

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2001 年 3 月 1 日 (01.03.2001)

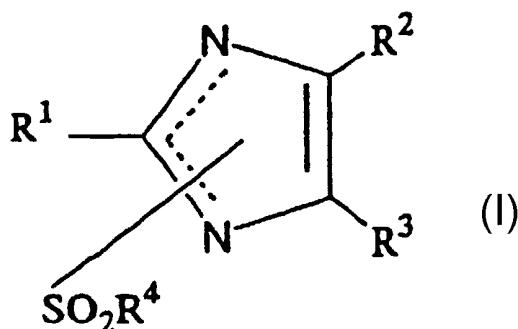
PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/14341 A1

- (51) 国際特許分類: C07D 233/84, 417/04, A61K 31/4164, 31/426, A61P 33/02
- (21) 国際出願番号: PCT/JP00/05566
- (22) 国際出願日: 2000 年 8 月 18 日 (18.08.2000)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願平11/233255 1999 年 8 月 19 日 (19.08.1999) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 石原産業株式会社 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒550-0002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 Osaka (JP).
- (74) 代理人: 泉名謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒101-0042 東京都千代田区神田東松山下町38番地 鳥本鋼業ビル Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 森野久弥 (MORINO, Kyuya) [JP/JP]. 四谷収一 (YOTSUYA, Shuichi) [JP/JP]. 小川 宗和 (OGAWA, Munekazu) [JP/JP]; 〒525-0025 滋賀県草津市西浜川二丁目3番1号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: AGENTS FOR CONTROLLING ANIMAL DISEASES CAUSED BY PARASITES

(54) 発明の名称: 寄生虫起因動物疾患防除剤



(57) Abstract: Agents for controlling animal diseases caused by parasites which contain as the active ingredient imidazole compounds represented by general formula (I) wherein R¹ represents cyano, 2-thiazolin-2-yl or optionally substituted sulfamoyl; and R² and R³ represent each H, halogeno, optionally substituted alkyl, optionally substituted phenyl, etc.

(57) 要約:

(式中、R¹はシアノ基、2-チアゾリン-2-イル基、置換可スルファモイル基であり、R²、R³はH、ハロゲン、置換可アルキル基または置換可フェニル基等である)で表されるイミダゾール系化合物を有効成分とする寄生虫起因動物疾患防除剤を提供する。



WO 01/14341 A1

明 細 書

寄生虫起因動物疾患防除剤

「技術分野」

本発明は、特定のイミダゾール系化合物を有効成分として含有する寄生虫起因
5 動物疾患防除剤に関する。該動物疾患防除剤は、例えば動物に寄生するコクシジ
ウムのような寄生虫を防除する薬剤として有用である。

「背景技術」

従来、家畜、家禽やペットなどの動物の寄生虫に対しては、各種の害虫防除剤
殺虫剤等が用いられている。例えば、アイメリア（*Eimeria*）属に属する内部
10 寄生性の原虫であり、各種の家畜や鶏などの家禽類に広く分布するコクシジウム
の防除には、サルファ剤；キノリン剤；抗チアミン剤；モネンシン、サリノマイ
シン、ラサロシド等のポリエーテル系抗生物質；合成剤であるナイカルバンジン
などが広く使用されている。

また、本発明の動物疾患防除剤の有効成分である特定のイミダゾール系化合物
15 は、特開平 1－1 3 1 1 6 3 号公報、特開昭 6 3－2 5 5 2 6 9 号公報などに記
載された公知化合物である。しかしながら、これら化合物を動物疾患防除剤とし
て用いることは知られていなかった。

「発明の開示」

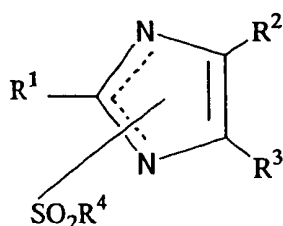
一般に寄生虫起因の動物疾患は動物宿主の体内外に寄生虫が寄生することによ
20 り起こる。動物疾患の原因となる寄生虫は、家畜、家禽やペットの体表、胃、腸
管、肺、心臓、肝臓、血管、皮下、リンパ組織などに寄生し、深刻な事態を引き
起こすことが多い。寄生虫起因の動物疾患は貧血、栄養失調、衰弱、体重減少、
腸管壁およびその他組織、器官の障害を招き、処置しないまま放置すると、寄生
虫に侵された宿主は死に至ることもある。

25 また、寄生虫起因の動物疾患の一つであるコクシジウム症は、特に養鶏業にお
いて多大の経済的損失を与える。また、鶏の他、牛、羊、兎、犬および猫などの
飼育においても問題となる疾病の 1 つである。そのため、コクシジウム症を防除
することによって、養鶏業、畜産業ならびにペットの飼育において、多大な利益

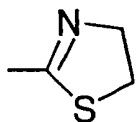
をもたらすことができる。そして、このような考えのもとに、本発明の寄生虫起因動物疾患防除剤を提供する。

- 本発明者らは、寄生虫起因の動物疾患、特にコクシジウム症を防除できる化合物につき、鋭意探索を行ってきた。その結果、農業用途が見出されている特定の
- 5 イミダゾール系化合物が寄生虫起因の動物疾患防除効果を持つことを見出し、本発明を完成した。

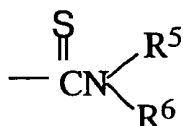
すなわち、本発明は、一般式 (I) :



[式中、R¹はシアノ基、

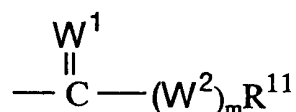


基または



- 10 基 {R⁵およびR⁶は水素原子、置換されてもよいアルキル基、置換されてもよいアルケニル基、置換されてもよいアルキニル基、置換されてもよいシクロアルキル基、置換されてもよいアリール基、または-CO-R⁷基 (R⁷は置換されてもよいアルキル基、置換されてもよいアルコキシ基または置換されてもよいアリール基である) である} であり、
- 15 R²およびR³は水素原子；ハロゲン原子；水酸基；ニトロ基；シアノ基；チオシアナート基；トリメチルシリル基；置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアルケニル基；置換されてもよいシクロアルケニル基；置換されてもよいアルキニル基；置換されてもよいアルコキシ基；置換されてもよいシクロアルキルオキシ基；置換されてもよいアルケニルオキシ基；置換されてもよいシクロアルケニルオキシ基；置換されてもよいアルキ
- 20

ニルオキシ基；置換されてもよいアリール基；置換されてもよいアリールオキシ基；置換されてもよい5～6員の芳香族複素環基； $-\text{SO}_n\text{R}^8$ 基（ R^8 は置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアルケニル基；置換されてもよいシクロアルケニル基；置換されてもよいアルキニル基；置換されてもよいアリール基；置換されてもよいピリジル基または $-\text{N}(\text{R}^9)\text{R}^{10}$ 基（ R^9 および R^{10} はアルキル基である）であり、 n は0～2の整数である）；または



基（ W^1 は酸素原子または硫黄原子であり、 W^2 は酸素原子、硫黄原子または $-\text{NH}-$ であり、 m は0～1の整数であり、 R^{11} は置換されてもよいアルキル基；または置換されてもよいアリール基である）であり、

R^4 が置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアリール基；置換されてもよいチエニル基；置換されてもよいフリル基；または $-\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$ 基（ R^{12} および R^{13} はそれぞれ水素原子；置換されてもよいアルキル基；または置換されてもよいアルケニル基であるか、または互いに隣接している窒素原子とともに5～7員の飽和複素環を形成し、但し、 R^{12} および R^{13} が同時に水素原子である場合を除く）であり、

但し、 R^2 および R^3 が同時にハロゲン原子である場合を除く]で表されるイミダゾール系化合物を有効成分として含有することを特徴とする寄生虫起因動物疾患防除剤に関する。

20 前記一般式（I）中、 $\text{R}^2 \sim \text{R}^{13}$ に含まれるアルキル部分としては炭素数が1～12のものであればよく、例えばメチル基、エチル基、 n -プロピル基、イソプロピル基、 n -ブチル基、 sec -ブチル基、イソブチル基、 tert -ブチル基、 n -ペンチル基、 n -ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基などが挙げられる。 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^8 で表わされるシクロアルキル基としては炭素数が3～7のものであればよく、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などが挙げられる

。R²、R³、R⁸、R¹²およびR¹³に含まれるアルケニル基としては、炭素数が2～12のものであればよく、例えばアリル基、ゲラニル基などが挙げられる。R²、R³およびR⁸で表わされるシクロアルケニル基としては炭素数が5～8のものであればよく、例えばシクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、シクロ
5 オクテニル基などが挙げられる。R²、R³およびR⁸に含まれるアルキニル基としては炭素数が2～12のものであればよく、例えば2-プロピニル基などが挙げられる。

R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸およびR¹¹で表わされる置換されてもよいアリール基；R²、R³で表される置換されてもよいアリールオキシ基のア
10 リール部分としては、フェニル基、ナフチル基などが挙げられる。R²、R³およびR⁸のアリール基としてはフェニル基またはナフチル基が望ましい。R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR¹¹のアリール基としてはフェニル基が望ましい。R²およびR³で表わされる置換されてもよいアリールオキシ基としてはフェノキシ基が望ましい。R²およびR³で表わされる置換されてもよい5～6員の芳香族複素
15 環基としては、その環内に酸素原子、硫黄原子および窒素原子よりなる群から選ばれた少なくとも1つのヘテロ原子を含むものであればよく、例えば置換されてもよいチエニル基、置換されてもよいフリル基、置換されてもよいチアゾリル基、置換されてもよいピリジル基などが挙げられる。

前記一般式(I)中、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²
20 およびR¹³で表わされる置換されてもよいアルキル基；R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶およびR⁸で表わされる置換されてもよいシクロアルキル基；R²、R³、R⁵、R⁶、R⁸、R¹²およびR¹³で表わされる置換されてもよいアルケニル基；R²、R³、R⁵、R⁶およびR⁸で表わされる置換されてもよいアルキニル基；並びに、R²およびR³で表わされる置換されてもよいアルコキシ基；R²、R³お
25 よびR⁷で表わされる置換されてもよいアルケニルオキシ基；置換されてもよいアルキニルオキシ基；置換されてもよいシクロアルキルオキシ基；置換されてもよいシクロアルケニルオキシ基の置換基としてはハロゲン原子；ハロゲン原子で置換されてもよいアルコキシ基；ハロゲン原子で置換されてもよいアルキルチオ基

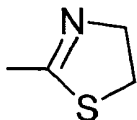
;ハロゲン原子で置換されてもよいフェニル基;ハロゲン原子で置換されてもよいアルキル基で置換されたフェニル基;水酸基などが挙げられる。 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^{11} で表わされる置換されてもよいアリール基; R^2 および R^3 で表わされる置換されてもよいアリールオキシ基; R^8 で表わされる置換されてもよいピリジル基; R^4 で表わされる置換されてもよいチエニル基; R^4 で表わされる置換されてもよいフリル基;並びに R^2 および R^3 で表わされる置換されてもよい5~6員の芳香族複素環基の置換基としては、ハロゲン原子;ニトロ基;シアノ基;ハロゲン原子で置換されてもよいアルキル基;アルコキシアルキル基;ハロゲン原子で置換されてもよいアルコキシ基;ハロゲン原子で置換されてもよいメチレンジオキシ基; $-NR^{14}R^{15}$ 基(R^{14} および R^{15} は水素原子、ハロゲン原子で置換されてもよいアルキル基またはアルカノイル基である); $-SO_pR^{16}$ 基(R^{16} はハロゲン原子で置換されてもよいアルキル基であり、 p は0~2の整数である)などが挙げられる。これら2次置換基の個数は0~5個が望ましい。前記 $R^2 \sim R^8$ および $R^{11} \sim R^{16}$ に含まれるハロゲン原子としては、塩素原子、臭素原子、弗素原子、沃素原子が挙げられる。前記 $R^{14} \sim R^{16}$ および後記 R^{17} に含まれるアルキル部分としては、前述の $R^2 \sim R^{13}$ に含まれるアルキル部分と同様のものであればよい。

また、 R^{12} と R^{13} は隣接している窒素原子と共に、酸素原子、硫黄原子または窒素原子を含んでもよい5~7員の飽和複素環を形成してもよく、例えばピペリジン環、ピロリジン環、モルフォリン環、チオモルフォリン環などが挙げられる。

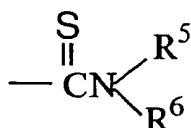
「発明を実施するための最良の形態」

前記一般式(I)のイミダゾール系化合物中、望ましい態様を下記する。

(1) 前記一般式(I)で表される化合物において、 R^1 がシアノ基、

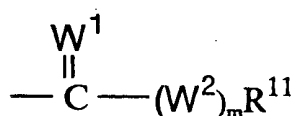


基または



基 { R^5 および R^6 は水素原子、アルキル基、置換されてもよいフェニル基、または $-\text{CO}-\text{R}^7$ 基 (R^7 は置換されてもよいアルキル基または置換されてもよいフェニル基である) である} であり、

- R^2 および R^3 は水素原子；ハロゲン原子；ニトロ基；シアノ基；チオシアナート基；トリメチルシリル基；置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアルケニル基；置換されてもよいアルキニル基、置換されてもよいアルコキシ基；置換されてもよいフェノキシ基；置換されてもよいフェニル基；置換されてもよいナフチル基；置換されてもよい5～6員の芳香族複素環基； $-\text{SO}_n-\text{R}^8$ 基 { R^8 は置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアルケニル基；置換されてもよいアルキニル基；置換されてもよいフェニル基；置換されてもよいピリジル基； $-\text{N}(\text{R}^9)-\text{R}^{10}$ 基 (R^9 および R^{10} はアルキル基である) または置換されてもよいナフチル基であり、 n は0～2の整数である}；または



- 基 (W^1 は酸素原子または硫黄原子であり、 W^2 は酸素原子、硫黄原子または $-\text{NH}-$ であり、 m は0～1の整数であり、 R^{11} は置換されてもよいアルキル基；または置換されてもよいフェニル基である) であり、

- R^4 は置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいフェニル基；置換されてもよいチエニル基；置換されてもよいフリル基；または $-\text{N}(\text{R}^{12})-\text{R}^{13}$ 基 (R^{12} および R^{13} はそれぞれ水素原子；置換されてもよいアルキル基；または置換されてもよいアルケニル基であるか、または互いに隣接している窒素原子とともに5～7員の飽和複素環を形成し、但し、 R^{12} および R^{13} が同時に水素原子である場合を除く) である場合の化合物。

(2) R^1 がシアノ基または $-\text{C}(=\text{S})\text{NHR}^5$ 基 (R^5 は水素原子または $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^7$ 基であり、 R^7 はアルキル基である) である (1) の化合物。

(3) R^1 がシアノ基である (1) の化合物。

(4) R^2 および R^3 が水素原子；ハロゲン原子；ニトロ基；シアノ基；アルキル基；ハロゲン原子で置換されたアルキル基；ハロゲン原子で置換されてもよいアルコキシ基で置換されたアルキル基；フェニル基で置換されたアルキル基；アルキル基で置換されたフェニル基で置換されたアルキル基；ハロゲン原子で置換されたフェニル基で置換されたアルキル基；水酸基で置換されたアルキル基；シクロアルキル基；ハロゲン原子で置換されてもよいアルケニル基；ハロゲン原子で置換されてもよいアルコキシ基；フェニル基；ハロゲン原子で置換されたフェニル基；ハロゲン原子で置換されてもよいアルキル基で置換されたフェニル基；ハロゲン原子で置換されてもよいアルコキシ基で置換されたフェニル基；チエニル基；ハロゲン原子で置換されたチエニル基；ピリジル基；フリル基； $-S(O)_n R^8$ 基 (R^8 はフェニル基で置換されてもよいアルキル基；ハロゲン原子で置換されてもよいフェニル基；ハロゲン原子で置換されたアルキル基で置換されてもよいピリジル基；アルケニル基または $-NR^9 R^{10}$ 基 (R^9 および R^{10} はアルキル基である) であり、 n は 0 ~ 2 の整数である}；または $-C(=O)-(NH)_m R^{11}$ (R^{11} はハロゲン原子で置換されてもよいアルキル基；またはハロゲン原子で置換されてもよいフェニル基であり、 m は 0 ~ 1 の整数である) である (1)、(2) または (3) の化合物。

(5) R^2 がアルキル基；ハロゲン原子で置換されたアルキル基；ハロゲン原子で置換されてもよいフェニル基で置換されたアルキル基；ハロゲン原子で置換されてもよいアルケニル基；アルキルチオ基；フェニル基；またはハロゲン原子で置換されたフェニル基であり、 R^3 がハロゲン原子である。更に望ましくは R^2 がメチル基、エチル基、 n -プロピル基、イソプロピル基、 n -ブチル基、イソブチル基、 n -ペンチル基、3-クロロ- n -プロピル基、4-クロロ- n -ブチル基、アリル (allyl) 基、エチルチオ基、フェニル基、2-クロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、ベンジル基または 2-フルオロベンジル基であり、 R_3 が塩素原子または臭素原子である (1)、(2) または (3) の化合物。

(6) R_4 が $-N(CH_3)_2$ 基である (1)、(2)、(3)、(4) または (5)

の化合物。

(7) R^1 がシアノ基であり、 R^2 が置換されてもよいアルキル基または置換されてもよいフェニル基であり、 R^3 が塩素原子であり、かつ R^4 がジメチルアミノ基である (1) の化合物。

5 特に望ましいイミダゾール系化合物は、上記望ましい態様 (7) の化合物であり、その中には、次の化合物が含まれる。

・ 4-クロロ-2-シアノ-1-ジメチルスルファモイル-5-(4-メチルフェニル) イミダゾール (化合物No. 1)

10 ・ 4-クロロ-2-シアノ-1-ジメチルスルファモイル-5-(4-メトキシフェニル) イミダゾール (化合物No. 2)

・ 4-クロロ-2-シアノ-1-ジメチルスルファモイル-5-(4-エチルフェニル) イミダゾール (化合物No. 3)

・ 4-クロロ-2-シアノ-1-ジメチルスルファモイル-5-(3-メチル-4-メトキシフェニル) イミダゾール (化合物No. 4)

15 ・ 4-クロロ-2-シアノ-1-ジメチルスルファモイル-5-(4-エチル- α -フルオロベンジル) イミダゾール (化合物No. 5)

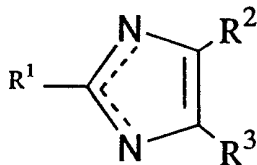
なお、前記一般式 (I) のイミダゾール系化合物は、特開平 1-131163 号公報ならびに特開平 8-208623 号公報などに記載された方法によって製造することができる。

20 本発明の寄生虫起因動物疾患防除剤は、(1) カイセンダニ、メソスチグマチド、スカピー、ツツガムシ、フタトビチマダニ、オウシマダニなどのダニ類；ネコノミ、イヌノミ、ネズミノミ、ケオプトネズミノミ、ヒトノミなどのノミ類；ウシジラミ、ウマジラミ、ヒツジジラミ、ウシホソジラミ、アタマジラミなどのシラミ類；イヌハジラミなどのハジラミ類；ウシアブ、ウアイヌカカ、ツメトゲブユ
25 などの吸血性双翅目害虫のように宿主動物の体外に寄生する寄生虫；(2) 肺虫、ベンチュウ、結節状ウオーム、胃内寄生虫、回虫、糸状虫類などの線虫類；サナダムシ；吸虫；コクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、クリプトスポリジウムなどの原生動物のように宿主動物の体内に寄生する寄生虫に

有効である。これら寄生虫の中でも、宿主動物の体内に寄生する寄生虫に有効であり、その中でも原生動物に有効である。また、原生動物の中でもコクシジウムに特に有効である。さらにコクシジウムの中でも家禽（鶏、アヒル、雁、七面鳥など）に寄生するコクシジウムに最も有効である。家禽に寄生するコクシジウムとしては、例えばアイメリア テネラ (*Eimeria tenella*)、アイメリア アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、アイメリア ブルネツチ (*Eimeria brunetti*)、アイメリア マキシマ (*Eimeria maxima*)、アイメリア ミチス (*Eimeria mitis*)、アイメリア ミバチ (*Eimeria mivati*)、アイメリア ネカトリックス (*Eimeria necatrix*) およびアイメリア プレコックス (*Eimeria praecox*) などが挙げられる。

一般式 (I) の化合物はそのまま使用してもよいが、適当な担体と共に粉剤、粒剤、錠剤、散剤、カプセル剤、プレミックス剤、液剤、乳剤などの剤形に製剤して使用することもできる。適当な担体としては、通常、飼料用薬剤に利用されているものが使用され、例えば、乳糖、蔗糖、ブドウ糖、澱粉、麦粉、コーン粉、大豆油粕、脱脂米糠、炭酸カルシウム、その他市販の飼料原料等を挙げることができる。また、本発明化合物は、担体と共に各種ビタミン類、ミネラル類、アミノ酸類、酵素製剤、解熱剤、鎮静剤、消炎剤、殺菌剤、着色剤、芳香剤、保存剤等と配合併用して使用することもできる。一般式 (I) の化合物の投与濃度としては、投与方法、投与目的、疾病症状等によって異なるが、通常、飼料中に 0.1 ppm 以上の濃度となるように配合して投与するのが適当である。

前記一般式 (I) の化合物が動物の体内で一般式 (II) :



(式中、R¹、R²およびR³は前述の通り) の化合物に変化する場合がある。このような一般式 (II) の化合物も動物の体内では一般式 (I) の化合物と同様、寄生虫起因動物疾患防除剤として作用する。

前記一般式 (II) の化合物は、特開平 1-131163 号に一般式 (I) の化

合物の中間体として記載されている。このものは、特開平1-131163号、特開平4-59766号、特開平7-215946号、特開平7-252233号、特開平7-252234号、特開平7-309843号、特開平8-225539号などに記載された方法などによって製造することもできる。

5 「実施例」

本発明をより詳しく述べるために、以下に実施例を記載するが、これらは本発明を限定するものではない。

試験例

アイメリア テネラ野外株を鶏雛で感染増殖させ、新鮮未成熟オーシストを得た。各被験物質の所定濃度の溶液を、得られた新鮮未成熟オーシストに10、30分感作させた。感作した未成熟オーシストを 1500 min^{-1} 5分間遠心し、上清を取り除き2%重クロム酸カリウム水溶液を加え25℃ 4日間スポルレーションし、観察オーシスト数に対する成熟オーシスト(孢子形成オーシスト)の率を算出した。さらに次式で殺オーシスト率を求め、結果を表1に示した。

15 殺オーシスト率 = { 1 - (被験物質感作の孢子形成率) / (被験物質無感作の孢子形成率) } × 100

被験物質 \ ppm	殺オーシスト率 (%)							
	感作時間10分				感作時間30分			
	0*	0.1	1	10	0*	0.1	1	10
化合物No. 1	2.5	43.8	36.9	42.5	1.9	51.1	80.3	87.9
化合物No. 5	2.5	34.4	30.0	75.0	1.9	71.3	75.2	72.6

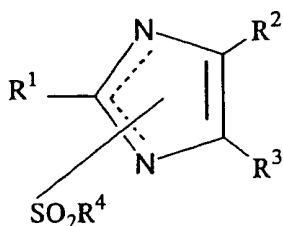
注) *は10%ジメチルスルホキシドのみ使用

「産業上の利用の可能性」

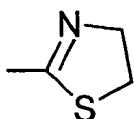
本発明によれば、特定のイミダゾール系化合物を寄生虫起因動物疾患防除剤として提供することができる。

請求の範囲

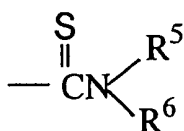
1. 一般式 (I) :



[式中、R¹はシアノ基、

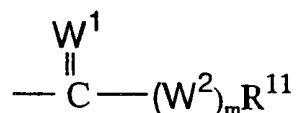


基または



- 5 基 {R⁵およびR⁶は水素原子、置換されてもよいアルキル基、置換されてもよいアルケニル基、置換されてもよいアルキニル基、置換されてもよいシクロアルキル基、置換されてもよいアリール基、または—CO—R⁷基 (R⁷は置換されてもよいアルキル基、置換されてもよいアルコキシ基または置換されてもよいアリール基である) である} であり、
- 10 R²およびR³は水素原子；ハロゲン原子；水酸基；ニトロ基；シアノ基；チオシアナート基；トリメチルシリル基；置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアルケニル基；置換されてもよいシクロアルケニル基；置換されてもよいアルキニル基；置換されてもよいアルコキシ基；置換されてもよいシクロアルキルオキシ基；置換されてもよいアルケニルオキシ基；置換されてもよいシクロアルケニルオキシ基；置換されてもよいアルキニルオキシ基；置換されてもよいアリール基；置換されてもよいアリールオキシ基；置換されてもよい5～6員の芳香族複素環基；—SO_nR⁸基 {R⁸は置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアルケニル基；置換されてもよいシクロアルケニル基；置換されてもよいアルキニル基；置換されてもよいアリール基；置換されてもよいピリジル基または—N (
- 15
- 20

R⁹) R¹⁰基 (R⁹およびR¹⁰はアルキル基である) であり、nは0～2の整数である} ; または

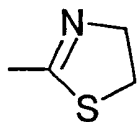


基 (W¹は酸素原子または硫黄原子であり、W²は酸素原子、硫黄原子または-NH-であり、mは0～1の整数であり、R¹¹は置換されてもよいアルキル基 ; または置換されてもよいアリール基である) であり、

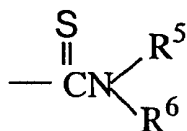
R⁴は置換されてもよいアルキル基 ; 置換されてもよいシクロアルキル基 ; 置換されてもよいアリール基 ; 置換されてもよいチエニル基 ; 置換されてもよいフリル基 ; または-N(R¹²)R¹³基 (R¹²およびR¹³はそれぞれ水素原子 ; 置換されてもよいアルキル基 ; または置換されてもよいアルケニル基であるか、または互いに隣接している窒素原子とともに5～7員の飽和複素環を形成し、但し、R¹²およびR¹³が同時に水素原子である場合を除く) であり、

但し、R²およびR³が同時にハロゲン原子である場合を除く]で表されるイミダゾール系化合物を有効成分として含有することを特徴とする寄生虫起因動物疾患防除剤。

15 2. R¹がシアノ基、



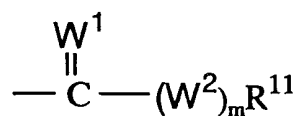
基または



基 {R⁵およびR⁶が水素原子、アルキル基、置換されてもよいフェニル基、または-CO-R⁷基 (R⁷が置換されてもよいアルキル基または置換されてもよいフェニル基である) である} であり、

20 R²およびR³が水素原子 ; ハロゲン原子 ; ニトロ基 ; シアノ基 ; チオシアナート基 ; トリメチルシリル基 ; 置換されてもよいアルキル基 ; 置換されてもよいシクロアルキル基 ; 置換されてもよいアルケニル基 ; 置換されてもよいアルキニル基

- 、置換されてもよいアルコキシ基；置換されてもよいフェノキシ基；置換されてもよいフェニル基；置換されてもよいナフチル基；置換されてもよい5～6員の芳香族複素環基； $-\text{SO}_n\text{R}^8$ 基（ R^8 が置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいアルケニル基；置換されてもよいアルキニル基；置換されてもよいフェニル基；置換されてもよいピリジル基； $-\text{N}(\text{R}^9)\text{R}^{10}$ 基（ R^9 および R^{10} はアルキル基である）または置換されてもよいナフチル基であり、 n は0～2の整数である）；または



- 基（ W^1 は酸素原子または硫黄原子であり、 W^2 は酸素原子、硫黄原子または $-\text{NH}-$ であり、 m は0～1の整数であり、 R^{11} は置換されてもよいアルキル基；または置換されてもよいフェニル基である）であり、
 R^4 が置換されてもよいアルキル基；置換されてもよいシクロアルキル基；置換されてもよいフェニル基；置換されてもよいチエニル基；置換されてもよいフリル基；または $-\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$ 基（ R^{12} および R^{13} はそれぞれ水素原子；置換されてもよいアルキル基；または置換されてもよいアルケニル基であるか、または互いに隣接している窒素原子とともに5～7員の飽和複素環を形成し、但し、 R^{12} および R^{13} が同時に水素原子である場合を除く）である請求項1の寄生虫起因動物疾患防除剤。

3. R^1 がシアノ基であり、 R^2 が置換されてもよいアルキル基または置換されてもよいフェニル基であり、 R^3 が塩素原子であり、かつ R^4 がジメチルアミノ基である請求項1の寄生虫起因動物疾患防除剤。

4. 寄生虫が宿主動物の体内に寄生するものである請求項1の寄生虫起因動物疾患防除剤。

5. 寄生虫が原生動物である請求項4の寄生虫起因動物疾患防除剤。

6. 原生動物がコキシジウムである請求項5の寄生虫起因動物疾患防除剤。

- 25 7. コキシジウムが家禽のコキシジウムである請求項6の寄生虫起因動物疾患防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/05566

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07D233/84, 417/04, A61K31/4164, 426, A61P33/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07D233/00-84, 417/00-04, A61K31/00-426

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 3-11003, A2 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.), 18 January, 1991 (18.01.91) (Family: none)	1-7
A	US, 4659720, A (MERCK & CO., INC.), 21 April, 1987 (21.04.87) & JP, 59-118772, A	1-7

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
14 November, 2000 (14.11.00)Date of mailing of the international search report
28 November, 2000 (28.11.00)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl. ⁷ C07D233/84, 417/04, A61K31/4164, 426, A61P33/02		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl. ⁷ C07D233/00-84, 417/00-04, A61K31/00-426		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP, 3-11003, A2 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) 18. 1月. 1991 (18. 01. 91) ファミリーなし	1-7
A	US, 4659720, A (MERCK & CO., INC.) 21. 4月. 1987 (21. 04. 87) & JP, 59-118772, A	1-7
☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。 ☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 14. 11. 00	国際調査報告の発送日 28.11.00	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 齋藤 恵  4 P 9164 電話番号 03-3581-1101 内線 3490	