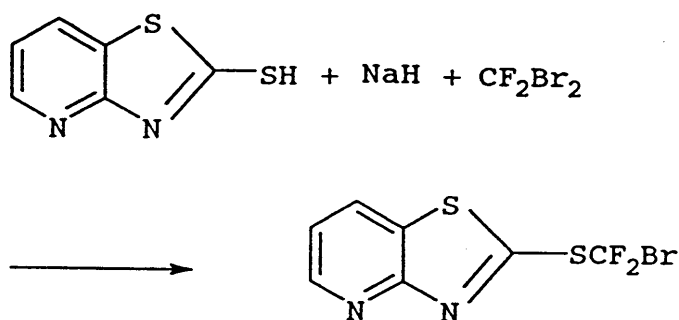
40

## 実施例 7

2 - [ (プロモジフルオロメチル) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジンの製造

【 0 0 4 5 】

【 化 1 0 】



10

N, N - ジメチルホルムアミド中チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - チオール ( 2 . 0 g , 1 2 m m o l ) 溶液を、N, N - ジメチルホルムアミド中水素化ナトリウム ( 0 . 9 6 g , 0 . 0 2 4 m o l ) の混合液に、30分かけて滴下する。得られる反応混合液を、N, N - ジメチルホルムアミド中ジブロモジフルオロメタン ( 2 . 5 2 g ) 溶液と処理し、室温で24時間攪拌し、そして氷 - 水混合液中に注ぐ。得られる混合水溶液を、酢酸エチルで抽出する。有機抽出液を、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして真空濃縮して残渣を得る。シリカゲルとジクロロメタンを用いる残渣のクロマトグラフィーし、次いでN, N - ジメチルホルムアミド (トルエン) の共沸除去により油状物を得る。油状物を、さらに、シリカゲルと20 : 1 酢酸エチル / ヘキサン溶液を用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、明黄色液体として表題の生成物 ( 0 . 6 1 g , 収率 1 7 % ) を得る。

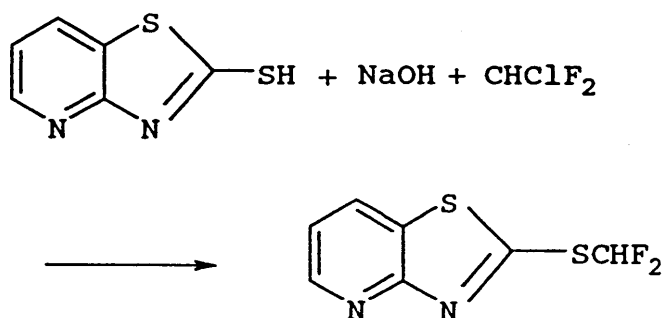
20

【 0 0 4 6 】

実施例 82 - [ (ジフルオロメチル) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジンの製造

【 0 0 4 7 】

【 化 1 1 】



30

ジオキサン中チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - チオール ( 2 . 0 g , 1 2 m m o l ) 溶液を、水中水酸化ナトリウム ( 4 . 8 g , 1 2 0 m m o l ) の溶液と処理し、70に加熱し、クロロジフルオロメタンの定常蒸気により75分間処理し、そして氷上に注ぐ。得られる混合水溶液を、濃塩酸で酸性にし、そしてジクロロメタンで抽出する。有機抽出液を、無水硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして真空濃縮して残渣を得る。シリカゲルとそれぞれの酢酸エチル / ヘキサン溶液を用いるカラムクロマトグラフィーにより、明黄色固体として表題の生成物 ( 0 . 8 6 g , 収率 3 3 % , m p 4 1 - 4 3 ) を得る。

40

【 0 0 4 8 】

 $C_7H_4F_2N_2S_2$ 

計算値 : C , 3 8 . 5 2 ; H , 1 . 8 5 ; N , 1 2 . 8 4 % .

【 0 0 4 9 】

実測値 : C , 3 8 . 5 8 ; H , 1 . 7 3 ; N , 1 2 . 7 2 % .

【 0 0 5 0 】

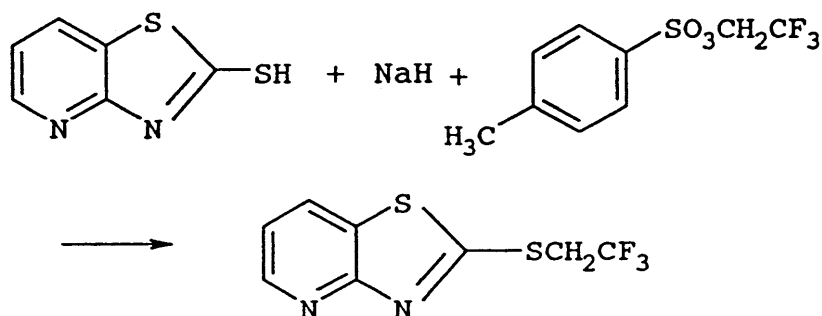
実施例 92 - [ ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジンの製

50

造

【0051】

【化12】



10

N, N - ジメチルホルムアミド中水素化ナトリウム (油中 60% 懸濁液、0.72 g, 0.03 mol) の混合液を、0 に冷却し、N, N - ジメチルホルムアミド中チアゾロ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - チオール (5.0 g, 30 mmol) 溶液を滴下処理し、30 分間攪拌し、N, N - ジメチルホルムアミド中 p - トルエンスルホン酸 2, 2, 2 - トリフルオロエチル (3.81 g, 15 mmol) 溶液と処理し、110 に加熱し、6 時間攪拌し、そして氷 / 水混合液中に注ぐ。得られる混合水溶液を、ジエチルエーテルで抽出する。有機抽出液を、水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして真空濃縮して残渣を得る。酢酸エチル / ヘキサン溶液を用いる残渣のカラムクロマトグラフィーにより、明黄色液体として表題の生成物 (2.91 g, 収率 39%) を得る。

20

【0052】

 $C_8H_5F_3N_2S_2$ 

計算値：C, 38.39; H, 2.01; N, 11.19%。

【0053】

実測値：C, 38.58; H, 2.08; N, 10.94%。

【0054】

実施例 10

ポット栽培トマトにおけるネコブセンチュウ、メロイドジーン・インコグニタ (Meloidogyne incognita) を標的とする土壤線虫防除アッセイ

30

試験化合物をアセトンに溶解し、そして必要な試験濃度まで水で希釈する。3 週齢のトマト移植苗のある 3 インチポット内の沈泥ローム土壌を、試験溶液で湿らす。ネコブセンチュウ、メロイドジーン・インコグニタ (Meloidogyne incognita) J2 の幼虫 4 千匹を、土壌上に、水懸濁液において分配する。ポットを温室内に保ち、そしてポット培養 4 週後、植物の根を洗浄して土壌を除き、下記に定められた根こぶ形成インデックスを用いて、根こぶ形成の程度をスコアーする。エトプロホスを工業標準物質として試験中に含める。結果を表 I に総括する。

【0055】

【表 2】

## 根こぶ形成インデックス

<u>こぶ形成インデックス</u>	<u>こぶ形成された全根系の%</u>	
0	0	
1	10	
2	20	10
3	30	
4	40	
5	50	
6	60	
7	70	
8	80	
9	90	
10	100	20

【 0 0 5 6 】

【 表 3 】

表 I

## 土壌線虫防除評価

<u>化合物</u>	<u>適用割合(ppm)</u>	<u>こぶ形成インデックス</u>	
実施例1	50	0 <sup>1</sup>	30
	25	0 <sup>1</sup>	
	10	0	
エトプロホス	50	0 <sup>1</sup>	40
	25	0 <sup>1</sup>	
	10	0	
対照	-	7	

<sup>1</sup> 植物毒性が観察された実施例 1 1C. エレガンス (C. elegans) に対する試験化合物の評価

C. エレガンス (C. elegans) (J. Lewisからの Bristol株) の培養物は、NG寒天プレート上のE. コリ (E. coli) ローンにおいて維持される。新規培養物は毎週作成される。試験用線虫をNaバッファーを用いて培養物から洗い出す。化合物を80%

50

アセトンに溶解する。試験材料を、96穴滅菌組織培養プレートの各ウェルにマイクロピペットで添加(25 µl)し、溶媒を蒸発させる。Naバッファ中のC.エレガンスの新規調製された量(50 µl)を、各処理ウェルおよび1プレート当たり数個の対照ウェル中にマイクロピペットで添加する。プレートを20℃でインキュベートする。効力の観察は、浸漬後4および24時間目に解剖顕微鏡下で行われる。プレートを読む直前に、虫の動きを刺激することのために、それを軽くたたく。活性は主観的に判定されるが、半定量的に、成虫および幼虫の運動に及ぼす薬物効果に基づいている。基準は、次のとおりである：

7 = 24時間目における虫の約95%の顕著な運動低下、そして

0 = 正常な運動、対照と同じ。

結果を表IIに総括する。

【0057】

【表4】

10

表II  
C.エレガンスに対する試験化合物の評価

実施例	C.エレガンス (300 ppm)
1	7
2	0
3	9
4	9
5	9
6	9

20

30

#### 実施例12

##### 試験化合物の殺虫性および殺ダニ性評価

試験溶液は、濃度10,000 ppmにするため、水中35%アセトン混合液に試験化合物を溶解することによって製造される。連続希釈が、必要に応じて水で行われる。

【0058】

スポドプテラ・エリダニア (Spodoptera eridania)、二齢幼虫、サザン・ヨトウムシ (SAW)

40

長さ7~8cmまで広がったSievアリマメ葉を、3秒間攪拌しながら試験溶液に浸漬し、そしてフード内で乾燥させる。次いで、葉を、底に湿った濾紙を含有する100x10mmペトリ皿中に置き、そして二齢毛虫10匹を入れる。5日目に、死亡数、摂餌低下もしくは正常な脱皮の何らかの阻害について観察する。

【0059】

ジアプロチカ・ビルギフェラ ビルギフェラ (Diabrotica virgifera virgifera) L e c o n t e、二齢ウエスタントウモロコシ・ネキリムシ (WCR)

微細タルク1ccを、30ml容広口のねじ蓋付きガラスジャー中に入れる。適当なアセトン試験溶液1mlを、タルク上にピペットで滴下して、ジャー当たり有効成分1.25

50

mgにする。ジャーを、アセトンが揮発するまで弱い気流下に置く。乾燥タルクを解し、モロコシ (millet) 種子 1cc を添加して、昆虫の餌として与え、そして湿潤土壌 25ml を、各ジャーに添加する。ジャーのキャップを閉め、内容物を、徹底的に機械的に混合する。この後、二齢ネキリムシ 10匹を各ジャーに添加し、そしてジャーを、幼虫のために空気交換できるようゆるく蓋をする。この処置は、死亡数が数えられる 5日間維持される。幼虫が見られなくなることは、死んだと考えられる、何故なら幼虫は急速に分解し、そして発見できないからである。この試験で使用された有効成分の濃度は、大体 50kg/ha に対応する。

【0060】

テトラニクス・ウルチカエ (Tetranychus urticae) (OP耐性株)、ナミハダニ (TSM)

10

7~8cmに広がった第1葉をもつ Sieva リママメ植物を選択し、そして1ポット当たり1本の植物に刈り戻す。主コロニーから採取した寄生した葉から、小片を切り取り、試験植物の各葉の上に置く。これは、処理2時間前に実施され、ハダニが、産卵のために試験植物上を動き回るようにさせる。カットされる寄生葉の大きさを変えて、1葉当たりハダニ約100匹にする。試験処理の時点で、ハダニを移すために使用された葉片を除去し、廃棄する。新しく寄生された植物を、試験溶液に3秒間攪拌しながら浸漬し、そしてフード中で乾燥させる。

2日後、1枚の葉を採取し、そして死亡数を数える。

【0061】

20

アフィス・ゴシピイ (Aphis gossypii)、ワタ・アブラムシ (CA)

子葉段階のワタ植物を選らび、そして1ポット当たり1本の植物に刈り戻す。

重い寄生葉を、主コロニーから採取し、そして各子葉の頂部に置く。アブラムシを、一夜、宿主植物に移動させる。試験処理の時点で、アブラムシを移すために使用された葉を除去し、廃棄する。子葉を試験溶液に浸漬し、そして乾燥させる。5日後、死亡数を数える。

【0062】

スポドプテラ・エリダニア (Spodoptera eridania)、卵 - サザン・ヨトウムシおよびチアプロチカ・ウンデシムプンクタータ ホワルチ (Diabrotica undecimpunctata howardi)、卵 - サザントウモロコシ・ネキリムシ (SAW - 卵) および (SCR - 卵)

30

人工飼料を含有しているウェルを、試験溶液で処理し、そして乾燥する。次いで、適当な昆虫の卵をウェル中に入れる。ウェルを、通気される接着性透明プラスチックカバーで覆う。7日後、死亡数を数える。

【0063】

試験は、以下に示されるスケールにしたがって評価され、そして得られるデータが表 I I に示される。

【0064】

【表5】

## 表Ⅲ

## 殺虫性および殺ダニ性評価

実施例	CA (300 <sup>1</sup> )	SAW (300 <sup>1</sup> )	SAW Eggs (3000 <sup>1</sup> )	SCR Eggs (1000 <sup>1</sup> )	TSM (300 <sup>1</sup> )	WCR (50 <sup>1</sup> )	
1	0	0	8	9	0	0	10
2	0	0	0	0	0	1	
3	4	0	0	0	0	0	
4	0	0	0	0	0	0	
5	0	0		0	0	0	
6	0	0	9	0	0	0	
7	0	0	9	9	5	9	20
8	3	0	9	9	8	9	
9	0	0	9	9	0	0	

<sup>1</sup>適用割合(ppm)

## 実施例 13

ルシリア・セリカータ (*Lucilia serricata*) における試験化合物の外部寄生虫防除性評価

30

試験溶液は、濃度 100 ppm にするため、アセトンに溶解される。200 μl を、128 穴アッセイトレイ中の 12 mm 濾紙ディスク 3 枚に添加し、そして乾燥させる。一齢アオバエ幼虫約 20 匹およびウシ血清 200 μl をディスクに添加する。ウェルをプラスチックの蓋で覆い、そして約 27 °C でインキュベートする。死亡数を、24 および 48 時間目に測定する。結果を表 IV に総括する。

【0065】

【表 6】

表IV

## ルシリア・セリカータに対する試験化合物の評価

実施例	適用割合(ppm)	死亡%	
		24 hr	48 hr
1	100	100	100
2	100	0	0
3	100	0	0
6	100	0	0
7	100	80	100
8	100	0	0
9	100	0	0

10

本発明の特徴および態様は以下のとおりである。

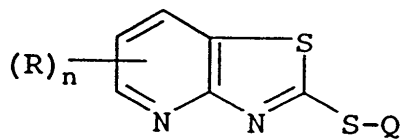
【0066】

20

1. 蠕虫類、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物もしくは寄生虫の防除方法であって、構造式I

【0067】

【化13】



(I)

30

[式中、

Rは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキルチオもしくはCO<sub>2</sub>R<sub>1</sub>であり；

nは、0, 1, 2もしくは3であり；

Qは、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルケニル、C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>ハロシクロアルケニル、場合によっては、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>ハロシクロアルキルもしくはCO<sub>2</sub>R<sub>2</sub>基1個によって置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、

40

場合によっては、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>ハロシクロアルキルもしくはCO<sub>2</sub>R<sub>2</sub>基1個によって置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；そして

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、各々独立して、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、CH<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>ハロアルケニル、カチオン、環においてハロゲン原子1~5個、シアノ基1もしくは2個、ニトロ基1もしくは2個、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基1~3個、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基1~3個、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基1~3個またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基1~3個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているベンジル、あるいは

ハロゲン原子1~5個、シアノ基1もしくは2個、ニトロ基1もしくは2個、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基1~3個、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基1~3個、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基1~3個ま

50

たは  $C_1 - C_4$  ハロアルコキシ基 1 ~ 3 個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているフェニルである]

をもつ化合物、ならびにそれらの農学的および/または薬物学的に許容しうる塩の、有害生物防除剤もしくは寄生虫防除剤としての有効量を、該有害生物もしくは寄生虫、またはそれらの食餌供給、生息もしくは繁殖地に接触させることを含む、方法。

【0068】

2. 化合物が、

2 - [(4, 4, 3 - トリフルオロ - 3 - ブテニル) チオ] チアゾロ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - [(プロモジフルオロメチル) チオ] チアゾロ [4, 5 - b] ピリジン; および

2 - [(ジフルオロメチル) チオ] チアゾロ [4, 5 - b] ピリジン

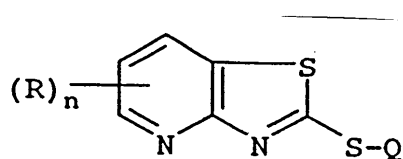
からなる群から選ばれる、第 1 項記載の方法。

【0069】

3. 構造式 I

【0070】

【化 14】



(I)

[ 式中、n, R および Q は、第 1 項に記述されたとおりである ]

をもつ化合物の有害生物防除剤としての有効量を、植物の葉か、またはそれらが生育している土壌もしくは水に適用することを含む、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物による侵襲もしくは寄生からの生育植物の保護方法。

【0071】

4. 化合物が、

2 - [(4, 4, 3 - トリフルオロ - 3 - ブテニル) チオ] チアゾロ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - [(プロモジフルオロメチル) チオ] チアゾロ [4, 5 - b] ピリジン; および

2 - [(ジフルオロメチル) チオ] チアゾロ [4, 5 - b] ピリジン

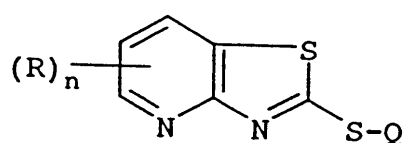
からなる群から選ばれる、第 3 項記載の方法。

【0072】

5. 構造式 I

【0073】

【化 15】



(I)

[ 式中、n, R および Q は、第 1 項に記述されたとおりである ]

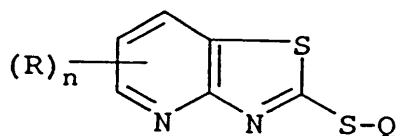
をもつ化合物の駆虫剤、殺ダニ剤もしくは内・外寄生虫防除剤としての有効量を、経口的、局所的もしくは非経口的に、温血動物もしくは魚類に投与もしくは適用することを含む、蠕虫類、ダニ類もしくは節足動物内・外寄生虫による寄生もしくは感染に対して、該動物もしくは魚類を治療、防除、予防もしくは保護する方法。

【 0 0 7 4 】

6 . 農業的もしくは薬物学的に許容しうるキャリアーおよび構造式 I

【 0 0 7 5 】

【 化 1 6 】



(I)

10

[ 式中、n , RおよびQは、第1項に記述されたとおりである ]

をもつ化合物の有害生物防除剤もしくは寄生虫防除剤としての有効量を含む、蠕虫類、線虫類、昆虫類もしくはダニ類有害生物もしくは寄生虫防除のための組成物。

【 0 0 7 6 】

7 . 化合物が、

2 - [ ( 4 , 4 , 3 - トリフルオロ - 3 - ブテニル ) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン ;

2 - [ ( プロモジフルオロメチル ) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン ; および

2 - [ ( ジフルオロメチル ) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン

20

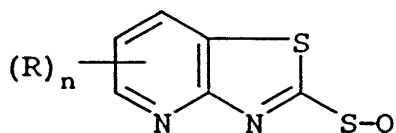
からなる群から選ばれる、第6項記載の組成物。

【 0 0 7 7 】

8 . 構造式 I a

【 0 0 7 8 】

【 化 1 7 】



(Ia)

30

[ 式中、

Rは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオもしくは $CO_2R_1$ であり ;

nは、0 , 1 , 2もしくは3であり ;

Qは、 $C_3 - C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_7$ シクロアルケニル、 $C_4 - C_7$ ハロシクロアルケニル、

$C_3 - C_7$ シクロアルキルもしくは $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル基1個によって置換されている $C_1 - C_6$ アルキル、または

40

場合によっては、 $C_3 - C_7$ シクロアルキルもしくは $C_3 - C_7$ ハロシクロアルキル基1個によって置換されている $C_1 - C_6$ ハロアルキルであるが、

但し、Qが $CF_2H$ 以外であるという条件がある ; そして

$R_1$ は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $CH_2(C_1 - C_6$ ハロアルキル)、 $C_3 - C_{10}$ アルケニル、 $C_3 - C_{10}$ ハロアルケニル、カチオン、

環においてハロゲン原子1 ~ 5個、シアノ基1もしくは2個、ニトロ基1もしくは2個、 $C_1 - C_4$ アルキル基1 ~ 3個、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル基1 ~ 3個、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基1 ~ 3個または $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ基1 ~ 3個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているベンジル、あるいは

50

ハロゲン原子 1 ~ 5 個、シアノ基 1 もしくは 2 個、ニトロ基 1 もしくは 2 個、 $C_1 - C_4$ アルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル基 1 ~ 3 個、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基 1 ~ 3 個または  $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ基 1 ~ 3 個のすべての組み合わせによって、場合によっては置換されているフェニルである]

をもつ化合物、ならびにそれらの農学的および/または薬物学的に許容しうる塩。

【 0 0 7 9 】

9 . 2 - [ ( 4 , 4 , 3 - トリフルオロ - 3 - ブテニル ) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン ; および

2 - [ ( ブロモジフルオロメチル ) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン

からなる群から選ばれる、第 8 項記載の化合物。

【 0 0 8 0 】

1 0 . 2 - [ ( ジフルオロメチル ) チオ ] チアゾロ [ 4 , 5 - b ] ピリジン。

---

フロントページの続き

(72)発明者 ウィリアム・ウエイクフィールド・ウツド  
アメリカ合衆国ニュージャージー州 0 8 5 3 4 ペニントン・ワシントンクロツシング - ペニントン  
ロード 1 0 9

審査官 大宅 郁治

(56)参考文献 特表平 8 - 5 0 4 1 8 5 ( J P , A )  
国際公開第 9 4 / 0 6 7 8 3 ( W O , A 1 )  
特開昭 6 0 - 1 0 4 0 6 7 ( J P , A )  
特表平 1 0 - 5 0 8 2 8 5 ( J P , A )

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)  
C07D 513/04  
CA/REGISTRY(STN)