

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

(21)(22) Заявка: 2013144215/15, 01.03.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
02.03.2011 JP 2011-045042

(43) Дата публикации заявки: 10.04.2015 Бюл. № 10

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 02.10.2013(86) Заявка РСТ:
JP 2012/055190 (01.03.2012)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2012/118139 (07.09.2012)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

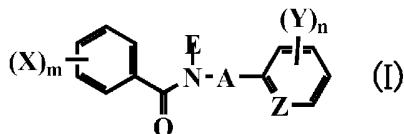
**НИХОН НОХИЯКУ КО., ЛТД. (JP),
ДЗЕ ЮНИВЕРСИТИ ОФ ТОКИО (JP)**

(72) Автор(ы):

**КИТА Кийоси (JP),
СУВА Акиюки (JP)**(54) **СРЕДСТВО ДЛЯ БОРЬБЫ С ЭНДОПАРАЗИТАМИ**

(57) Формула изобретения

1. Средство для борьбы с эндопаразитами, содержащее производное карбоксиамида, представленное общей формулой (I):



{ где А представляет собой (C₁-C₈) алкиленовую группу, необязательно, замещенную атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой; (C₁-C₈) алкиленовую группу, которая является, необязательно, замещенной атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой и является модифицированной посредством включения в углеродную цепь по меньшей мере одного гетероатома, выбранного из атома кислорода, атома серы, -SO-, -SO₂- и -N(R)- (где R представляет собой атом водорода, (C₁-C₆) алкильную группу, (C₃-C₆) циклоалкильную группу, (C₁-C₆) алкилкарбонильную группу или (C₁-C₆) алкоксикарбонильную группу); (C₂-C₈) алкениленовую группу, необязательно, замещенную атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой; (C₂-C₈) алкениленовую

группу, которая является, необязательно, замещенной атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой и является модифицированной посредством включения в углеродную цепь по меньшей мере одного гетероатома, выбранного из атома кислорода, атома серы, -SO-, -SO₂- и -N(R)- (где R является таким, как определено выше); (C₂-C₈) алкиниленовую группу, необязательно, замещенную атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой; или (C₂-C₈) алкиниленовую группу, которая является, необязательно, замещенной атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой и является модифицированной посредством включения в углеродную цепь по меньшей мере одного гетероатома, выбранного из атома кислорода, атома серы, -SO-, -SO₂- и -N(R)- (где R является таким, как определено выше), и в каждом случае, А может формировать циклическую структуру, где возможно,

Е представляет собой атом водорода; (C₁-C₆) алкильную группу; (C₃-C₆) циклоалкильную группу; (C₁-C₆) алкокси (C₁-C₆) алкильную группу; (C₁-C₆) алкилкарбонильную группу; или (C₁-C₆) алкоксикарбонильную группу,

каждый Х может являться одинаковым или различным, и представляет собой атом галогена; цианогруппу; нитрогруппу; (C₁-C₆) алкильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилтиогруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилсульфинильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; или (C₁-C₆) алкилсульфонильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена,

m представляет собой целое число от 0 до 5,

каждый Y может являться одинаковым или различным, и представляет собой атом галогена; цианогруппу; нитрогруппу; гидроксигруппу; (C₁-C₆) алкильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₂-C₆) алкенильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₂-C₆) алкинильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкокси (C₁-C₆) алкоксигруппу; (C₂-C₆) алкенилокси группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₂-C₆) алкинилокси группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилтиогруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилсульфинильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилсульфонильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкоксикарбонильную группу; (C₁-C₆) алкоксиимино (C₁-C₃) алкильную группу; (C₃-C₃₀) триалкилсилильную группу; моно(C₁-C₆) алкилсульфониламиногруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; фенильную группу, необязательно, замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из заместителей группы В; феноксигруппу, необязательно, замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из заместителей группы В; гетероциклическую группу, необязательно, замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из заместителей группы В; или гетероциклоксигруппу, необязательно замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из заместителей группы В,

где заместители группы В представляют собой атом галогена; цианогруппу; нитрогруппу; (C₁-C₆) алкильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена;

(C₂-C₆) алкенильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₂-C₆) алкинильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₂-C₆) алкенилоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₂-C₆) алкинилоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилтиогруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилсульфинильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкилсульфонильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C₁-C₆) алкоксикарбонильную группу; и (C₁-C₆) алкоксиимино (C₁-C₃) алкильную группу,

n представляет собой целое число от 0 до 5, при условии, что когда n представляет собой целое число от 2 до 5, две соседних группы Y могут соединяться вместе с формированием (C₃-C₅) алкиленовой группы; (C₃-C₅) алкениленовой группы; (C₂-C₄) алкиленоксигруппы; или (C₁-C₃) алкилендиоксигруппы, необязательно, замещенной атомом галогена, и

Z представляет собой атом азота; СН; или СY (где Y является таким, как определено выше)}, или

его соль в качестве активного ингредиента.

2. Средство для борьбы с эндопаразитами по п.1, где А представляет собой (C₁-C₈) алкиленовую группу, необязательно, замещенную атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой; или (C₁-C₈) алкиленовую группу, которая является, необязательно, замещенной атомом галогена, (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой и является модифицированной посредством включения в углеродную цепь по меньшей мере одного гетероатома, выбранного из атома кислорода, атома серы, -SO-, -SO₂- и -N(R)- (где R представляет собой атом водорода, (C₁-C₆) алкильную группу, (C₃-C₆) циклоалкильную группу, (C₁-C₆) алкилкарбонильную группу или (C₁-C₆) алкоксикарбонильную группу).

3. Средство для борьбы с эндопаразитами по п.1, где А представляет собой (C₁-C₈) алкиленовую группу, необязательно, замещенную (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой; -CR¹(R²)-CR³(R⁴)-Q- (где R¹, R², R³ и R⁴ могут являться одинаковыми или отличными друг от друга и представляют собой атом водорода, (C₁-C₆) алкильную группу или (C₃-C₆) циклоалкильную группу, или R¹, R², R³ и R⁴ могут соединяться вместе в любой комбинации с формированием (C₃-C₆) циклоалкана, и Q представляет собой атом кислорода, атом серы -SO-, -SO₂- или -N(R)- (где R представляет собой атом водорода, (C₁-C₆) алкильную группу, (C₃-C₆) циклоалкильную группу, (C₁-C₆) алкилкарбонильную группу или (C₁-C₆) алкоксикарбонильную группу)); или -CR¹(R²)-CR³(R⁴)-CR⁵(R⁶)-Q- (где R¹, R², R³, R⁴ и Q являются такими, как определено выше, и R⁵ и R⁶ могут являться одинаковыми или отличными друг от друга и представляют собой атом водорода, (C₁-C₆) алкильную группу или (C₃-C₆) циклоалкильную группу, или R¹, R², R³, R⁴, R⁵ и R⁶ могут соединяться вместе в любой комбинации с формированием (C₃-C₆) циклоалкана).

4. Средство для борьбы с эндопаразитами по п.1, где А представляет собой (C₁-C₈)

алкиленовую группу, необязательно, замещенную (C_1-C_6) алкильной группой и/или (C_3-C_6) циклоалкильной группой; $-CR^1(R^2)-CR^3(R^4)-Q-$ (где R^1, R^2, R^3 и R^4 могут являться одинаковыми или отличными друг от друга и представляют собой атом водорода, (C_1-C_6) алкильную группу или (C_3-C_6) циклоалкильную группу, или R^1, R^2, R^3 и R^4 могут соединяться вместе в любой комбинации с формированием (C_3-C_6) циклоалкана, и Q представляет собой атом кислорода, атом серы, $-SO-$, $-SO_2-$ или $-N(R)-$ (где R представляет собой атом водорода, (C_1-C_6) алкильную группу, (C_3-C_6) циклоалкильную группу, (C_1-C_6) алкилкарбонильную группу или (C_1-C_6) алкоксикарбонильную группу)); или $-CR^1(R^2)-CR^3(R^4)-CR^5(R^6)-Q-$ (где R^1, R^2, R^3, R^4 и Q являются такими, как определено выше, и R^5 и R^6 могут являться одинаковыми или отличными друг от друга и представляют собой атом водорода, (C_1-C_6) алкильную группу или (C_3-C_6) циклоалкильную группу, или R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 и R^6 могут соединяться вместе в любой комбинации с формированием (C_3-C_6) циклоалкана),

E представляет собой атом водорода; (C_1-C_6) алкильную группу; (C_1-C_6) алкилкарбонильную группу; или (C_1-C_6) алкоксикарбонильную группу,

каждый X может являться одинаковым или различным, и представляет собой атом галогена; (C_1-C_6) алкильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C_1-C_6) алкоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; или (C_1-C_6) алкилтиогруппу, необязательно, замещенную атомом галогена,

m представляет собой 1 или 2,

каждый Y может являться одинаковым или различным, и представляет собой атом галогена; гидроксигруппу; (C_1-C_6) алкильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C_1-C_6) алкоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; (C_1-C_6) алкокси (C_1-C_6) алкоксигруппу; (C_2-C_6) алкенилоксигруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; моно(C_1-C_6) алкилсульфониламиногруппу, необязательно, замещенную атомом галогена; фенильную группу, необязательно, замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из атома галогена, цианогруппы, нитрогруппы, (C_1-C_6) алкильной группы, необязательно, замещенной атомом галогена, и (C_1-C_6) алкоксигруппы, необязательно, замещенной атомом галогена; феноксигруппу, необязательно замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из атома галогена, цианогруппы, нитрогруппы, (C_1-C_6) алкильной группы, необязательно, замещенной атомом галогена, и (C_1-C_6) алкоксигруппы, необязательно, замещенной атомом галогена; гетероциклическую группу, необязательно, замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из атома галогена, цианогруппы, нитрогруппы, (C_1-C_6) алкильной группы, необязательно, замещенной атомом галогена, и (C_1-C_6) алкоксигруппы, необязательно, замещенной атомом галогена; или гетероциклическую группу, необязательно, замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из атома галогена, цианогруппы, нитрогруппы, (C_1-C_6) алкильной группы, необязательно, замещенной атомом галогена, и (C_1-C_6) алкоксигруппы, необязательно, замещенной атомом галогена,

n представляет собой целое число от 0 до 3, при условии, что когда n представляет собой 2 или 3, две соседних группы Y могут соединяться вместе с формированием

(C₂-C₄) алкиленоксигруппы или (C₁-C₃) алкилендиоксигруппы, необязательно, замещенной атомом галогена, и

Z представляет собой атом азота; СН; или СУ (где У является таким, как определено выше).

5. Средство для борьбы с эндопаразитами по п.1, где А представляет собой (C₁-C₅) алкиленовую группу, необязательно, замещенную (C₁-C₆) алкильной группой и/или (C₃-C₆) циклоалкильной группой; -CR¹(R²)-CR³(R⁴)-Q- (где R¹, R², R³ и R⁴ могут являться одинаковыми или различными друг от друга и представляют собой атом водорода, (C₁-C₆) алкильную группу или (C₃-C₆) циклоалкильную группу, и Q представляет собой атом кислорода или атом серы) или -CR¹(R²)-CR³(R⁴)-CR⁵(R⁶)-Q- (где R¹, R², R³, R⁴ и Q являются такими, как определено выше, и R⁵ и R⁶ могут являться одинаковыми или различными друг от друга и представляют собой атом водорода, (C₁-C₆) алкильную группу или (C₃-C₆) циклоалкильную группу,

Е представляет собой атом водорода,

каждый Х может являться одинаковым или различным, и представляет собой атом галогена или (C₁-C₆) алкильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена, m представляет собой 1,

каждый У может являться одинаковым или различным, и представляет собой атом галогена или (C₁-C₆) алкильную группу, необязательно, замещенную атомом галогена, n представляет собой целое число от 1 до 3, и

Z представляет собой атом азота; СН; или СУ (где У является таким, как определено выше).

6. Способ борьбы с эндопаразитами, включающий пероральное или парентеральное введение эффективного количества средства для борьбы с эндопаразитами по любому из пп.1-5 не относящемуся к человеку-млекопитающему или птице.

7. Способ борьбы с эндопаразитами, включающий пероральное или парентеральное введение эффективного количества средства для борьбы с эндопаразитами по любому из пп.1-5 не относящемуся к человеку-млекопитающему.

8. Способ по п.7, где не относящееся к человеку млекопитающее представляет собой домашнее животное.

А
5
1
2
4
2
1
5
1
0
2
4
1
4
1
3
1
0
2
4
1
4
2
1
5
А

RU
2
0
1
3
1
4
4
2
1
5
А