

【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21年3月12日 (2009.3.12)

【公表番号】特表2008-530159(P2008-530159A)

【公表日】平成20年8月7日 (2008.8.7)

【年通号数】公開・登録公報2008-031

【出願番号】特願2007-555514(P2007-555514)

【国際特許分類】

A 0 1 N 43/40 (2006.01)

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

A 0 1 N 43/42 (2006.01)

A 0 1 N 47/02 (2006.01)

A 0 1 N 43/54 (2006.01)

A 0 1 N 43/60 (2006.01)

A 0 1 N 43/58 (2006.01)

A 0 1 P 7/00 (2006.01)

A 0 1 P 7/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

C 0 7 D 211/74 (2006.01)

A 6 1 K 31/45 (2006.01)

C 0 7 D 211/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

C 0 7 D 451/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/46 (2006.01)

C 0 7 D 217/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 P 33/14 (2006.01)

【 F I 】

A 0 1 N 43/40 1 0 1 P

A 0 1 N 43/90 1 0 2

A 0 1 N 43/40 1 0 1 Q

A 0 1 N 43/42

A 0 1 N 43/42 1 0 2

A 0 1 N 47/02

A 0 1 N 43/54 B

A 0 1 N 43/54 A

A 0 1 N 43/60

A 0 1 N 43/58 A

A 0 1 N 43/54 D

A 0 1 P 7/00

A 0 1 P 7/04

C 0 7 D 471/10

A 6 1 K 31/438

C 0 7 D 211/74

A 6 1 K 31/45

C 0 7 D 211/46

A 6 1 K 31/445
 C 0 7 D 451/06
 A 6 1 K 31/46
 C 0 7 D 217/04
 A 6 1 K 31/47
 C 0 7 D 401/04
 A 6 1 K 31/4725
 A 6 1 P 33/14

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月23日(2009.1.23)

【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

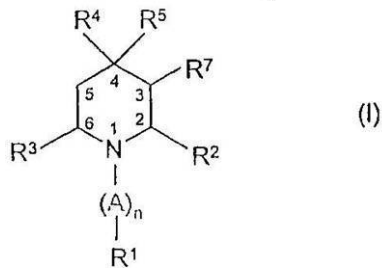
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

害虫を防除するための式 (I) の置換ピペリジン誘導体、又は殺虫剤として許容可能なそれらの塩の使用。

【化 1】



(式中、

Aは、直鎖又は分枝の (C₁ - C₃) - アルキレン又は (C₁ - C₃) - ハロアルキレンであり、

R¹ は、非置換、又はハロゲン、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、CN、NO₂、S(O)_p R^{1 2} 及び NR^{1 3} R^{1 4} からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された (C₆ - C₁₄) - アリールであり、或いは

非置換、又はハロゲン、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、CN、NO₂、S(O)_p R^{1 2}、NR^{1 3} R^{1 4}、OH及びオキソからなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルケニルであり、或いは

非置換、又はハロゲン、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、CN、NO₂、S(O)_p R^{1 2}、OH及びオキソからなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されたヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、

R² 及び R³ は、それぞれ独立に、H又は (C₁ - C₃) - アルキルであり、或いは

R^2 及び R^3 は、一緒になって、 $(C_1 - C_6)$ - アルキレンブリッジを形成することができ、

R^4 及び R^5 は、それぞれ独立に、 H 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル又は $(C_1 - C_6)$ - アルコキシであり、 R^4 及び R^5 が、それぞれ独立に、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル又は $(C_1 - C_6)$ - アルコキシである場合、両基は、一緒になって、ピペリジン環の 4 位 ($C-4$) にある炭素原子と共に 4～7 員環を形成することができ、

残基は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されていてもよく、或いは

R^4 が、 H 又は $(C_1 - C_6)$ - アルキルである場合、 R^5 は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された OH 、 $OCOR^8$ 、 $OCOOR^9$ 、 $OCO-COO(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $COO(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $COOH$ 、 CH_2 フェニルであってもよく、或いは

R^5 が、結合電子対である場合、 R^4 は、 R^5 と一緒になって、 O 、 S 、 $N-OH$ 、 $N-O-(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $N-O-CO-R^8$ 、 $N-O-COOR^9$ からなる群から選択される残基 X を形成してもよく、

R^7 は、 H 、或いは非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_2 - C_4)$ - アルケニルであり、或いは残基

R^7 及び R^5 、及びピペリジン環の 3 位 ($C-3$) 及び 4 位 ($C-4$) の炭素は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルケニル又は $(C_6 - C_{14})$ - アリール残基を形成し、

R^8 は、 H 、或いは非置換、又はハロゲン、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 OH 、 CN 、 NO_2 、 R^{10} 、 R^{11} 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル又は $(C_1 - C_6)$ - アルキルであり、

R^9 は、 H 、或いは非置換、又はハロゲン、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 OH 、 CN 、 NO_2 、 R^{10} 、 R^{11} 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された $(C_3 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル又は $(C_1 - C_6)$ - アルキルであり、

R^{10} は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された $(C_6 - C_{14})$ - アリールであり、

R^{11} は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 、 OH 及び オキソからなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された飽和又は不飽和複素環式芳香族ラジカル又はヘテロシクリルラジカルであり、

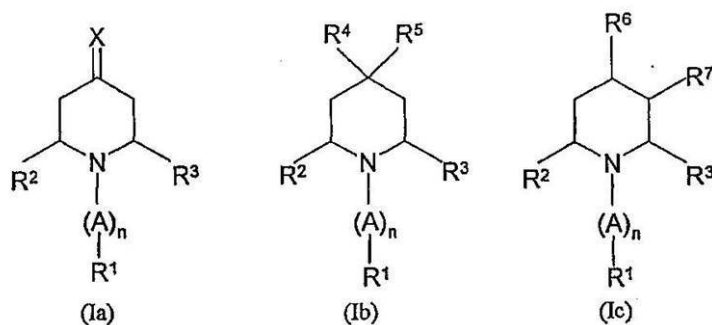
R^{12} は、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル又は $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキルであり、
 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立に、H、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル又は $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル - $(C_1 - C_6)$ - アルキルであり、或いは R^{13} 及び R^{14} は、N と一緒になって、1 個又は 2 個の更なるヘテロ原子を含有していてもよい 4 から 8 員のヘテロアリール又はヘテロシクリル環を形成する基であり、

n は、0 又は 1 であり、 p は、0、1 又は 2 である。）

【請求項 2】

式 (I a)、(I b) 及び (I c) のピペリジン誘導体、又はその殺虫剤として許容可能な塩を、害虫を防除するために使用する請求項 1 に記載の化合物の使用。

【化 2】



(式中、

A は、非分枝又は分枝の $(C_1 - C_3)$ - アルキレン、且つ／又は

R^1 は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、CN、 NO_2 、 $S(O)_p$ 、 R^{12} 及び $NR^{13}R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されたフェニルであり、或いは

$(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキルエニルであり、或いは

非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、CN、 NO_2 、 $S(O)_p$ 、 R^{12} 、OH 及びオキソからなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されたヘテロアリール、例えばピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジンであり、且つ／又は

R^2 、 R^3 は、それぞれ独立に、H、 $(C_1 - C_3)$ - アルキルであり、 R^2 及び R^3 は、一緒になって、トロパン環系が生成されるように $(C_1 - C_3)$ - アルキレンブリッジ、特に $-C_2H_4-$ 基を形成することができ、

且つ／又は式 (I b) において、

R^4 、 R^5 は、それぞれ独立に、H、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシであり、或いは R^4 及び R^5 が、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル又は $(C_1 - C_6)$ - アルコキシである場合、両基は、ピペリジン環の C-4 と一緒になって、4 ~ 7 員環を形成することができ、

且つ／又は式 (I c) において、

R^6 は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、CN、 NO_2 、 $S(O)_p$ 、 R^{12} 及び $NR^{13}R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された OH、 $OCOR^8$ 、 $OCOOR^9$ 、 $OCO-COO(C_1 - C_4)$ - アルキ

ル、 $\text{COO}(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - アルキル、 COOH 又は CH_2 フェニルであり、
且つ／又は

R^7 は、 H 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ - アルキルであり、或いは

R^7 及び R^6 、及びピペリジン環の 3 位 ($\text{C} - 3$) 及び 4 位 ($\text{C} - 4$) の炭素原子は、一緒になって、非置換、又はハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^{12}$ 及び $\text{NR}^{13} \text{R}^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された 5 から 7 員のシクロアルキル又はシクロアルケニル環、又は 6 から 14 員の芳香族環を形成し、

且つ／又は式 (I a) において、

X は、 O 、 S 、 N-OH 、 $\text{N-O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 N-O-CO-R^8 、 N-O-COOR^9 であり、

R^8 は、 H 、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - ハロアルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルキニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - ハロアルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル又は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキルであり、最後に言及されている基は、非置換、又はハロゲン、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ - シクロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキルチオ、 OH 、 CN 、 NO_2 、 R^{10} 、 R^{11} 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^{12}$ 及び $\text{NR}^{13} \text{R}^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されており、

R^9 は、 H 、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - アルケニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - ハロアルケニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - アルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - ハロアルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル又は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキルであり、最後に言及されている基は、非置換、又はハロゲン、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ - シクロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキルチオ、 OH 、 CN 、 NO_2 、 R^{10} 、 R^{11} 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^{12}$ 及び $\text{NR}^{13} \text{R}^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されており、

R^{10} は、非置換、又はハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^{12}$ 及び $\text{NR}^{13} \text{R}^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されたフェニルであり、

R^{11} は、非置換、又はハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^{12}$ 、 OH 及びオキソからなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された飽和、不飽和又は複素環式芳香族ヘテロシクリルラジカルであり、

R^{12} は、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル又は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキルであり、

R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立に、 H 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ - シクロアルキル又は $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ - シクロアルキル - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキルであり、或いは R^{13} 及び R^{14} は、 N と一緒になって、 N 、 O 、 S からなる群から選択される 1 個又は 2 個の更なるヘテロ原子を含有していてもよい 4 から 8 員のヘテロアール又はヘテロシクリル環を形成し、

n は、0 又は 1 であり、

p は、0、1 又は 2 である。)

【請求項 3】

A は、直鎖又は分枝の $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ - アルキレンであり、

R^1 は、非置換、又はハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^{12}$ 及び $\text{NR}^{13} \text{R}^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されたフェニルであり、或いは

$(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ - シクロアルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ - シクロアルキルエニルであり、或いは

非置換、又はハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、(

$C_1 - C_6$)-アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 、 OH 及びオキソからなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されたピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジンであり、

R^2 及び R^3 は、それぞれ独立に、 H 又は CH_3 であり、或いは

R^2 及び R^3 が、ともに CH_3 である場合、これらのメチル基は、結合されて、 $-C_2H_4-$ 基を形成してもよく、

R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は、請求項1に定められている通りであり、

n は、0 又は 1 であり、 p は、0、1 又は 2 である、請求項1 又は 2 に記載の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩の使用。

【請求項4】

R^4 及び R^5 は、それぞれ独立に、 H 、 $(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $(C_1 - C_6)$ -アルコキシであり、或いは

R^4 及び R^5 が、 $(C_1 - C_6)$ -アルキル又は $(C_1 - C_6)$ -アルコキシである場合、両基は、ピペリジン環の $C-4$ と一緒になって、4～7員環を形成することができる、請求項2 又は 3 に記載の式 (I b) の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩の使用。

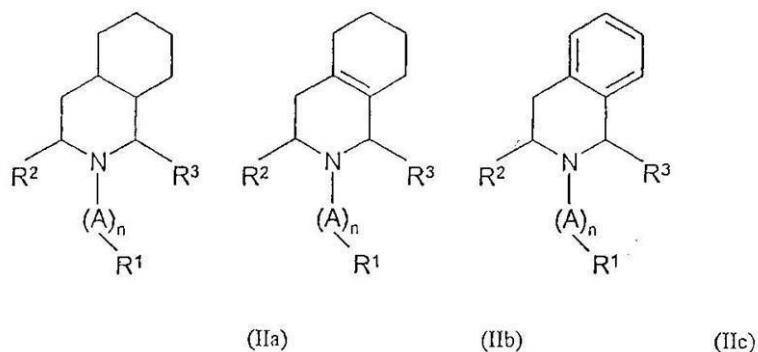
【請求項5】

R^6 は、 OH 、 $OCOR^8$ 、 $OCOOR^9$ 、 $COO(C_1 - C_4)$ -アルキルであり、

R^7 は、 H 、又は

R^7 は、 R^6 、並びにピペリジン環の $C-3$ 及び $C-4$ と一緒になって、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13}R^{14}$ からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されている飽和又は不飽和の6員環を形成して、式 (IIa) 及び (IIb) 及び (IIc) :

【化3】



の化合物を生成し、

R^1 、 R^2 、 R^3 及び A は、請求項2に定められている通りであり、

R^8 、 R^9 、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は、請求項1に定められている通りであり、

n は、0 又は 1 であり、 p は、0、1 又は 2 である、請求項2 又は 3 に記載の式 (I c) の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩の使用。

【請求項6】

X は、 O である、請求項2 又は 3 に記載の式 (I c) の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩の使用。

【請求項7】

節足動物害虫及び／又は蠕虫害虫を防除するための請求項1～6のいずれかに記載の式 (I) の置換ピペリジン誘導体、又はその殺虫剤として許容可能な塩の使用。

【請求項8】

昆虫、クモ類及び／又は線虫を防除するための請求項 1～6 のいずれかに記載の式 (I) の置換ピペリジン誘導体、又はその殺虫剤として許容可能な塩の使用。

【請求項 9】

家畜又は家庭動物における外部寄生生物撲滅剤として使用される殺虫剤としての請求項 1～6 のいずれかに記載の式 (I) の置換ピペリジン誘導体、又はその殺虫剤として許容可能な塩の使用。

【請求項 10】

害虫を防除するための、殺虫剤として許容可能な希釈剤又は担体及び／又は界面活性剤とともに請求項 1～6 のいずれかに記載の式 (I) の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩を含む殺虫剤組成物の使用。

【請求項 11】

獣医医薬品を調製するための、請求項 1～6 のいずれかに記載の式 (I) の置換ピペリジン誘導体の使用。

【請求項 12】

害虫を防除するための獣医医薬品を調製するための請求項 11 に記載の式 (I) の置換ピペリジン誘導体の使用。

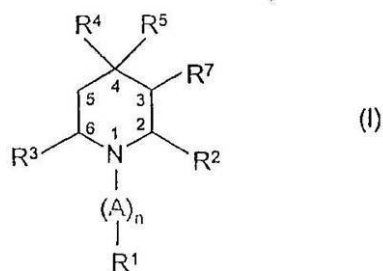
【請求項 13】

害虫を防除するための請求項 1～6 のいずれかに記載の式 (I) の少なくとも 1 つの化合物又はその塩、或いは請求項 10 に記載の組成物、或いは請求項 11 又は 12 に記載の獣医医薬品の適用を含む、ある場所で害虫を防除するための方法。

【請求項 14】

式 (I) の置換ピペリジン誘導体、又は殺虫剤として許容可能なそれらの塩を含む害虫防除剤。

【化 4】



(式中、

A は、直鎖又は分枝の $(C_1 - C_3)$ -アルキレン又は $(C_1 - C_3)$ -ハロアルキレンであり、

R^1 は、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された $(C_6 - C_{14})$ -アリールであり、或いは

非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 、 $NR^{13} R^{14}$ 、OH 及びオキソからなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された $(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $(C_3 - C_7)$ -シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ -シクロアルケニルであり、或いは

非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 NO_2 、 $S(O)$

p $R^{1,2}$ 、OH及びオキソからなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されたヘテロシクリル又はヘテロアリールであり、

R^2 及び R^3 は、それぞれ独立に、H又は (C_1-C_3) -アルキルであり、或いは R^2 及び R^3 は、一緒になって、 (C_1-C_6) -アルキレンブリッジを形成することができ、

R^4 及び R^5 は、それぞれ独立に、H、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル又は (C_1-C_6) -アルコキシであり、 R^4 及び R^5 が、それぞれ独立に、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル又は (C_1-C_6) -アルコキシである場合、両基は、一緒になって、ピペリジン環の4位(C-4)にある炭素原子と共に4~7員環を形成することができ、

残基は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂、 $S(O)_p R^{1,2}$ 及びNR^{1,3}R^{1,4}からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されていてもよく、或いは

R^4 が、H又は (C_1-C_6) -アルキルである場合、 R^5 は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂、 $S(O)_p R^{1,2}$ 及びNR^{1,3}R^{1,4}からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されたOH、OCOR⁸、OCOOR⁹、OCO-COO(C₁-C₄)-アルキル、COO(C₁-C₄)-アルキル、COOH、CH₂フェニルであってもよく、或いは

R^5 が、結合電子対である場合、 R^4 は、 R^5 と一緒に、O、S、N-OH、N-O-(C₁-C₆)-アルキル、N-O-CO-R⁸、N-O-COOR⁹からなる群から選択される残基Xを形成してもよく、

R^7 は、H、或いは非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂、 $S(O)_p R^{1,2}$ 及びNR^{1,3}R^{1,4}からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された (C_1-C_3) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルケニルであり、或いは残基

R^7 及び R^5 、及びピペリジン環の3位(C-3)及び4位(C-4)の炭素は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂、 $S(O)_p R^{1,2}$ 及びNR^{1,3}R^{1,4}からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された (C_3-C_7) -シクロアルキル、 (C_3-C_7) -シクロアルケニル又は (C_6-C_{14}) -アリール残基を形成し、

R^8 は、H、或いは非置換、又はハロゲン、 (C_3-C_7) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルキルチオ、OH、CN、NO₂、 $R^{1,0}$ 、 $R^{1,1}$ 、 $S(O)_p R^{1,2}$ 及びNR^{1,3}R^{1,4}からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、 (C_3-C_7) -シクロアルキル又は (C_1-C_6) -アルキルであり、

R^9 は、H、或いは非置換、又はハロゲン、 (C_3-C_7) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルキルチオ、OH、CN、NO₂、 $R^{1,0}$ 、 $R^{1,1}$ 、 $S(O)_p R^{1,2}$ 及びNR^{1,3}R^{1,4}からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された (C_3-C_6) -アルケニル、 (C_3-C_6) -アルキニル、 (C_3-C_7) -シクロアルキル又は (C_1-C_6) -アルキルであり、

$R^{1,0}$ は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂、 $S(O)_p R^{1,2}$ 及びNR^{1,3}R^{1,4}からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された (C_6-C_{14}) -アリールであり、

$R^{1,1}$ は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂

、 $S(O)_p R^{12}$ 、OH及びオキソからなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換された飽和又は不飽和複素環式芳香族ラジカル又はヘテロシクリルラジカルであり、

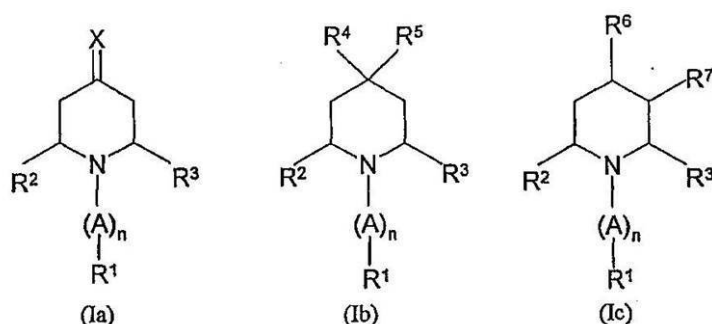
R^{12} は、 (C_1-C_6) -アルキル又は (C_1-C_6) -ハロアルキルであり、 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立に、H、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、 (C_3-C_7) -シクロアルキル又は (C_3-C_7) -シクロアルキル- (C_1-C_6) -アルキルであり、或いは R^{13} 及び R^{14} は、Nと一緒に、1個又は2個の更なるヘテロ原子を含有していてもよい4から8員のヘテロアリール又はヘテロシクリル環を形成する基であり、

n は、0又は1であり、 p は、0、1又は2である。))

【請求項15】

式(Ia)、(Ib)及び(Ic)のピペリジン誘導体、又はその殺虫剤として許容可能な塩を含む、請求項14に記載の害虫防除剤。

【化5】



(式中、

Aは、非分枝又は分枝の (C_1-C_3) -アルキレン、且つ/又は R^1 は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂、 $S(O)_p R^{12}$ 及びNR¹³R¹⁴からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されたフェニルであり、或いは

(C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_3-C_7) -シクロアルキル、 (C_3-C_7) -シクロアルキルエニルであり、或いは非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、CN、NO₂、 $S(O)_p R^{12}$ 、OH及びオキソからなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されたヘテロアリール、例えばピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジンであり、且つ/又は

R^2 、 R^3 は、それぞれ独立に、H、 (C_1-C_3) -アルキルであり、 R^2 及び R^3 は、一緒になって、トロパン環系が生成されるように (C_1-C_3) -アルキレンブリッジ、特に $-C_2H_4-$ 基を形成することができ、

且つ/又は式(Ib)において、

R^4 、 R^5 は、それぞれ独立に、H、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシであり、或いは R^4 及び R^5 が、 (C_1-C_6) -アルキル又は (C_1-C_6) -アルコキシである場合、両基は、ピペリジン環のC-4と一緒に、4~7員環を形成することができ、

且つ/又は式(Ic)において、

R^6 は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された OH 、 $OCOR^8$ 、 $OCOOR^9$ 、 $OCO-COO(C_1-C_4)$ －アルキル、 $COO(C_1-C_4)$ －アルキル、 $COOH$ 又は CH_2 フェニルであり、

且つ／又は

R^7 は、 H 、 (C_1-C_3) －アルキルであり、或いは

R^7 及び R^6 、及びピペリジン環の 3 位 ($C-3$) 及び 4 位 ($C-4$) の炭素原子は、一緒になって、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された 5 から 7 員のシクロアルキル又はシクロアルケニル環、又は 6 から 14 員の芳香族環を形成し、

且つ／又は式 (I a) において、

X は、 O 、 S 、 $N-OH$ 、 $N-O-(C_1-C_6)$ －アルキル、 $N-O-CO-R^8$ 、 $N-O-COOR^9$ であり、

R^8 は、 H 、 (C_2-C_6) －アルケニル、 (C_2-C_6) －ハロアルケニル、 (C_2-C_6) －アルキニル、 (C_2-C_6) －ハロアルキニル、 (C_3-C_7) シクロアルキル又は (C_1-C_6) －アルキルであり、最後に言及されている基は、非置換、又はハロゲン、 (C_3-C_7) －シクロアルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －アルキルチオ、 OH 、 CN 、 NO_2 、 R^{10} 、 R^{11} 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されており、

R^9 は、 H 、 (C_3-C_6) －アルケニル、 (C_3-C_6) －ハロアルケニル、 (C_3-C_6) －アルキニル、 (C_3-C_6) －ハロアルキニル、 (C_3-C_7) シクロアルキル又は (C_1-C_6) －アルキルであり、最後に言及されている基は、非置換、又はハロゲン、 (C_3-C_7) －シクロアルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －アルキルチオ、 OH 、 CN 、 NO_2 、 R^{10} 、 R^{11} 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されており、

R^{10} は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換されたフェニルであり、

R^{11} は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 、 OH 及び オキソからなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカルで置換された飽和、不飽和又は複素環式芳香族ヘテロシクリルラジカルであり、

R^{12} は、 (C_1-C_6) －アルキル又は (C_1-C_6) －ハロアルキルであり、

R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立に、 H 、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_2-C_6) －アルケニル、 (C_2-C_6) －アルキニル、 (C_3-C_7) シクロアルキル又は (C_3-C_7) シクロアルキル－ (C_1-C_6) －アルキルであり、或いは R^{13} 及び R^{14} は、 N と一緒になって、 N 、 O 、 S からなる群から選択される 1 個又は 2 個の更なるヘテロ原子を含有していてもよい 4 から 8 員のヘテロアリール又はヘテロシクリル環を形成し、

n は、0 又は 1 であり、

p は、0、1 又は 2 である。)

【請求項 16】

A は、直鎖又は分枝の (C_1-C_3) －アルキレンであり、

R^1 は、非置換、又はハロゲン、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p R^{12}$ 及び $NR^{13} R^{14}$ からなる群から選択される 1 つ又は複数のラジカル

で置換されたフェニルであり、或いは

$(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ - シクロアルキルエニルであり、或いは

非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p$

$R^{1\ 2}$ 、 OH 及びオキソからなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されたピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジンであり、

R^2 及び R^3 は、それぞれ独立に、 H 又は CH_3 であり、或いは

R^2 及び R^3 が、ともに CH_3 である場合、これらのメチル基は、結合されて、 $-C_2H_4-$ 基を形成してもよく、

$R^{1\ 2}$ 、 $R^{1\ 3}$ 及び $R^{1\ 4}$ は、請求項1に定められている通りであり、

n は、0又は1であり、 p は、0、1又は2である、化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩を含む、請求項14又は15に記載の害虫防除剤。

【請求項17】

R^4 及び R^5 は、それぞれ独立に、 H 、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシであり、或いは

R^4 及び R^5 が、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル又は $(C_1 - C_6)$ - アルコキシである場合、両基は、ピペリジン環のC-4と一緒にあって、4～7員環を形成することができる、式(Ib)の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩を含む、請求項15又は16に記載の害虫防除剤。

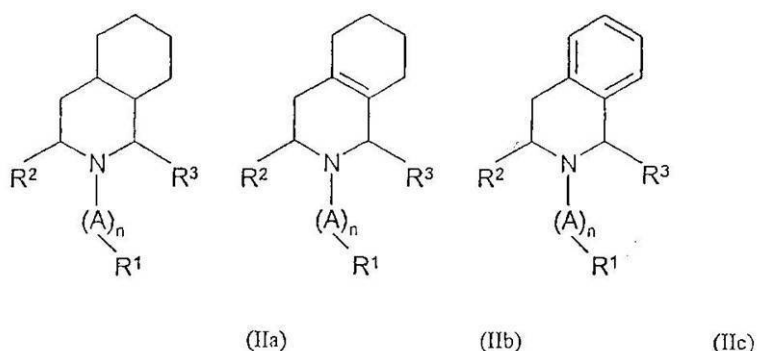
【請求項18】

R^6 は、 OH 、 $OCOR^8$ 、 $OCOOR^9$ 、 $COO(C_1 - C_4)$ - アルキルであり、

R^7 は、 H 、又は

R^7 は、 R^6 、並びにピペリジン環のC-3及びC-4と一緒にあって、非置換、又はハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_p$ $R^{1\ 2}$ 及び N $R^{1\ 3}$ $R^{1\ 4}$ からなる群から選択される1つ又は複数のラジカルで置換されている飽和又は不飽和の6員環を形成して、式(IIa)及び(IIb)及び(IIc)：

【化6】



の化合物を生成し、

R^1 、 R^2 、 R^3 及び A は、請求項2に定められている通りであり、

R^8 、 R^9 、 $R^{1\ 2}$ 、 $R^{1\ 3}$ 及び $R^{1\ 4}$ は、請求項1に定められている通りであり、

n は、0又は1であり、 p は、0、1又は2である、式(Ic)の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩を含む、請求項15又は16に記載の害虫防除剤。

【請求項19】

X は、 O である、式(Ic)の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩を含む、請求項15又は16に記載の害虫防除剤。

【請求項 20】

害虫が、節足動物害虫及び／又は蠕虫害虫である、請求項 14～19 のいずれかに記載の害虫防除剤。

【請求項 21】

害虫が、昆虫、クモ類及び／又は線虫である、請求項 14～19 のいずれかに記載の害虫防除剤。

【請求項 22】

害虫が、家畜又は家庭動物における外部寄生生物である、請求項 14～19 のいずれかに記載の害虫防除剤。

【請求項 23】

請求項 14～19 のいずれかに記載の式（I）の化合物、又はその殺虫剤として許容可能な塩とともに、殺虫剤として許容可能な希釈剤又は担体及び／又は界面活性剤を含む、請求項 14～22 のいずれかに記載の害虫防除剤。

【請求項 24】

請求項 14～23 のいずれかに記載の害虫防除剤を含む獣医医薬品。

【請求項 25】

請求項 14～23 のいずれかに記載の害虫防除剤を含む害虫を防除するための請求項 11 に記載の獣医医薬品。

【請求項 26】

請求項 14～23 のいずれかに記載の害虫防除剤を用いる、害虫の防除方法。

【請求項 27】

請求項 24 又は 25 に記載の獣医医薬品を用いる、非ヒト動物の治療方法。