

【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23年8月4日(2011.8.4)

【公表番号】特表2010-531893(P2010-531893A)

【公表日】平成22年9月30日(2010.9.30)

【年通号数】公開・登録公報2010-039

【出願番号】特願2010-515096(P2010-515096)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/42 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/14 (2006.01)

C 0 7 D 261/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/42

A 6 1 P 33/00 1 7 1

A 6 1 P 33/14

C 0 7 D 261/04

C 0 7 D 417/12

A 6 1 K 31/427

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/4439

【手続補正書】

【提出日】平成23年6月14日(2011.6.14)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 2 7 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 2 7 5】

試験 D

ネコノミ(Ctenocephalides felis)の防除を評価するために、試験化合物をプロピレングリコール/グリセロールホルマール(60:40)中に可溶化させ、次にウシの血液中に希釈して、30ppmの最終試験率にした。処置し血液を管に入れ、管の底部を膜で被覆した。約10匹の成虫ネコノミに、膜を通して、処置した血液を摂取させた。次に、72時間後の死亡率について成虫ノミを評価した。

試験した化合物のうち、以下の化合物は、少なくとも50%の死亡率をもたらした：1、2、3、5、6、7、8、9および10。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 2 7 6

【補正方法】変更

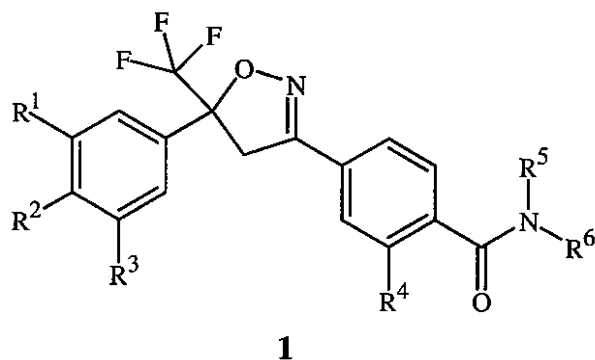
【補正の内容】

【0 2 7 6】

以下、本発明を要約すると下記のとおりである。

## 1. 殺虫的に有効な量の式 1

## 【化 6】



[ 式中、

$R^1$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり、

$R^2$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたはシアノであり、

、

$R^3$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり、

$R^4$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり、

$R^5$ は、H、 $CH_3$ 、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルまたは $CH_2O$  ( $C_1 \sim C_3$ アルキル)であり、

$R^6$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルもしくは $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル (各基は1個の $R^7$ で置換されている)であるか、または $R^6$ は $(CH_2)_m Q$ であり、

$Q$ は、環員として炭素原子および1個のOまたは $S(O)_n$ を含有する4員～6員飽和環であり、場合により1個または2個の $R^{8a}$ および1個の $R^{8b}$ によって置換されていてもよく、

$R^7$ は、 $OR^9$ 、 $S(O)_n R^{10}$ もしくは $C(O)NR^{11}R^{12}$ であるか、または $R^7$ は、場合により1個もしくは2個の $R^{15}$ によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、

$R^{8a}$ はそれぞれ独立して、ハロゲン、シアノまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり、

$R^{8b}$ は、 $OR^9$ 、 $S(O)_n R^{10}$ または $C(O)NR^{11}R^{12}$ であり、

$R^9$ は、H、 $CHO$ 、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニルもしくは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであるか、または $R^9$ は、場合により1個の $R^{13}$ によってそれぞれ置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであるか、または $R^9$ は、場合により1個もしくは2個の $R^{15}$ によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、

$R^{10}$ は、場合により1個の $R^{13}$ によってそれぞれ置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであるか、または $R^{10}$ は、場合により1個もしくは2個の $R^{15}$ によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、

$R^{11}$ は、H、 $CHO$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $CH_2O$  ( $C_1 \sim C_3$ アルキル)、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり、

$R^{12}$ は、場合により1個の $R^{13}$ によってそれぞれ置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであるか、または $R^{12}$ は、H、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルもしくは $OR^{14}$ であり、

$R^{13}$ は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、OH、 $OR^{14}$ もしくは $S(O)_n R^{16}$ であるか、または $R^{13}$ は、場合により1個もしくは2個の $R^{15}$

によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、

$R^{14}$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり、

$R^{15}$ はそれぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり、

$R^{16}$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり、

$m$ は0または1であり、そして

$n$ は0、1または2である]

の化合物、そのN-オキシドまたはその塩を動物に経口的または非経口的に投与することを含む、寄生性無脊椎有害生物から動物を保護するための方法。

2.  $R^4$ がClまたは $CH_3$ であり、

$R^5$ がHであり、

$R^6$ が、1個の $R^7$ により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、そして

$R^7$ が、 $OR^9$ 、 $S(O)_n R^{10}$ または $C(O)NR^{11}R^{12}$ である

上記1に記載の方法。

3.  $R^1$ がCl、Br、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ または $OCH_2CF_3$ であり、

$R^2$ がHであり、そして

$R^3$ がH、F、Cl、Brまたは $CF_3$ である

上記2に記載の方法。

4.  $R^4$ が $CH_3$ であり、そして

$R^7$ が $C(O)NR^{11}R^{12}$ である

上記3に記載の方法。

5.  $R^1$ が $CF_3$ であり、そして

$R^3$ がCl、Brまたは $CF_3$ である

上記4に記載の方法。

6.  $R^{11}$ がHであり、そして

$R^{12}$ が $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである

上記4に記載の方法。

7.  $R^{11}$ がHであり、そして

$R^{12}$ がシクロプロピルまたはシクロプロピルメチルである

上記4に記載の方法。

8. 殺虫的に有効な量の式1の化合物が経口投与される上記1に記載の方法。

9. 殺虫的に有効な量の式1の化合物が非経口投与される上記1に記載の方法。

10. 殺虫的に有効な量の式1の化合物が注射により投与される上記9に記載の方法

。

11. 保護すべき動物が哺乳類である上記1に記載の方法。

12. 保護すべき哺乳類が家畜である上記11に記載の方法。

13. 保護すべき哺乳類がイヌ科の動物である上記11に記載の方法。

14. 保護すべき哺乳類がネコ科の動物である上記11に記載の方法。

15. 寄生性無脊椎有害生物が外部寄生生物である上記1に記載の方法。

16. 寄生性無脊椎有害生物が節足動物である上記1に記載の方法。

17. 寄生性無脊椎有害生物が、ハエ、蚊、ダニ、マダニ、シラミ、ノミ、カメムシ目またはウジである上記1に記載の方法。

18. 保護すべき動物がネコまたはイヌであり、寄生性無脊椎有害生物がノミ、マダニまたはダニである上記17に記載の方法。

【手続補正3】

【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

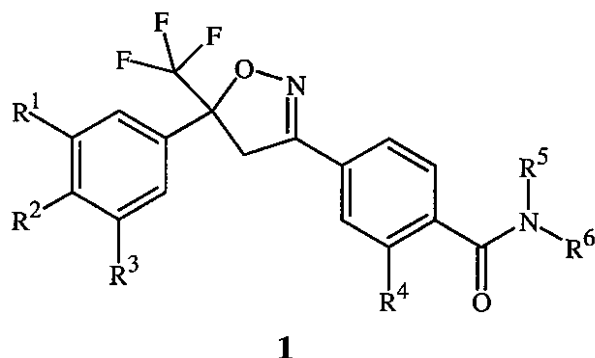
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

殺虫的に有効な量の式 1

## 【化 1】



[ 式中、

R<sup>1</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルコキシであり、R<sup>2</sup>は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキルまたはシアノであり、

、

R<sup>3</sup>は、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルコキシであり、R<sup>4</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルコキシであり、R<sup>5</sup>は、H、CH<sub>3</sub>、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシカルボニルまたはCH<sub>2</sub>O (C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル)であり、R<sup>6</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルもしくはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル (各基は1個のR<sup>7</sup>で置換されている)であるか、またはR<sup>6</sup>は(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>Qであり、Qは、環員として炭素原子および1個のOまたはS(O)<sub>n</sub>を含有する4員～6員飽和環であり、場合により1個または2個のR<sup>8a</sup>および1個のR<sup>8b</sup>によって置換されていてもよく、R<sup>7</sup>は、OR<sup>9</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>もしくはC(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>であるか、またはR<sup>7</sup>は、場合により1個もしくは2個のR<sup>15</sup>によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、R<sup>8a</sup>はそれぞれ独立して、ハロゲン、シアノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり、R<sup>8b</sup>は、OR<sup>9</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>またはC(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>であり、R<sup>9</sup>は、H、CHO、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルカルボニルもしくはC<sub>2</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシカルボニルであるか、またはR<sup>9</sup>は、場合により1個のR<sup>13</sup>によってそれぞれ置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルであるか、またはR<sup>9</sup>は、場合により1個もしくは2個のR<sup>15</sup>によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、R<sup>10</sup>は、場合により1個のR<sup>13</sup>によってそれぞれ置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルであるか、またはR<sup>10</sup>は、場合により1個もしくは2個のR<sup>15</sup>によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、R<sup>11</sup>は、H、CHO、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、CH<sub>2</sub>O (C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル)、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルカルボニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシカルボニルであり、R<sup>12</sup>は、場合により1個のR<sup>13</sup>によってそれぞれ置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルもしくはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであるか、またはR<sup>12</sup>は、H、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>6</sub>アルキニルもしくはOR<sup>14</sup>であり、R<sup>13</sup>は、シアノ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、OH、OR

$R^{14}$  もしくは  $S(O)_n R^{16}$  であるか、または  $R^{13}$  は、場合により 1 個もしくは 2 個の  $R^{15}$  によってそれぞれ置換されていてもよいピリジンもしくはチアゾールであり、

$R^{14}$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルであり、

$R^{15}$  はそれぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_3$  ハロアルコキシであり、

$R^{16}$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルであり、

$m$  は 0 または 1 であり、そして

$n$  は 0、1 または 2 である]

の化合物、その N - オキシドまたはその塩を動物に経口的または非経口的に投与することを含む、寄生性無脊椎有害生物から動物を保護するための方法。

【請求項 2】

$R^4$  が  $Cl$  または  $CH_3$  であり、

$R^5$  が  $H$  であり、

$R^6$  が、1 個の  $R^7$  により置換された  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、そして

$R^7$  が、 $OR^9$ 、 $S(O)_n R^{10}$  または  $C(O)NR^{11}R^{12}$  である

請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

$R^1$  が  $Cl$ 、 $Br$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$  または  $OCH_2CF_3$  であり、

$R^2$  が  $H$  であり、そして

$R^3$  が  $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $CF_3$  である

請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

$R^4$  が  $CH_3$  であり、そして

$R^7$  が  $C(O)NR^{11}R^{12}$  である

請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

$R^1$  が  $CF_3$  であり、そして

$R^3$  が  $Cl$ 、 $Br$  または  $CF_3$  である

請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

$R^{11}$  が  $H$  であり、そして

$R^{12}$  が  $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルである

請求項 4 に記載の方法。

【請求項 7】

$R^{11}$  が  $H$  であり、そして

$R^{12}$  がシクロプロピルまたはシクロプロピルメチルである

請求項 4 に記載の方法。

【請求項 8】

殺虫的に有効な量の式 1 の化合物が経口投与される請求項 1 に記載の方法。

【請求項 9】

殺虫的に有効な量の式 1 の化合物が非経口投与される請求項 1 に記載の方法。

【請求項 10】

殺虫的に有効な量の式 1 の化合物が注射により投与される請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

保護すべき哺乳類がイヌ科の動物である請求項 1 に記載の方法。

【請求項 12】

保護すべき哺乳類がネコ科の動物である請求項 1 に記載の方法。

【請求項 13】

保護すべき動物がネコまたはイヌであり、寄生性無脊椎有害生物がノミ、マダニまたはダニである請求項 1 に記載の方法。