

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-518351(P2005-518351A)

【公表日】平成17年6月23日(2005.6.23)

【年通号数】公開・登録公報2005-024

【出願番号】特願2003-544020(P2003-544020)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 209/08

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/427

A 6 1 P 33/10

A 6 1 P 33/14

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 209/10

C 0 7 D 209/30

C 0 7 D 209/42

C 0 7 D 235/08

C 0 7 D 235/10

C 0 7 D 235/28

C 0 7 D 417/04

【F I】

C 0 7 D 209/08 C S P

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/427

A 6 1 P 33/10

A 6 1 P 33/14

A 6 1 P 43/00 1 7 1

C 0 7 D 209/10

C 0 7 D 209/30

C 0 7 D 209/42

C 0 7 D 235/08

C 0 7 D 235/10

C 0 7 D 235/28 C

C 0 7 D 417/04

【手続補正書】

【提出日】平成16年7月15日(2004.7.15)

【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

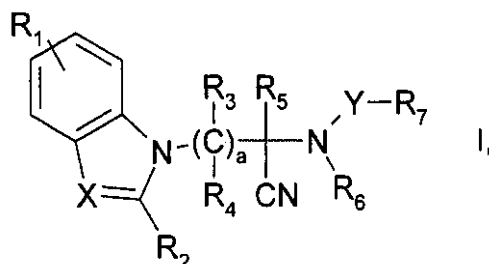
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の式Iの化合物：

## 【化 1】



式中、

$R_1$  は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルカルボニル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_6$ -アルキル)アミノ、非置換のフェノキシ、または、置換されたフェノキシ(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニルおよびハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニルからなる群から選択される)を表す；

$R_2$  は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $NR_8R_9$ 、非置換のヘタリール(hetaryl)、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリール、非置換のフェニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するフェニルを表し、この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよびハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシからなる群から選択される；

$R_3$ 、 $R_4$  および  $R_5$  はいずれも、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、非置換の  $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有する  $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲンおよび  $C_1 \sim C_6$ -アルキルからなる群から選択される)；非置換のフェニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するフェニル(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノまたはジ( $C_1 \sim C_6$ -アルキル)アミノからなる群から選択される)を表す；

あるいは、 $R_4$  および  $R_5$  は一緒になって、 $C_2 \sim C_6$ -アルキレンを表す；

$R_6$  は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシカルボニル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシカルボニル、チオ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシカルボニルまたはベンジルを表す；

$R_7$  は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_6$ -アルキル)アミノ、非置換のアリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、

$C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニル、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$  - シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニルオキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルチオ、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルチオ、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルフィニル、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルホニル、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_6$  - アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニルアミノ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルアミノカルボニル、ジ ( $C_1 \sim C_6$  - アルキル) アミノカルボニルからなる群から選択される) ; 非置換のアリール -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、非置換のアリールアミノ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールアミノ、非置換のアリールカルボニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールカルボニル、非置換のアリールカルボニルオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールカルボニルオキシ、非置換のアリールオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ、非置換のアリールオキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、非置換のヘタリールオキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリールオキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、非置換のアリールオキシカルボニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシカルボニル、非置換のアリールスルホニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールスルホニル、非置換のアリールスルホニルアミノ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールスルホニルアミノ、非置換のピリジルオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するピリジルオキシ、および、非置換のフェニルアセチレニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するフェニルアセチレニル (この場合、置換基は、それぞれが互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される) ; 非置換のヘタリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリール (この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルチオ、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルチオ、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルフィニル、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルホニル、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルアミノおよびジ ( $C_1 \sim C_6$  - アルキル) アミノからなる群から選択される) ; 非置換のナフチルもしくはキノリル、または、1つもしくは複数の置換基を有するナフチルもしくはキノリル (この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、ハロ -  $C_1 \sim C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_2 \sim$

C<sub>6</sub> - アルケニルチオ、ハロ - C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルケニルチオ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルケニルスルフィニル、ハロ - C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルケニルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルケニルスルホニル、ハロ - C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルケニルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキルアミノおよびジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキル)アミノからなる群から選択される)を表す；

R<sub>8</sub> および R<sub>9</sub> は、互いに独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキルチオカルボニル、チオ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、アリールまたはヘタリールを表す；

X は C(R<sub>10</sub>) または N を表す；

R<sub>10</sub> は、水素、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルキル、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> - アルコキシを表す；

Y は、直接的な結合、C(O)、C(S)、または S(O)<sub>n</sub> を表す；

a は 1 または 2 または 3 を表す；かつ

n は 0 または 1 または 2 を表す

ただし、R<sub>5</sub> がメチルである場合、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は同時に水素ではない化合物。

#### 【請求項 2】

R<sub>1</sub> が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシ、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルスルホニル、非置換のフェノキシ、または、置換されたフェノキシ(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシおよびハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシからなる群から選択される)を表す、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 3】

R<sub>1</sub> が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルコキシ、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルコキシ、非置換のフェノキシ、または、置換されたフェノキシ(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシおよびハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシからなる群から選択される)を表す、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 4】

R<sub>1</sub> が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルコキシまたはハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルコキシを表す、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 5】

R<sub>2</sub> が、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシ、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルコキシまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルスルホニルを表す、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 6】

R<sub>2</sub> が、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルコキシまたはハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> - アルコキシを表す、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 7】

R<sub>2</sub> が、水素、メチル、ハロメチル、メチルチオ、メトキシまたはハロメトキシを表す、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 8】

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> および R<sub>5</sub> が、互いに独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、ハロ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> - シクロアルキル；非置換のフェニル、または、1 つもしくは複数の置換基を有するフェニル(この場合、置換基は互いに独立して存在

することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシからなる群から選択される)； $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオおよびハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオである；あるいは、 $R_4$  および  $R_5$  が一緒になって、 $C_2 \sim C_6$ -アルキレンである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 9】

$R_3$ 、 $R_4$  および  $R_5$  が、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_2$ -アルキルまたは  $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 10】

$R_3$ 、 $R_4$  および  $R_5$  が、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_2$ -アルキルまたは  $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 11】

$R_3$ 、 $R_4$  および  $R_5$  が、互いに独立して、水素、メチルまたはハロメチルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 12】

$R_6$  が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルまたはベンジルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 13】

$R_6$  が、水素、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルカルボニルまたはベンジルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 14】

$R_6$  が水素または  $C_1 \sim C_2$ -アルキルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 15】

$R_7$  が、非置換のアリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、ハロ- $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニルオキシ、ハロ- $C_2 \sim C_4$ -アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルオキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニルスルホニル、ハロ- $C_2 \sim C_4$ -アルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_4$ -アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシカルボニルからなる群から選択される)；非置換のアリール- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、非置換のアリールオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ、非置換のアリールオキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、非置換のヘタリールオキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリールオキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、非置換のアリールオキシカルボニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシカルボニル、非置換のアリールスルホニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールスルホニル、および、非置換のピリジルオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するピリジルオキシ(この場合、置換基は、それぞれが互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルおよびハロ

-  $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される) ;

非置換のヘタリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される) ;

非置換のナフチルもしくはキノリル、または、1つもしくは複数の置換基を有するナフチルもしくはキノリル(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルチオ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される)

を表す、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項16】

$R_7$  が、非置換のアリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$  - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシカルボニルからなる群から選択される) ; 非置換のアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、非置換のアリールオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、および、非置換のピリジルオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するピリジルオキシ(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される) ;

非置換のヘタリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される) を表す、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項17】

$R_7$  が、非置換のアリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$  - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシカルボニルからなる群から選択される) ; 非置換のアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、および、非置換のアリールオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ(この場合、置換基は、それぞれが

互いに独立して存在することができ、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシおよびハロ- $C_1 \sim C_2$ -アルコキシからなる群から選択される)を表す、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項18】

$R_{10}$ が、水素、シアノ、ニトロまたは $C_1 \sim C_4$ -アルキルを表す、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項19】

$R_{10}$ が水素またはシアノを表す、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項20】

$R_{10}$ が水素を表す、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項21】

YがC(O)またはS(O)<sub>n</sub>である、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項22】

YがC(O)である、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項23】

aが1または2である、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項24】

aが1である、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項25】

nが2である、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項26】

$R_1$ が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル、非置換のフェノキシ、または、置換されたフェノキシ(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシおよびハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシからなる群から選択される)を表す；

$R_2$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルである；

$R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ が、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル；非置換のフェニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するフェニル(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシからなる群から選択される)； $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオおよびハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオであり、あるいは、 $R_4$ および $R_5$ が一緒になって、 $C_2 \sim C_6$ -アルキレンである；

$R_6$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルまたはベンジルである；

$R_7$ が、非置換のアリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、ハロ- $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニルオキシ、ハロ- $C_2 \sim C_4$ -アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルオキシ、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル、ハロ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニルスルホニル、ハロ- $C_2 \sim C_4$ -アルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_4$ -アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカ

ルボニル、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシカルボニルからなる群から選択される) ; 非置換のアリール -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、非置換のアリールオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ、非置換のアリールオキシ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、非置換のヘタリールオキシ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリールオキシ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、非置換のアリールオキシカルボニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシカルボニル、非置換のアリールスルホニル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールスルホニル、および、非置換のピリジルオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するピリジルオキシ(この場合、置換基は、それぞれが互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される) ;

非置換のヘタリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される) ;

非置換のナフチルもしくはキノリル、または、1つもしくは複数の置換基を有するナフチルもしくはキノリル(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルチオ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される)

を表す ;

Y が C ( O ) または S ( O )<sub>n</sub> である ;

a が 1 または 2 を表す ; かつ

n が 2 を表す、

請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 27】

R<sub>1</sub> が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、非置換のフェノキシ、または、置換されたフェノキシ(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシおよびハロ -  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシからなる群から選択される)を表す ;

R<sub>2</sub> が、水素、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシまたはハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシを表す ;

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> および R<sub>5</sub> が、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルまたは  $C_3 \sim C_6$  - シクロアルキルを表す ;

R<sub>6</sub> が、水素、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニルまたはベンジルを表す ;

R<sub>7</sub> が、非置換のアリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$  - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、ハロ -



$C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシカルボニルからなる群から選択される)；非置換のアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、非置換のアリールオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ、非置換のアリールオキシ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、および、非置換のピリジルオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するピリジルオキシ(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される)；

非置換のヘタリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するヘタリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、ハロ -  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルおよびハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルスルホニルからなる群から選択される)を表す；

$R_{10}$  が水素またはシアノを表す；

Y が C(O) を表す；かつ

a が 1 を表す、

請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 28】

$R_1$  が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシまたはハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシを表す；

$R_2$  が、水素、メチル、ハロメチル、メチルチオ、メトキシまたはハロメトキシを表す；

$R_3$ 、 $R_4$  および  $R_5$  が、互いに独立して、水素、メチルまたはハロメチルを表す；

$R_6$  が水素または  $C_1 \sim C_2$  - アルキルを表す；

$R_7$  が、非置換のアリール、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール(この場合、置換基は互いに独立して存在することができ、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$  - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシカルボニルからなる群から選択される)；非置換のアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリール -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、および、非置換のアリールオキシ、または、1つもしくは複数の置換基を有するアリールオキシ、(この場合、置換基は、それぞれが互いに独立して存在することができ、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  - アルキル、ハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルキル、 $C_1 \sim C_2$  - アルコキシおよびハロ -  $C_1 \sim C_2$  - アルコキシからなる群から選択される)を表す；

$R_{10}$  が水素を表す；

Y が C(O) を表す；かつ

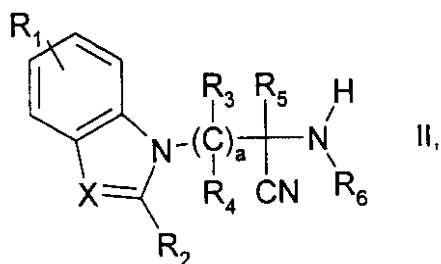
a が 1 を表す、

請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 29】

下記の式 II の化合物(これは知られているか、または対応の知られている化合物に類似して製造され得る)；

## 【化 2】



(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $X$ および $a$ は、式 I について示される通りに定義される)

を、下記の式 I I I の化合物 (これは知られているか、または対応の知られている化合物に類似して調製され得る) :

## 【化 3】



(式中、 $Y$ および $R_7$ は、式 I について示される通りに定義され、 $Q$ は脱離基である) と、場合により塩基性触媒の存在下で反応させ、そして、所望する場合には、当該方法または別の方法に従って個々に遊離型形態または塩形態で得ることができる式 I の化合物を式 I の別の化合物に変換し、当該方法に従って得ることができる異性体の混合物を分離し、単離された所望する異性体および / または当該方法に従って得ることができる式 I の遊離型化合物を塩に変換し、あるいは、当該方法に従って得ることができる式 I の遊離型化合物の塩を式 I の遊離型化合物または別の塩に変換する、請求項 1 に記載される式 I の化合物を個々に遊離型形態または塩形態で調製するための方法。

## 【請求項 3 0】

キャリアおよび / または分散化剤に加えて、請求項 1 に記載される式 I の少なくとも 1 つの化合物を有効成分として含有する、寄生虫を駆除するための組成物。

## 【請求項 3 1】

寄生虫の駆除における、請求項 1 に記載される式 I の化合物の使用。

## 【請求項 3 2】

請求項 1 に記載される式 I の少なくとも 1 つの化合物の効果的な量が寄生虫に対して使用される、寄生虫の駆除方法。

## 【請求項 3 3】

温血動物における寄生虫を駆除するための方法における、請求項 1 に記載される式 I の化合物の使用。

## 【請求項 3 4】

温血動物における寄生虫に対する薬学的組成物を調製する際の、請求項 1 に記載される式 I の化合物の使用。