

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012130140/04, 16.12.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
17.12.2009 US 61/287,545

(43) Дата публикации заявки: 27.01.2014 Бюл. № 3

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 17.07.2012(86) Заявка РСТ:
US 2010/060833 (16.12.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/075591 (23.06.2011)Адрес для переписки:
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

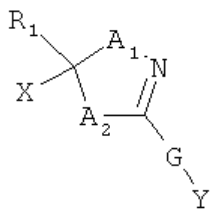
МЕРИАЛ ЛИМИТЕД (US)

(72) Автор(ы):

**ЛЕ ИР ДЕ ФАЛЛУА Лоик Патрик (US),
ЛИ Хуонг Ик (US),
УИЛКИНСОН Дуглас Эдвард (US),
БЕК Брент Кристофер (US)**(54) **ПРОТИВОПАРАЗИТАРНЫЕ ДИГИДРОАЗОЛОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ И СОДЕРЖАЩИЕ ИХ КОМПОЗИЦИИ**

(57) Формула изобретения

1. Дигидроазоловое соединение формулы (I) либо его фармацевтически или сельскохозяйственно приемлемая соль:



(I)

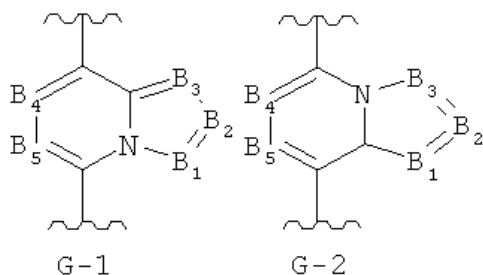
где: R₁ означает водород, галоген, -CN или алкил, галоалкил, алкенил, галоалкенил, алкинил, галоалкинил, циклоалкил, галоциклоалкил, алкилциклоалкил или циклоалкил-алкил, каждый из которых незамещен или замещен одним или несколькими из галогенов, гидроксигруппы, аминогруппы, алкил- или ди(алкил)аминогруппы, алкилов, циклоалкилов, галоалкилов, алкенилов, галоалкенилов, алкинилов, галоалкинилов, алкокси, галоалкокси, алкилтио, галоалкилтио, R₇S(O)-, R₇S(O)₂-, R₇C(O)-, R₇R₈NC(O)-, R₇OC(O)-, R₇C(O)O-, R₇C(O)NR₈-, -CN или -NO₂;

X означает арил или гетероарил, который может быть незамещен или замещен одним или несколькими из галогенов, гидроксигруппы, аминогруппы, алкил- или ди(алкил)аминогруппы, алкилов,

циклоалкилов, галоалкилов, алкенилов, галоалкенилов, алкинилов, галоалкинилов, алкокси, галоалкокси, алкилтио, галоалкилтио, $R_7S(O)-$, $R_7S(O)_2-$, $R_7C(O)-$, $R_7R_8NC(O)-$, $R_7OC(O)-$, $R_7C(O)O-$, $R_7C(O)NR_8-$, $-CN$ или $-NO_2$;

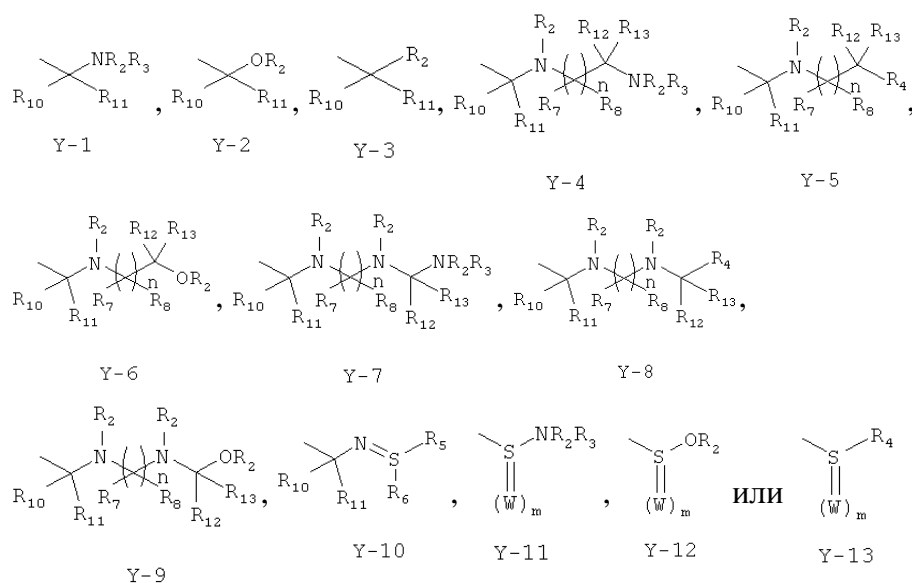
A_1 и A_2 независимо означают кислород, NR_2 или CR_7R_8 ;

G означает G-1 или G-2;



B_1 , B_2 , B_3 , B_4 и B_5 независимо означают N или C- R_9 ;

Y означает водород, галоген, $-CN$; либо Y означает алкил, галоалкил, алкенил, галоалкенил, алкинил, галоалкинил, циклоалкил, алкилциклоалкил, циклоалкилалкил, арил, гетероцикл или гетероарил, каждый из которых незамещен или замещен одним или несколькими из галогенов, гидроксигруппы, амино, алкил- или ди(алкил)амино, алкилов, циклоалкилов, галоалкилов, алкенилов, галоалкенилов, алкинилов, галоалкинилов, алкокси, галоалкокси, алкилтио, галоалкилтио, $R_7S(O)-$, $R_7S(O)_2-$, $R_7C(O)-$, $R_7R_8NC(O)-$, $R_7OC(O)-$, $R_7C(O)O-$, $R_7C(O)NR_8-$, $-CN$ или $-NO_2$; либо Y означает Y-1, Y-2, Y-3, Y-4, Y-5, Y-6, Y-7, Y-8, Y-9, Y-10, Y-11, Y-12 или Y-13;



R_2 , R_3 независимо означают водород, алкил, галоалкил, тиаалкил, алкилтиоалкил, гидроксипол, алкоксипол, алкенил, галоалкенил, алкинил, галоалкинил, циклоалкил, $R_{10}S(O)-$, $R_{10}S(O)_2-$, $R_{10}C(O)-$, $R_{10}C(S)-$, $R_{10}R_{11}NC(O)-$, $R_{10}R_{11}NC(S)-$, $R_{10}OC(O)-$;

R_4 , R_5 и R_6 независимо означают водород, алкил, галоалкил, тиаалкил, алкилтиоалкил, гидроксипол, алкоксипол, алкенил, галоалкенил, алкинил, галоалкинил, циклоалкил, арил или гетероарил;

R_7 и R_8 независимо означают водород, алкил, галоалкил, тиаалкил, алкилтиоалкил, гидроксипол, алкоксипол, алкенил, галоалкенил, алкинил или галоалкинил;

R_9 означает водород, галоген, $-CN$ или алкил, галоалкил, алкенил, галоалкенил, алкинил, галоалкинил, циклоалкил, галоциклоалкил, алкилциклоалкил или циклоалкилалкил, каждый из которых незамещен или замещен одним или несколькими из галогенов,

гидроксигруппы, амино-, алкил- или ди(алкил)амино-, алкилов-, циклоалкилов-, галоалкилов-, алкенилов-, галоалкенилов-, алкинилов-, галоалкинилов-, алкокси-, галоалкокси-, алкилтио-, галоалкилтио-, $R_7S(O)-$, $R_7S(O)_2-$, $R_7C(O)-$, $R_7R_8NC(O)-$, $R_7OC(O)-$, $R_7C(O)O-$, $R_7C(O)NR_8-$, $-CN$ или $-NO_2$;

R_{10} , R_{11} , R_{12} и R_{13} каждый независимо означает водород, алкил, галоалкил, тиаалкил, алкилтиоалкил, гидроксипалкил, алкоксипалкил, алкенил, галоалкенил, алкинил или галоалкинил; либо

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$; или

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

W означает O , S или NR_2 ;

$n=1-4$; и

$m=0, 1$ или 2 .

2. Соединение по п.1, в котором G означает $G-1$.

3. Соединение по п.1, в котором G означает $G-2$.

4. Соединение по п.1, в котором:

G означает $G-1$;

A_1 означает кислород; и

X означает необязательно замещенный арил.

5. Соединение по п.1, в котором:

G означает $G-2$;

A_1 означает кислород; и

X означает необязательно замещенный арил.

6. Соединение по п.1, в котором:

A_1 означает кислород;

X означает необязательно замещенный арил;

R_1 означает водород, галоген, алкил или галоалкил; а

Y означает $Y-1$, $Y-2$, $Y-3$, $Y-4$, $Y-5$, $Y-6$, $Y-7$, $Y-8$, $Y-9$, $Y-10$, $Y-11$, $Y-12$ или $Y-13$.

7. Соединение по п.1, в котором:

A_1 означает кислород;

X означает необязательно замещенный арил;

R_1 означает водород, галоген, алкил или галоалкил; а

Y означает пиразолил или триазилил.

8. Соединение по п.1, в котором:

G означает $G-1$;

B_1 , B_2 , B_3 , B_4 и B_5 каждый означает $C-R_9$;

R_1 означает C_1-C_4 -алкил или C_1-C_4 -галоалкил;

X означает фенил, который может быть незамещен или замещен одним или несколькими галогенами, C_1-C_4 -алкилами или C_1-C_4 -галоалкилами;

A_1 означает кислород;

A_2 означает CR_7R_8 ;

Y означает $Y-1$, $Y-4$, $Y-5$, $Y-6$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1-C_4 -алкил, C_1-C_4 -галоалкил, C_1-C_4 -алкокси-, C_1-C_4 -алкил или C_1-C_4 -алкилтио- C_1-C_4 -алкил; и

R_3 и R_9 независимо означают водород, C_1-C_4 -алкил или C_1-C_4 -галоалкил.

9. Соединение по п.1, в котором:

G означает $G-2$;

B_1, B_2, B_3, B_4 и B_5 каждый означает C- R_9 ;

R_1 означает C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил;

X означает фенил, который может быть незамещен или замещен одним или несколькими галогенами, C_1 - C_4 -алкилами или C_1 - C_4 -галоалкилами;

A_1 означает кислород;

A_2 означает CR_7R_8 ;

Y означает Y-1, Y-4, Y-5, Y-6;

R_2 и R_7 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 -галоалкил, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -алкилтио- C_1 - C_4 -алкил; и

R_3 и R_9 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил.

10. Соединение по п.1, в котором:

G означает G-1;

B_1, B_2, B_4 и B_5 каждый означает C- R_9 ;

B_3 означает N;

R_1 означает C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил;

X означает фенил, который может быть незамещен или замещен одним или несколькими галогенами, C_1 - C_4 -алкилами или C_1 - C_4 -галоалкилами;

A_1 означает кислород;

A_2 означает CR_7R_8 ;

Y означает Y-1, Y-4, Y-5, Y-6;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 -галоалкил, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -алкилтио- C_1 - C_4 -алкил; и

R_3 и R_9 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил.

11. Соединение по п.1, в котором:

G означает G-2;

B_2, B_3, B_4 и B_5 каждый означает C- R_9 ;

B_1 означает N;

R_1 означает C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил;

X означает фенил, который может быть незамещен или замещен одним или несколькими галогенами, C_1 - C_4 -алкилами или C_1 - C_4 -галоалкилами;

A_1 означает кислород;

A_2 означает CR_7R_8 ;

Y означает Y-1, Y-4, Y-5, Y-6;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 -галоалкил, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -алкилтио- C_1 - C_4 -алкил; и

R_3 и R_9 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил.

12. Соединение по п.8, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и

R_3, R_7 и R_8 каждый означает водород.

13. Соединение по п.9, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и R_3 , R_7 и R_8 каждый означает водород.

14. Соединение по п.8, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и R_3 , R_7 и R_8 каждый означает водород.

15. Соединение по п.9, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и R_3 , R_7 и R_8 каждый означает водород.

16. Соединение по п.8, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и R_3 , R_7 и R_8 означают водород.

17. Соединение по п.10, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и R_3 , R_7 и R_8 каждый означает водород.

18. Соединение по п.11, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и R_3 , R_7 и R_8 каждый означает водород.

19. Соединение по п.10, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и R_3 , R_7 и R_8 каждый означает водород.

20. Соединение по п.11, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и

R_3 , R_7 и R_8 каждый означает водород.

21. Соединение по п.10, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и

R_3 , R_7 и R_8 означают водород.

22. Соединение по п.11, в котором:

A_2 означает CH_2 ;

R_9 означает водород;

R_{10} вместе с R_{11} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_{12} вместе с R_{13} образуют $=O$, $=S$ или $=NR_2$;

R_2 и R_4 независимо означают водород, C_1 - C_4 -алкил или C_1 - C_4 -галоалкил; и

R_3 , R_7 и R_8 означают водород.

23. Композиция для лечения или профилактики паразитарных инфекций или инвазий у животных, содержащая эффективное количество соединения формулы (I) по п.1 в комбинации с фармацевтически приемлемым носителем.

24. Композиция для защиты посевов, растений, посадочного материала или лесоматериала от вредителей, содержащая пестицидно эффективное количество соединения формулы (I) по п.1 в комбинации с сельскохозяйственно приемлемым носителем.

25. Способ лечения или профилактики паразитарных инфекций или инвазий у животных, включающий стадию, на которой животному вводят паразитоцидно эффективное количество соединения формулы (I) по п.1.

26. Способ защиты посевов и растущих растений от нападения или инвазии животных-вредителей, включающий стадию, на которой растение либо почву или воду, в которой они произрастают, вводят в контакт с соединением формулы (I) по п.1.

27. Способ профилактики или борьбы с инвазией животных-вредителей на участке, включающий стадию, на которой на участок наносят пестицидно или паразитоцидно эффективное количество соединения формулы (I) по п.1.

28. Применение соединения по п.1 для лечения или профилактики паразитарных инфекций или инвазий у животных.

29. Применение соединения по п.1 для изготовления лекарства для лечения или профилактики паразитарных инфекций или инвазий у животных.