

【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 26 年 1 月 9 日 (2014.1.9)

【公表番号】特表 2013-514978 (P2013-514978A)

【公表日】平成 25 年 5 月 2 日 (2013.5.2)

【年通号数】公開・登録公報 2013-021

【出願番号】特願 2012-544848 (P2012-544848)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 P 33/14 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

A 0 1 P 7/02 (2006.01)

A 0 1 P 7/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 A

C 0 7 D 471/04 C S P

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Q

A 6 1 K 31/437

A 6 1 P 33/14

A 6 1 P 33/00 1 7 1

A 0 1 N 43/90 1 0 2

A 0 1 N 43/90 1 0 3

A 0 1 P 7/02

A 0 1 P 7/04

【手続補正書】

【提出日】平成 25 年 11 月 14 日 (2013.11.14)

【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

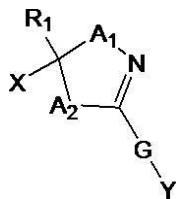
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) のジヒドロアゾール化合物、又は薬学的若しくは農業的に許容されるその塩

【化 1】



(I)

(式中、

R₁ が、水素、ハロゲン、-CN、又は、各々が、置換されていないか、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、アルキル - 若しくはジ(アルキル)アミノ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、R₇S(O)-、R₇S(O)

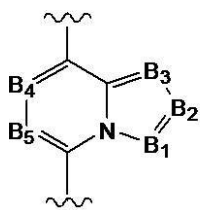
$_2$ -、 $R_7C(O)-$ 、 $R_7R_8NC(O)-$ 、 $R_7OC(O)-$ 、 $R_7C(O)O-$ 、 $R_7C(O)NR_8-$ 、 $-CN$ 又は $-NO_2$ のうちの1又は2以上で置換されているアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル又はシクロアルキルアルキルであり、

Xが、置換されていないか、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、アルキル - 若しくはジ(アルキル)アミノ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、 $R_7S(O)-$ 、 $R_7S(O)_2-$ 、 $R_7C(O)-$ 、 $R_7R_8NC(O)-$ 、 $R_7OC(O)-$ 、 $R_7C(O)O-$ 、 $R_7C(O)NR_8-$ 、 $-CN$ 又は $-NO_2$ のうちの1又は2以上により置換されていてよいアリール又はヘテロアリールであり、

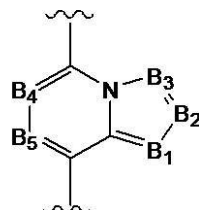
A_1 及び A_2 が、独立して、酸素、 NR_2 又は CR_7R_8 であり、

Gが、G - 1又はG - 2：

【化2】



G-1



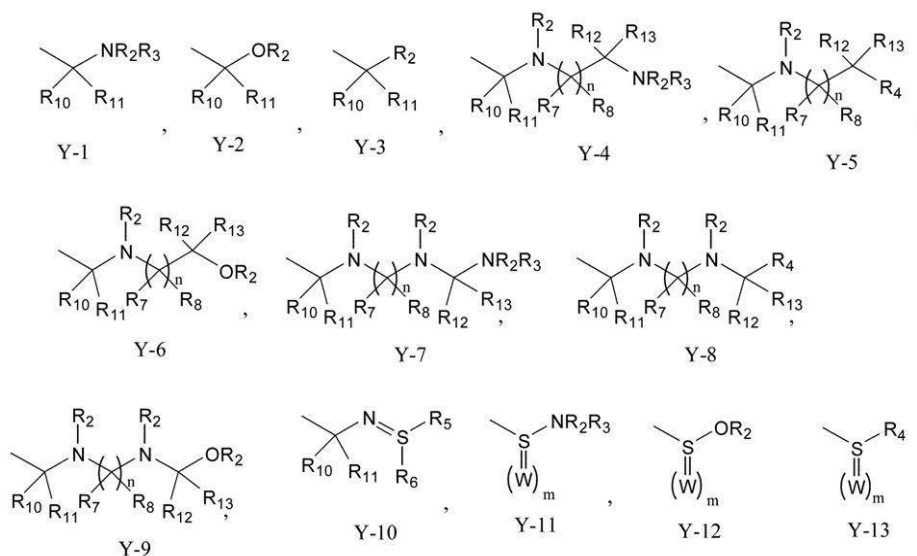
G-2

であり、

B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 及び B_5 が、独立して、N又はC - R_9 であり、

Yが、水素、ハロゲン、 $-CN$ であるか、Yは、各々が、置換されていないか、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、アルキル - 若しくはジ(アルキル)アミノ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、 $R_7S(O)-$ 、 $R_7S(O)_2-$ 、 $R_7C(O)-$ 、 $R_7R_8NC(O)-$ 、 $R_7OC(O)-$ 、 $R_7C(O)O-$ 、 $R_7C(O)NR_8-$ 、 $-CN$ 又は $-NO_2$ のうちの1又は2以上で置換されているアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、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、又はヘテロシクリル若しくはヘテロアリールであるか、Yは、Y - 1、Y - 2、Y - 3、Y - 4、Y - 5、Y - 6、Y - 7、Y - 8、Y - 9、Y - 10、Y - 11、Y - 12又はY - 13；

【化3】



であり、

R_2 、 R_3 が、独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、チオアルキル、アルキルチオアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、 $R_{10}S(O)-$ 、 $R_{10}S(O)_2-$ 、 $R_{10}C(O)-$ 、 $R_{10}C(S)-$ 、 $R_{10}R_{11}NC(O)-$ 、 $R_{10}R_{11}NC(S)-$ 、 $R_{10}OC(O)-$ であり、

R_4 、 R_5 及び R_6 が、独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、チオアルキル、アルキルチオアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、アリーール又はヘテロアリーールであり、

R_7 及び R_8 が、独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、チオアルキル、アルキルチオアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル又はハロアルキニルであり、

R_9 が、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、又は、各々が、置換されていないか、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、アルキル - 若しくはジ(アルキル)アミノ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、 $R_7S(O)-$ 、 $R_7S(O)_2-$ 、 $R_7C(O)-$ 、 $R_7R_8NC(O)-$ 、 $R_7OC(O)-$ 、 $R_7C(O)O-$ 、 $R_7C(O)NR_8-$ 、 $-CN$ 又は $-NO_2$ のうちの 1 又は 2 以上で置換されているアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル又はシクロアルキルアルキルであり、

R_{10} 、 R_{11} 、 R_{12} 及び R_{13} が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、チオアルキル、アルキルチオアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル又はハロアルキニルであるか、

R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成するか、

R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、

W が、 O 、 S 又は NR_2 であり、

n が、1 ~ 4 であり、

m が、0、1 又は 2 である)。

【請求項 2】

G が、 $G-1$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

G が、 $G-2$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

G が、 $G-1$ であり、

A_1 が、酸素であり、

X が、置換されていてもよいアリーールである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

G が、 $G-2$ であり、

A_1 が、酸素であり、

X が、置換されていてもよいアリーールである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

A_1 が、酸素であり、

X が、置換されていてもよいアリーールであり、

R_1 が、水素、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、

Y が、 $Y-1$ 、 $Y-2$ 、 $Y-3$ 、 $Y-4$ 、 $Y-5$ 、 $Y-6$ 、 $Y-7$ 、 $Y-8$ 、 $Y-9$ 、 $Y-10$ 、 $Y-11$ 、 $Y-12$ 又は $Y-13$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

A_1 が、酸素であり、

X が、置換されていてもよいアリールであり、
R₁ が、水素、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、
Y が、ピラゾリル又はトリアゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

G が、G - 1 であり、
B₁、B₂、B₃、B₄ 及び B₅ が、各々 C - R₉ であり、
R₁ が、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルであり、
X が、置換されていないか 1 又は 2 以上のハロゲン、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルにより置換されていてよいフェニルであり、
A₁ が、酸素であり、
A₂ が、C R₇ R₈ であり、
Y が、Y - 1、Y - 4、Y - 5 又は Y - 6 であり、
R₂ 及び R₄ が、独立して、水素、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ ハロアルキル、C₁ - C₄ アルコキシ - C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ アルキルチオ - C₁ - C₄ アルキルであり、
R₃ 及び R₉ が、独立して、水素、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

G が、G - 2 であり、
B₁、B₂、B₃、B₄ 及び B₅ が、各々 C - R₉ であり、
R₁ が、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルであり、
X が、置換されていないか、1 又は 2 以上のハロゲン、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルにより置換されていてよいフェニルであり、
A₁ が、酸素であり、
A₂ が、C R₇ R₈ であり、
Y が、Y - 1、Y - 4、Y - 5 又は Y - 6 であり、
R₂ 及び R₄ が、独立して、水素、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ ハロアルキル、C₁ - C₄ アルコキシ - C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ アルキルチオ - C₁ - C₄ アルキルであり、
R₃ 及び R₉ が、独立して、水素、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

G が、G - 1 であり、
B₁、B₂、B₄ 及び B₅ が、各々 C - R₉ であり、
B₃ が、N であり、
R₁ が、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルであり、
X が、置換されていないか、1 又は 2 以上のハロゲン、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルにより置換されていてよいフェニルであり、
A₁ が、酸素であり、
A₂ が、C R₇ R₈ であり、
Y が、Y - 1、Y - 4、Y - 5 又は Y - 6 であり、
R₂ 及び R₄ が、独立して、水素、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ ハロアルキル、C₁ - C₄ アルコキシ - C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ アルキルチオ - C₁ - C₄ アルキルであり、
R₃ 及び R₉ が、独立して、水素、C₁ - C₄ アルキル又は C₁ - C₄ ハロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

G が、G - 2 であり、
B₂、B₃、B₄ 及び B₅ が、各々 C - R₉ であり、
B₁ が、N であり、

R_1 が、 $C_1 - C_4$ アルキル又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 X が、置換されていないか、1又は2以上のハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルにより置換されていてよいフェニルであり、
 A_1 が、酸素であり、
 A_2 が、 CR_7R_8 であり、
 Y が、 $Y-1$ 、 $Y-4$ 、 $Y-5$ 又は $Y-6$ であり、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ- $C_1 - C_4$ アルキル又は $C_1 - C_4$ アルキルチオ- $C_1 - C_4$ アルキルであり、
 R_3 及び R_9 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項8に記載の化合物。

【請求項13】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項9に記載の化合物。

【請求項14】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項8に記載の化合物。

【請求項15】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項9に記載の化合物。

【請求項16】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、水素である、請求項8に記載の化合物。

【請求項17】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、

R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 18】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 19】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 20】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、各々水素である、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 21】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、水素である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 22】

A_2 が、 CH_2 であり、
 R_9 が、水素であり、
 R_{10} が、 R_{11} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_{12} が、 R_{13} と一緒に、 $=O$ 、 $=S$ 又は $=NR_2$ を形成し、
 R_2 及び R_4 が、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、
 R_3 、 R_7 及び R_8 が、水素である、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 23】

動物において寄生生物の感染又は侵襲を治療又は予防するための組成物であって、薬学的に許容される担体との組合せで有効量の請求項 1 ~ 22 のいずれかに記載の化合物を含む組成物。

【請求項 24】

有害生物から作物、植物、植物繁殖材料又は木材でできている材料を保護するための組成物であって、農業的に許容される担体又は希釈剤との組合せで殺虫に有効な量の請求項 1 ~ 22 のいずれかに記載の化合物を含む組成物。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の化合物を含む、動物における寄生生物の感染又は侵襲の治療若しくは予防剤。

【請求項 2 6】

動物（但し、ヒトを除く）において寄生生物の感染又は侵襲を治療又は予防するための方法であって、殺寄生生物に有効な量の請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の化合物を前記動物（但し、ヒトを除く）に投与することを含む方法。

【請求項 2 7】

動物有害生物による攻撃又は侵襲から作物及び成育している植物を保護するための方法であって、植物、又は植物が成育している土壌若しくは水を、請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の化合物と接触させることを含む方法。

【請求項 2 8】

非ヒト動物の場所（locus）において動物有害生物の侵襲を予防又は防除するための方法であって、前記非ヒト動物の場所に、殺有害生物に有効な量又は殺寄生生物に有効な量の請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の化合物を投与することを含む方法。

【請求項 2 9】

動物（但し、ヒトを除く）における寄生生物の感染又は侵襲の治療又は予防における、請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 3 0】

動物における寄生生物の感染又は侵襲を治療又は予防するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の化合物の使用。