(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201326128 A1
(43)公開日： 中華民國 102 (2013) 年 07 月 01 日

(21)申請案號：101141259 (22)申請日： 中華民國 101 (2012) 年 11 月 07 日
(51)Int. Cl.： *C07D215/12 (2006.01)* *C07D409/12 (2006.01)*
A61K31/47 (2006.01) *A61K31/4709 (2006.01)*
A61P33/10 (2006.01)
(30)優先權：2011/11/28 美國 61/563,926
(71)申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US) 美國
(72)發明人：拉姆 喬治 菲利普 LAHM, GEORGE PHILIP (US)；卡爾 茂米它 KAR, MOUMITA (IN)
(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：14 項 圖式數：0 共 140 頁

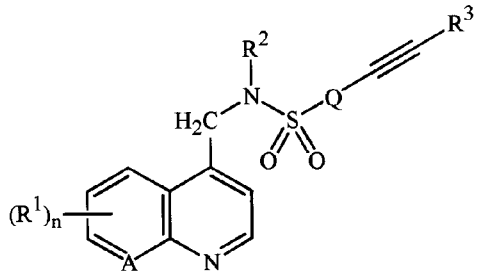
(54)名稱

磺醯胺驅蟲劑

SULFONAMIDE ANTHELMINTICS

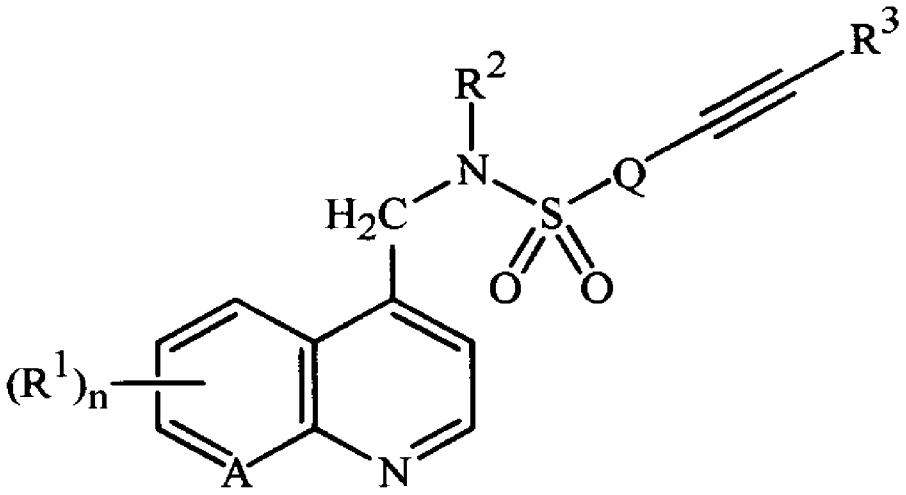
(57)摘要

本文揭露式 1 化合物、N-氧化物及其鹽類，



1

其中 Q、A、R^1、R^2、R^3 及 n 如揭露中所定義。亦揭露者為含有式 1 化合物之組成物及用以治療蠕蟲感染之方法，該方法包含對一動物投予一殺寄生蟲有效量的本發明化合物或組成物。



1

(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201326128 A1
(43)公開日： 中華民國 102 (2013) 年 07 月 01 日

(21)申請案號：101141259 (22)申請日： 中華民國 101 (2012) 年 11 月 07 日
(51)Int. Cl.： *C07D215/12 (2006.01)* *C07D409/12 (2006.01)*
A61K31/47 (2006.01) *A61K31/4709 (2006.01)*
A61P33/10 (2006.01)
(30)優先權：2011/11/28 美國 61/563,926
(71)申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US) 美國
(72)發明人：拉姆 喬治 菲利普 LAHM, GEORGE PHILIP (US)；卡爾 茂米它 KAR, MOUMITA (IN)
(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：14 項 圖式數：0 共 140 頁

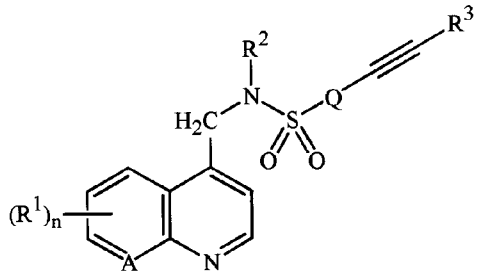
(54)名稱

磺醯胺驅蟲劑

SULFONAMIDE ANTHELMINTICS

(57)摘要

本文揭露式 1 化合物、N-氧化物及其鹽類，



1

其中 Q、A、R^1、R^2、R^3 及 n 如揭露中所定義。亦揭露者為含有式 1 化合物之組成物及用以治療蠕蟲感染之方法，該方法包含對一動物投予一殺寄生蟲有效量的本發明化合物或組成物。

201326128

發明專利說明書

（本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫）

※申請案號：101141259

※申請日：101.11.07

※IPC 分類：C07D215/12 (2006.01)
C07D409/12 (2006.01)
A61K31/47 (2006.01)
A61K31/4709 (2006.01)
A61P33/10 (2006.01)

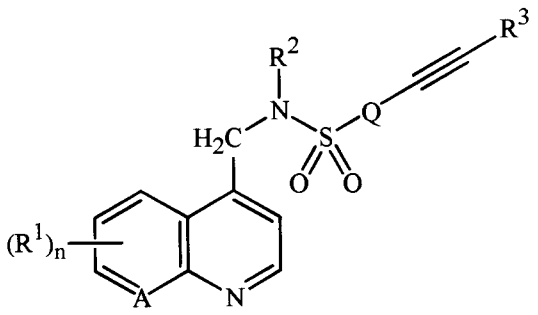
一、發明名稱：（中文/英文）

磺醯胺驅蟲劑

SULFONAMIDE ANTHELMINTICS

二、中文發明摘要：

本文揭露式 1 化合物、*N*-氧化物及其鹽類，



1

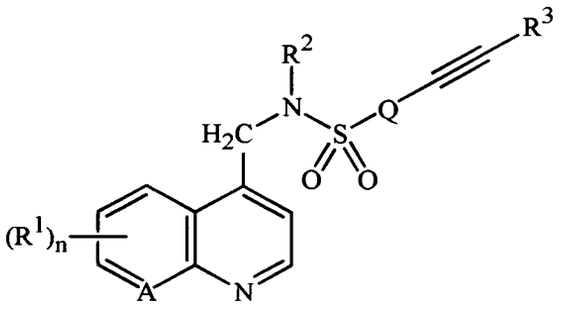
其中

Q、A、R^1、R^2、R^3及 n 如揭露中所定義。

亦揭露者為含有式 1 化合物之組成物及用以治療蠕蟲感染之方法，該方法包含對一動物投予一殺寄生蟲有效量的本發明化合物或組成物。

三、英文發明摘要：

Disclosed are compounds of Formula 1, N-oxides, and salts thereof,



1

wherein

Q, A, R^1, R^2, R^3 and n are as defined in the disclosure.

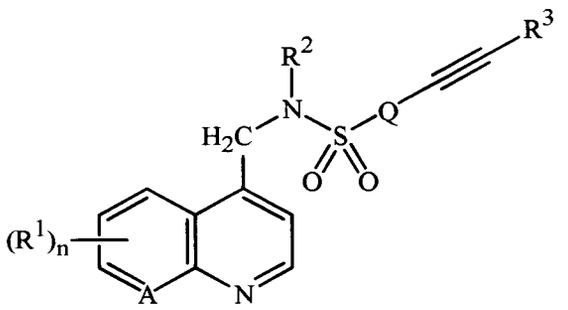
Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for treating helminth infections comprising administration to an animal a parasiticidally effective amount of a compound or a composition of the invention.

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（無）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



1

六、發明說明：

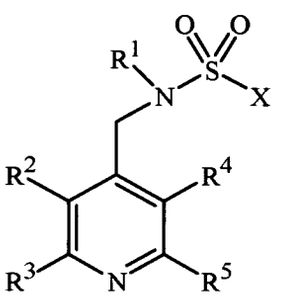
【發明所屬之技術領域】

本發明係關於某些喹啉化合物、其 *N*-氧化物、鹽類及其適用於動物健康用途的組成物，以及彼等用於治療動物的蠕蟲感染之方法。

【先前技術】

動物寄生蟲之控制對動物健康是必要的，尤其在食物製造與同伴動物之領域。因對目前商業上殺蟲劑之抗藥性持續增加，現有的治療與寄生蟲控制之方法正受到威脅。對於更有效、較便宜、毒性較低或具有不同作用位置的新化合物有持續的需求，以控制動物寄生蟲。

世界專利申請案公開案第 WO 2006/097488 號揭露式 i 吡啶化合物，用於防治節肢動物害蟲。

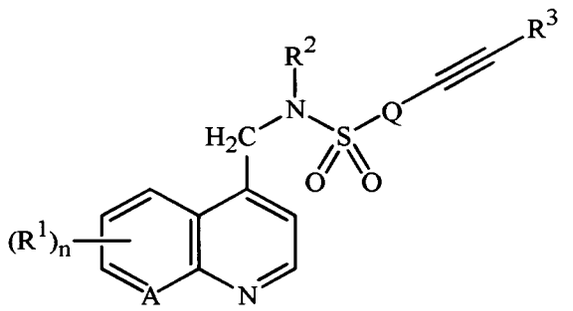


i

本發明之喹啉化合物在此公開之專利中並未被揭露。

【發明內容】

本發明係關於式 1 化合物（包括所有立體異構物）、*N*-氧化物及其鹽類，以及含有彼等之組成物及其用於治療動物的蠕蟲感染之用途：



1

其中

Q 為苯基或萘基，各選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{4a} 的取代基取代；或

Q 為 5 至 6 員雜芳環或 8 至 11 員雜芳雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多 4 個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 及至多 4 個 N 原子，並且該環或環系選擇性地經至多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{4a} 及氮原子環員上的 R^{4b} 的取代基取代；

A 為 N、CH 或 CR^1；

各 R^1 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、

5

$C(O)OR^9$ 、 $C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^2 為氫、氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^3 為氫、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$、$S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 或 $Si(R^{13})_3$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、

OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或G。

G為5至6員芳族雜環、3至7員非芳族雜環或8至11員芳族或非芳族雜環雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多4個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多2個O、至多2個S及至多4個N原子，並且該環或環系選擇性地經至多5個獨立選自碳原子環員上的R^{5a}及氮原子環員上的R^{5b}的取代基取代；

各R^{4a}係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、OR^6及$S(O)_pR^{12}$所組成之群組的取代基取代；

R^{4b}為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、

$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5b} 為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4

鹵烷基、OR^6及$S(O)_pR^{12}$所組成之群組的取代基取代；

各R^6係獨立為氫、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基、C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基或C_3–C_6二烷基胺基磺醯基；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6烷氧基、C_1–C_6烷基胺基、C_2–C_8二烷基胺基、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基、C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基及C_3–C_6二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基亞磺醯基及C_1–C_4烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各R^{7a}係獨立為氫、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基或C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基或C_3–C_6二烷基胺基磺醯基；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選

自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6烷氧基、C_1–C_6烷基胺基、C_2–C_8二烷基胺基、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基、C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基及C_3–C_6二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基亞磺醯基及C_1–C_4烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各R^{7b}係獨立為氫；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6烷氧基、C_1–C_6烷基胺基、C_2–C_8二烷基胺基、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基、C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基及C_3–C_6二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

R^8、R^9、R^{10}及R^{12}各獨立為氫；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基、苯基、苄基、C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4

鹵烷氧基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_2–C_8二烷基胺基羰基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基亞磺醯基、C_1–C_4烷基磺醯基、C_1–C_4鹵烷基硫基、C_1–C_4鹵烷基亞磺醯基及C_1–C_4鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各R^{11}係獨立為氫；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4鹵烷氧基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基亞磺醯基、C_1–C_4烷基磺醯基、C_1–C_4鹵烷基硫基、C_1–C_4鹵烷基亞磺醯基及C_1–C_4鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各R^{13}係獨立為C_1–C_6烷基或苯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、C_1–C_4烷基及C_1–C_4鹵烷基所組成之群組的取代基取代；

n為0、1、2、3、4或5；以及

p係0、1或2。

本發明亦關於這種式1化合物（包括所有的立體異構物）、*N*-氧化物及其鹽類，以及含有彼等之組成物及其用於治療需要此類蠕蟲感染治療的動物之用途。

本發明亦提供一組成物，該組成物包含一殺寄生蟲有效量的式1化合物、一*N*-氧化物或其鹽類，以及至少一醫藥上或獸醫上可接受載劑或稀釋劑。在一個實施例中，本發明亦提供一組成物，該組成物包含一殺寄生蟲有效量的式1化合物、一*N*-氧化物或其鹽類，以及

至少一醫藥上或獸醫上可接受載劑或稀釋劑，該組成物進一步包含至少一額外的生物活性化合物或藥劑。

本發明提供一種治療需要此類蠕蟲感染治療的動物之方法，其包含對該動物口服、局部、腸外或皮下投予一殺寄生蟲有效量的式 1 化合物、一 *N*-氧化物或一醫藥上或獸醫上可接受鹽或一包含彼等之組成物。

【實施方式】

如本文中所使用，術語「包含」、「包括」、「具有」、「含有」、「特徵為」或該術語任何其他的變化，旨在涵蓋非排他性的包含，並受到任何明確表示的限制。例如，包含元素列表的組成物、混合物、製程或方法不必僅限於那些元素，而是可以包括未明確列出的或該組成物、混合物、製程或方法所固有的其他元素。

連接詞「由.....組成」則排除任何未明確說明的元素、步驟或成分。如果是在申請專利範圍中，這樣的用詞將會封閉申請專利範圍，使其除了在通常會與其相關的雜質之外，不包括那些在列舉以外的物質。當該連接詞「由.....組成」出現在申請專利範圍主體的子句，而非緊接著序言，其只限制在該子句中提到的元素；其他元素上不會從申請專利範圍整體(the claim as a whole)中被排除。

連接詞「主要由.....組成」用於定義包括除了那些字面上所揭露以外的材料、步驟、特徵、成分或元素的組成物或方法，但前提是這些額外的材料、步驟、特徵、成分或元素並不會實質影響申請專利範圍所主張發明

的基本和新穎特性。用語「主要由.....組成」居於「包含」與「由.....組成」之間的中間地帶。

當申請人用開放式術語，像是「包含」，定義發明或其中一部分時，應容易理解（除非另有說明）該敘述應解釋為也使用術語「主要由.....組成」或「由.....組成」來說明該發明。

此外，除非有相反的明確說明，「或」是指涵括性的「或」，而不是指排他性的「或」。例如，以下任何一種情況均滿足條件A或B：A是真實的（或存在的）且B是虛假的（或不存在的），A是虛假的（或不存在的）且B是真實的（或存在的），以及A和B都是真實的（或存在的）。

同樣地，位於本發明之元素或成份之前的不定冠詞「一」及「一個」旨在非限制性地說明該元素或成份的實例數目（即出現數）。因此「一」或「一個」應理解為包括一個或至少一個，且該元素或成分的單數詞形也包括複數，除非該數目顯然是指單數。

如本揭露中提到的，術語「體內寄生蟲」是住在動物內部的寄生蟲，且「體外寄生蟲」是住在動物表面上的寄生蟲。

如本揭露中提到的，術語「蠕蟲」包括絲蟲、蛔蟲（線蟲）、吸蟲（吸蟲綱）、棘頭動物和絛蟲（絛蟲綱）。

動物健康用途包括以本發明之化合物治療需要該種治療的動物，以控制當前受蠕蟲寄生害蟲的感染，其係藉由對該動物投予一殺寄生蟲有效量的本發明化合物，通常是以配製成獸醫或醫藥使用的組成物形式。此

外，本發明亦設想以本發明之化合物預防性治療需要該種治療的動物，使得蠕蟲寄生害蟲的感染被防止而減少其嚴重性（與處於未處理狀態下情況類似的動物相比較），其係藉由對該被保護動物投予一殺寄生蟲有效量的本發明化合物，通常是以配製成獸醫或醫藥使用的組成物形式。動物可以是人類（醫藥使用）或非人類（獸醫使用）。

「殺寄生蟲有效量」是達到減少蠕蟲寄生蟲出現或活動的顯著效果所需的活性成分量。殺蟲的效果通常指目標寄生性蠕蟲害蟲的出現或活動降低。該在害蟲上之效果包含細胞壞死、死亡、生長遲緩、活動減低或持續在宿主動物體內的能力降低、餵食下降及繁殖的抑制。此等在蠕蟲寄生害蟲之效果提供動物寄生感染之控制（包括預防、減低或消除）。熟悉技藝人士可察知殺寄生蟲有效劑量會因本發明之不同化合物與組成物而變化、理想的殺寄生蟲效果與持續時間、目標害蟲種類、欲保護的動物、使用模式與相似者以及可經由簡單的實驗確認達到特定結果所需的量。

「治療」當應用於感染時是指減少任何感染的嚴重性，該感染在缺乏治療下可以以其他方式發生，該治療可包括完全控制或預防此類感染。不受理論的約束，此類治療可以藉由抑制或中斷寄生蠕蟲的生命週期（包括成熟、死亡率、餵食減少及/或交配干擾）而得到對感染的「控制」。

如本揭露中所指，術語「驅蟲劑」係指可用於控制蠕蟲的物質（藥物），例如藉由有助於從動物的身體驅逐寄生蟲（蠕蟲），無論是使之暈倒或殺死他們。

假使動物目前被蠕蟲感染或處於被蠕蟲感染的危險，則該動物處於「需要治療」。

「腸外」作為一種投藥模式意指以除了經由消化道以外的方式帶入體內或投予，例如藉由注射及局部投予。

「腸內」作為一種投藥模式意指經由消化道帶入體內或投予，例如口服投予。

「局部」作為一種投藥模式意指施加於皮膚。瞭解到，局部投予視投予的化合物及包含該化合物之配方而定可具有全身性效果。

在上述說明中，用語「烷基」無論是單獨使用或在複合詞如「烷硫基」或「鹵烷基」中使用，皆包括直鏈或支鏈烷基，諸如甲基、乙基、正丙基、異丙基或各種之丁基、戊基或己基異構物。「烯基」包括直鏈或支鏈烯類，如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、以及各種的丁烯基、戊烯基及己烯基異構物。「烯基」也包括多烯類，如 1,2-丙二烯基及 2,4-己二烯基。「炔基」包括直鏈或支鏈炔類，如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、以及各種的丁炔基、戊炔基及己炔基異構物。「炔基」亦包括含複數叁鍵的部分(moieties)，如 2,5-己二炔基。「伸烷基」表示直鏈或支鏈烷二基（alkanediyl）。「伸烷基」的實例包括 CH_2、CH_2CH_2、$CH(CH_3)$、$CH_2CH_2CH_2$、$CH_2CH(CH_3)$及各種的伸丁基異構物。「伸烯基」表示直

鏈或支鏈的含有一個烯烴鍵結之烯二基（alkenediyl）。「伸烯基」的實例包括 CH=CH、CH_2CH=CH、CH=C(CH_3)及各種的伸丁烯基（butenylene）異構物。「伸炔基」表示直鏈或支鏈的含有一個三鍵之炔二基（alkynediyl）。「伸炔基」的實例包括 C≡C、CH_2C≡C、C≡CCH_2 及各種的伸丁炔基（butynylene）異構物。

「環烷基」包括例如環丙基、環丁基、環戊基和環己基。用語「環烷基烷基」意指在烷基部分上有環烷基取代。「環烷烷基」的實例包括環丙甲基、環戊乙基與其他鍵結至直鏈或支鏈烷基基團的環烷基基團。「環烯基」包括如環戊烯基及環己烯基的基團以及有一個以上雙鍵的基團，如 1,3-及 1,4-環己二烯基。術語「環烷氧基」代表連結至一氧原子與經由一氧原子來連接之環烷基，像是環戊氧基與環己氧基。「烷環烷烷基」表示經烷環烷基取代之烷基基團。「烷環烷烷基」的實例包括 1-、2-、3-或 4-甲基或-乙基環己甲基。用語「環烷基環烷基」意指在另一個環烷基環上有環烷基取代，其中各環烷基環獨立有 3 至 7 個碳原子環員。環烷環烷基的例子包括環丙環丙基（例如：1,1'-二環丙基-1-基，1,1'-二環丙基-2-基））、環己環戊基（例如：4-環戊環己基）及環己環己基（例如：1,1'-二環己基-1-基），及不同的順向與反向環烷基環烷基異構物（例如：(1R,2S)-1,1'-二環丙基-2-基及(1R,2R)-1,1'-二環丙基-2-基）。

用語「鹵素」無論是單獨使用或在複合詞如「鹵烷基」中使用，或者當使用於如「經鹵素取代之烷基」的描述中時，其包括氟、氯、溴或碘。此外，當在像是「鹵

烷基」的複合詞中使用時，或者在像是「經鹵素取代的烷基」的敘述中使用時，所述烷基可能經相同或不同的鹵素原子部分或全部取代。「鹵烷基」或「經鹵素取代之烷基」的實例包括 $_3$、CH_2Cl、CH_2CF_3 與 CCl_2CF_3。術語「鹵烯基」、「鹵炔基」「鹵烷氧基」、「鹵烷硫基」、「鹵烷胺基」、「鹵烷亞磺醯基」、「鹵烷磺醯基」、「鹵環烷基」、及類似者之定義與術語「鹵烷基」類似。「鹵烯基」的實例包括$(Cl)_2C=CHCH_2$及 $CF_3CH_2CH=CHCH_2$。「鹵炔基」的實例包括 HC≡CCHCl、$CF_3C\equiv C$、$CCl_3C\equiv C$及 $FCH_2C\equiv CCH_2$。「鹵烷氧基」的實例包括 CF_3O、CCl_3CH_2O、$HCF_2CH_2CH_2O$ 及 CF_3CH_2O。「鹵烷硫基」的實例包括 CCl_3S、CF_3S、CCl_3CH_2S 及 $ClCH_2CH_2CH_2S$。「鹵烷胺基」的實例包括 $CF_3(CH_3)CHNH$、$(CF_3)_2CHNH$ 與 CH_2ClCH_2NH。「鹵烷亞磺醯基」的實例包括 $CF_3S(=O)$、$CCl_3S(=O)$、$CF_3CH_2S(=O)$與 $CF_3CF_2S(=O)$。「鹵烷磺醯基」的實例包括 $CF_3S(=O)_2$、$CCl_3S(=O)_2$、$CF_3CH_2S(=O)_2$ 與 $CF_3CF_2S(=O)_2$。「鹵環烷基」的實例包括 2-氯環丙基、2-氟環丁基、3-溴環戊基與 4-氯環己基。該術語「鹵二烷基」，無論是單獨使用或在像是「鹵二烷基胺基」的複合詞中使用，意指兩個烷基基團中的至少一個被至少一個鹵素原子取代，且獨立各鹵化的烷基團可部分或全部被相同的或不同的鹵素原子取代。「鹵二烷基胺基」之實例包括$(BrCH_2CH_2)_2N$ 與 $BrCH_2CH_2(ClCH_2CH_2)N$。

「烷氧基」包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基和各種的丁氧基、戊氧基和己氧基異構物。「烷

氧烷基」代表在烷基上之烷氧基取代。「烷氧烷基」的實例包括 CH_2OCH_3、$CH_2CH_2OCH_3$、$CH_2OCH_2CH_3$、$CH_2OCH_2CH_2CH_2CH_3$ 與 $CH_2CH_2OCH_2CH_3$。「烯氧基」包括一連結至一氧原子或透過一氧原子連接之直鏈或支鏈烯基。「烯氧基」的實例包括 $H_2C=CHCH_2O$、$(CH_3)_2C=CHCH_2O$、$(CH_3)CH=CHCH_2O$、$(CH_3)CH=C(CH_3)CH_2O$ 與 $CH_2=CHCH_2CH_2O$。「炔氧基」包括直鏈或支鏈炔氧基部分。「炔氧基」的實例包括 $HC\equiv CCH_2O$、$CH_3C\equiv CCH_2O$ 與 $CH_3C\equiv CCH_2CH_2O$。

術語「烷基硫基」(alkylsulfenyl)或「烷硫基」(alkylthio)包括直鏈或支鏈烷硫基部分，像是甲硫基、乙硫基以及各種的丙硫基、丁硫基、戊硫基及己硫基異構物。「烷亞磺醯基」包含一烷亞磺醯基基團之兩個鏡像異構物。「烷亞磺醯基」的實例包括 $CH_3S(=O)$、$CH_3CH_2S(=O)$、$CH_3CH_2CH_2S(=O)$、$(CH_3)_2CHS(=O)$和各種不同之丁亞磺醯基、戊亞磺醯基與己亞磺醯基異構物。「烷磺醯基」的實例包括 $CH_3S(=O)_2$、$CH_3CH_2S(=O)_2$、$CH_3CH_2CH_2S(=O)_2$、$(CH_3)_2CHS(=O)_2$和各種不同之丁磺醯基、戊磺醯基與己磺醯基異構物。用於本文中之 S(O)與 S(=O)的化學縮寫代表一亞磺醯基部分。用於本文中之 SO_2、$S(O)_2$ 與 $S(=O)_2$ 的化學縮寫代表一磺醯基部分。

「烷胺基」意指一被直鏈或支鏈烷基取代之 NH 自由基。「烷胺基」的實例包括 $NHCH_2CH_3$、$NHCH_2CH_2CH_3$ 及 $NHCH_2CH(CH_3)_2$。「二烷胺基」意指被兩個直鏈或支鏈烷基基團獨立取代之 N 自由基。「二烷胺基」的實例

包括 $N(CH_3)_2$、$N(CH_3CH_2CH_2)_2$ 與 $N(CH_3)CH_2CH_3$。「鹵二烷胺基」意指一鍵結至一 N 自由基之直鏈或支鏈的烷基部分與直鏈或支鏈的鹵烷基部分，或兩個獨立鍵結至一 N 自由基之直鏈或支鏈的鹵烷基部分，其中「鹵烷基」係如上述之定義。「鹵二烷胺基」的實例包括 $N(CH_2CH_3)(CH_2CH_2Cl)$與 $N(CF_2CF_3)_2$。

「烷羰基」意指一鍵結到一 C(O)部分之直鏈或支鏈烷基部分。在本文中所使用之化學縮寫 C(O)與 C(=O)代表一羰基部分。「烷羰基」的實例包括 $C(O)CH_3$、$C(O)CH_2CH_2CH_3$ 與 $C(O)CH(CH_3)_2$。「鹵烷羰基」的實例包括 $C(O)_3$、$C(O)CCl_3$、$C(O)CH_2CF_3$ 與 $C(O)CF_2CF_3$。

「烷氧羰基」意指一鍵結至一 CO_2 部分之直鏈或支鏈烷基部分。在本文中所使用之化學縮寫 CO_2、C(O)O 與 C(=O)O 代表氧羰基部分。「烷氧羰基」的實例包括 $C(O)OCHC(O)OCH_3$、$C(O)OCH_2CH_3$、$C(O)OCH_2CH_2CH_3$ 與 $C(O)OCH(CH_3)_2$。

「烷胺羰基」意指一鍵結至一 C(O)NH 部分之直鏈或支鏈烷基部分。本文中所使用之化學縮寫 C(O)NH 及 C(O)N 代表醯胺部分（即胺羰基基團）。「烷胺羰基」的實例包括 $C(O)NHCH_3$、$C(O)NHCH_2CH_2CH_3$ 及 $C(O)NHCH(CH_3)_2$。「二烷胺羰基」意指兩個獨立鍵結至 C(O)N 部分的直鏈或支鏈烷基部分。「二烷胺羰基」的實例包括 $C(O)N(CH_3)_2$ 與 $C(O)N(CH_3)(CH_2CH_3)$。

「三烷矽基」包括 3 個經由矽原子附著以及連結之支鏈及/或直鏈烷基，例如：三甲矽烷基、三乙矽烷基及三級-丁二甲矽烷基。

「CHO」意指甲醯基，「OCN」意指-O-C≡N，以及「SCN」意指-S-C≡N。

取代基中的碳原子總數以字首「C_i–C_j」表示，其中 i 和 j 為 1 到 14 的數字。例如，C_1–C_4 烷基表示從甲基到丁基；C_2 烷氧烷基表示 CH_2OCH_3；C_3 烷氧烷基表示，例如：$CH_3CH(OCH_3)$、$CH_2CH_2OCH_3$ 或 $CH_2OCH_2CH_3$；以及 C_4 烷氧烷基表示一烷基基團之各種不同異構物，該烷基基團被總共包含四個碳原子的烷氧基團所取代，實例包括 $CH_2OCH_2CH_2CH_3$ 與 $CH_2CH_2OCH_2CH_3$。

當一基團含有一個可為氫的取代基時，例如 R^2，則當此取代基作為氫時，視為相當於該基團未被取代。當一可變基團顯示為選擇地連接到一位置上，例如式 1 中的$(R^1)_n$且其中可以為 0，則氫可能在該位置上，即使該可變基團的定義中並未提及。當描述基團上的一或多個位置為「未經取代」或「未取代」時，則氫原子係連接以佔據任何自由價。

$(R^1)_n$與喹啉雙環系之間的連接點圖示為浮動的。此意味著$(R^1)_n$可以與喹啉雙環系上任何可得的碳原子環員連接。

除非另有說明，做為式 1 化合物之「環」或「環系」係碳環或雜環。術語「環系」代表兩個或更多連結的環。術語「雙環系」代表一個由兩個共享兩個或更多共同原子之環所組成之環系。

術語「環員」意指形成環或環系主鏈的原子（例如 C、O、N 或 S）。術語「芳香族」意指每個環原子基本

上在同一平面上，並有一個 p-軌道垂直於該環平面，且 (4n + 2) π 電子（其中 n 為正整數）與該環或環系聯結以遵守休克耳定則(Hückel's rule)。

關於一環或環系之「部分飽和」與「部分未飽和」意指該環或環系內含至少一個雙鍵，但此環或環系非芳香族化合物。倘至少一組成中的環為芳香族，則此環系為芳香族。

術語「碳環」表示一個環，其中形成該環主鏈的原子係僅選自碳。除非另有說明，一碳環可以為飽和、部分不飽和或完全不飽和環。當一完全不飽和碳環滿足休克耳定則，則所述環也被稱為「芳環」。「飽和碳環」意指一環，其主鏈係由以單鍵互相連接的碳原子所組成；除非有特別說明，餘下的碳價由氫原子佔據。

術語「雜環」表示一環，其中至少一個形成環主鏈的原子不是碳。除非另有說明，雜環可以為飽和、部分不飽和或完全不飽和環。「飽和雜環」意指一個在環員之間僅包含單鍵的雜環。「部分飽和雜環」意指含有至少一個雙鍵但非為芳香族化合物的雜環。術語「雜芳環」代表一完成不飽和芳環，其中至少一個形成該環主鏈的原子非碳。通常一雜芳環內含至多 4 個氮原子、至多 1 個氧原子以及至多 1 個硫原子。除非另有說明，雜芳環可透過任何可得的碳或氮連接，該連接係藉由在該碳或氮上置換氫。術語「雜芳雙環系」表示一由兩個稠環所組成之環系，其中兩個環中至少一個為如前所定義之雜芳環。

當一個自由基（如：Q定義之5至6員雜芳環）選擇性地經所列之取代基以取代基說明之數量所取代時（如：「至多5個」），則該自由基可能為未被取代的，或被數量範圍至多達所述高值（如：「5」）之取代基取代，以及該連接的取代基係獨立選自所列之取代基。

當一取代基（如 R^1 為環烷基）為一環或環系，其可透過任何可得的環員連接至式1之其餘部分，除非另有說明。

如上所指出的，尤其是5至6員雜芳環或8至11員雜芳雙環系，Q含有選自碳原子及至多4個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多2個O、至多2個S及至多4個N原子，並且Q選擇性地經至多5個獨立選自碳原子環員上的 R^{4a} 及氮原子環員上的 R^{4b} 的取代基取代。在此定義下，該選自至多2個O、至多2個S及至多4個N的環員為選擇性的，因為雜原子環員之數量可能為零。當無雜原子環員存在時，該環或環系為碳環。倘至少一個雜原子環員存在，則該環或環系為雜環。氮原子環員可被氧化為 *N*-氧化物，因為與式1有關的化合物也包括 *N*-氧化物的衍生物。由於 R^{4a} 及 R^{4b} 取代基為選擇性的，故可能存在有0到5個取代基，並僅受可得之連接點數目的限制。

術語「未經取代」關連至一基團像是環或環系時，意指該基團除了其一個或多個連接到式1其餘部分的連接物外，沒有任何取代基。用語「選擇性地經取代」意指取代基的數目可以為零。除非另有說明，選擇性地經取代的基團可經和可容許數目一樣多的可選擇性取

代基取代，藉由以非氫取代基在任何可得的碳原子或氮原子上取代氫原子。一般而言，選擇性的取代基（若存在）數量範圍為從 1 至 4。

該視情況取代基之數目可被一表示之限制因素所限定。例如，片語「選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{4a} 的取代基取代」，意指可以存在有 0、1、2、3、4 或 5 個取代基（如果可能的連接點數目允許的話）。當取代基數目的特定範圍超出環上可得的取代基之位置數目時，實際範圍的較高部分被認為是可得位置的數目。

當選擇性取代基的數目未被陳述的限制所限制（如：片語「選擇性地經取代」或「未經取代或經至少一個取代基取代，該取代基獨立選自」），其可被理解為其意指選擇性的取代基數目之範圍從 0 至可得位置之數目。熟悉技藝人士將明瞭，當某些取代基像是鹵素可存在於每個可得的位置例如（：C_2F_5 取代基係一 C_2 烷基團被最多 5 個氟原子取代），像是成本與合成之可及性的實際因素會限制其他取代基出現之數目。此等限制為一般合成知識的一部分，其為熟習該領域之技藝人士所知悉。值得注意的是，當實施例中對選擇性的取代基數目未加限制時，若可得位置數目可容納，則選擇性的取代基數目至多 3 個（即 0、1、2 或 3 個）。

本發明的化合物可以存在有一或多種立體異構物。各種立體異構物包括鏡像異構物、非鏡像異構物、阻轉異構物和幾何異構物。熟習該項技術者將明瞭，一個立體異構物當相對於其他立體異構物經濃化或當從其他立體異構物經分離出時，可能活性更高及/或可能

展示出有益的效果。此外，熟習該項技術者知道如何分離、濃化及/或選擇性地製備所述立體異構物。本發明的化合物可以存在為立體異構物的混合物、個別立體異構物或光學活性形式。

選自式 1 的化合物（包括所有立體異構物、*N*-氧化物及其鹽類），通常存在不止一種形式，且式 1 因此包括式 1 所代表化合物的所有晶形和非晶形。非結晶形式包括固體實施例諸如蠟與膠，以及液體實施例諸如溶液與熔體。結晶形式包括基本上代表一單晶類型的實施例及代表一多形體（即不同的結晶類型）混合物的實施例。用語「多形體」意指一種化合物的特定結晶形式，該化合物可以不同結晶形式結晶，這些形式在晶格內具有不同的分子排列與/或構形。雖然多形體可具有相同之化學組成，它們亦可有不同的組成，因為有或無共結晶之水或其他分子的存在，其可弱或強地鍵結於晶格內。多形體可以在化學、物理和生物特性有所不同，像是晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、懸浮率、溶解速率和生物利用度。熟習該領域之技藝人士將明瞭，式 1 所代表的一化合物之一多形體相對於式 1 所代表的同樣化合物之另一多形體或多形體混合物，可展示出有益的效果（例如，適合製備有用的製劑，改進生物性效能）。式 1 所示之化合物的特定多形體的製備和分離可以藉由熟悉該項技術之人士已知的方法完成，包括例如使用選定的溶劑和溫度來結晶。

熟習該領域之技藝人士將明瞭，並非所有含氮雜環皆可形成氮氧化物，因為氮原子需要一個可利用的孤立電子對以氧化成氧化物；熟習該項技術者亦將明瞭三級胺可形成 *N*-氧化物。製備雜環及三級胺之 *N*-氧化物的合成方法為熟悉該項技術之人士中眾所皆知，包括以如過氧乙酸和 3-氯過氧苯甲酸(MCPBA)的過氧酸、過氧化氫、如第三丁基過氧化氫的烷基氫過氧化物、過硼酸鈉及如二甲基雙環氧乙烷的雙環氧乙烷來氧化雜環及三級胺。此些製備氮氧化的方法已在文獻中經廣泛地描述以及回顧，例如：T. L. Gilchrist 在 Comprehensive Organic Synthesis，第 7 卷，第 748–750 頁，S. V. Ley, Ed., Pergamon Press；M. Tisler 與 B. Stanovnik 在 Comprehensive Heterocyclic Chemistry，第 3 卷，第 18–20 頁，A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press；M. R. Grimmett 與 B. R. T. Keene 在 Advances in Heterocyclic Chemistry，第 43 卷，第 149–161 頁，A. R. Katritzky, Ed., Academic Press；M. Tisler 與 B. Stanovnik 在 Advances in Heterocyclic Chemistry，第 9 卷，第 285–291 頁，A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton, Eds., Academic Press；以及 G. W. H. Cheeseman 與 E. S. G. Werstiuk 在 Advances in Heterocyclic Chemistry，第 22 卷，第 390–392 頁，A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton, Eds., Academic Press。

熟習該項技術者會瞭解到，因為化合物的鹽與它們對應的非鹽形式在環境和生理條件下會處於平衡狀態，所以鹽會分享非鹽形式的生物效用。因此，廣泛各

種式 1 化合物的鹽類可用於動物寄生蟲之控制（即適合動物健康之用途）。式 1 化合物的鹽類包括含有機酸或無機酸的酸加成鹽類，酸像是氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、延胡索酸、乳酸、順丁烯二酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。當式 1 化合物含有一酸性部分諸如羧酸或酚，則鹽亦包括那些以有機或無機鹼形成者，諸如吡啶、三乙胺或氨，或醯胺、氫化物、氫氧化物或鈉、鉀、鋰、鈣、鎂或鋇之碳酸鹽。因此，本發明包含選自式 1、*N*-氧化物與其鹽類之化合物。

如發明內容中所述之本發明實施例包括以下所述。在以下之實施例中，式 1 包括立體異構物、*N*-氧化物與其鹽類，並且提及「一個式 1 化合物」時係包括在本發明總覽中特定的取代基定義，除非在實施例中有進一步之定義。

在以下實施例中，當「獨立」一詞之描述使用在多於一個欲定義之變數前時，意謂該定義為可應用至各個變數並且獨立於其他變數。

實施例 1. 一種式 1 化合物，其中各 R^1 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_3 烷基或 C_1–C_3 鹵烷基。

實施例 2. 一種實施例 1 之化合物，其中各 R^1 係獨立為氟、氯、CH_3、CF_3、OCF_3 或 $OCHF_2$。

實施例 2a. 一種實施例 2 之化合物，其中各 R^1 係獨立為氟。

實施例 3. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 2 之任一化合物，其中 n 為 0、1 或 2。

實施例 4. 一種實施例 3 之化合物，其中 n 為 0。

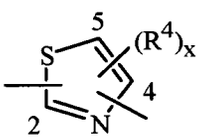
實施例 5. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 4 之任一化合物，其中 R^2 為氫、C_1–C_6 烷基、C_1–C_6 鹵烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 鹵烯基或 C_2–C_6 炔基。

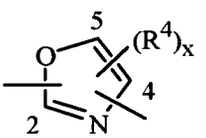
實施例 6. 一種實施例 5 之化合物，其中 R^2 為氫或甲基。

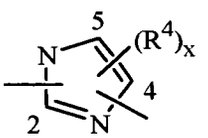
實施例 7. 一種實施例 6 之化合物，其中 R^2 為氫。

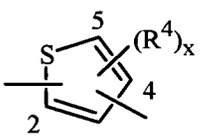
實施例 8. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 7 之任一化合物，其中 Q 為選自於由展示 1 中之 Q-1 至 Q-42 所組成之群組的環

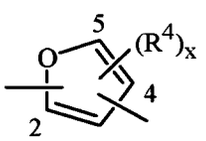
展示 1

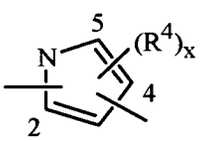

Q-1、

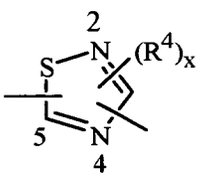

Q-2、

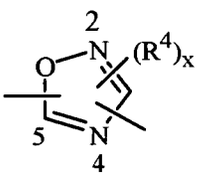

Q-3、

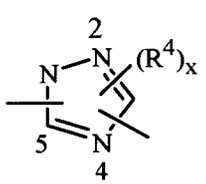

Q-4、

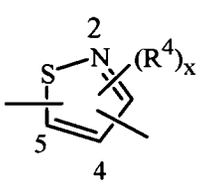

Q-5、

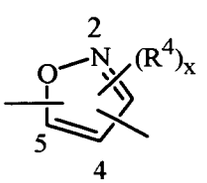

Q-6、

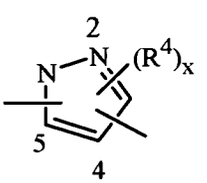

Q-7、

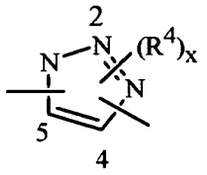

Q-8、


Q-9、

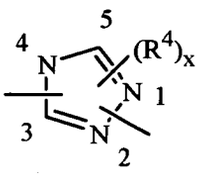

Q-10、


Q-11、

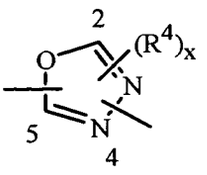

Q-12、



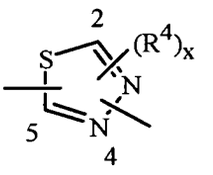
Q-13、



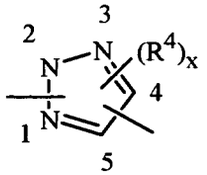
Q-14、



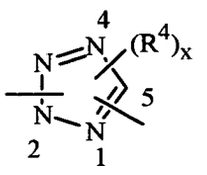
Q-15、



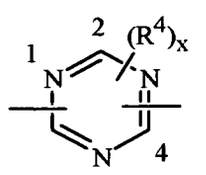
Q-16、



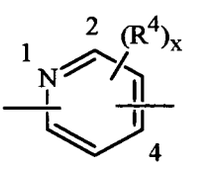
Q-17、



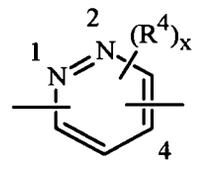
Q-18、



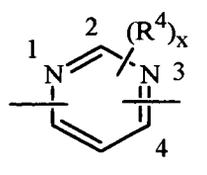
Q-19、



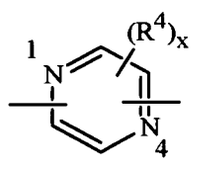
Q-20、



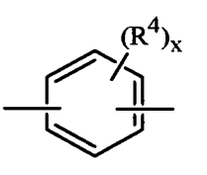
Q-21、



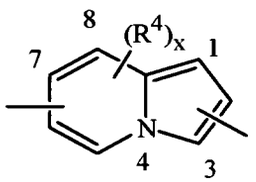
Q-22、



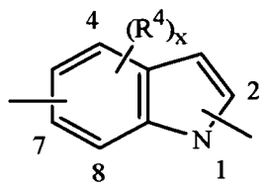
Q-23、



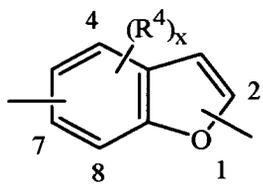
Q-24、



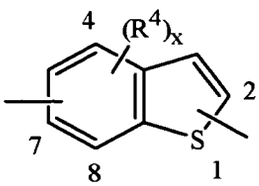
Q-25、



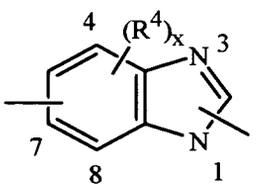
Q-26、



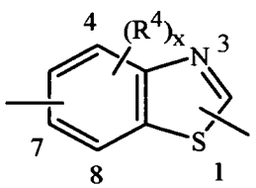
Q-27、



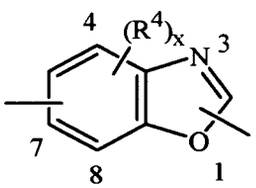
Q-28、



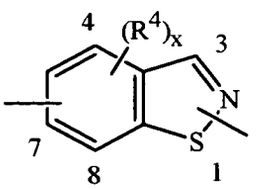
Q-29、



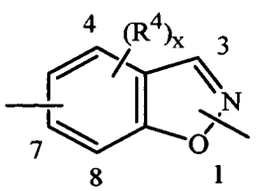
Q-30、



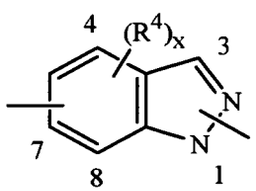
Q-31、



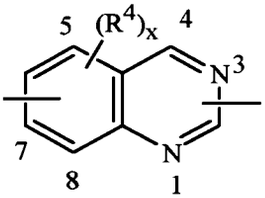
Q-32、



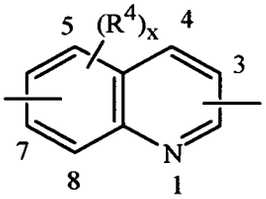
Q-33、



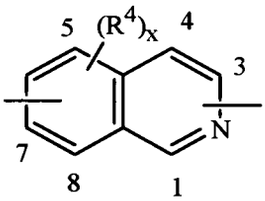
Q-34、



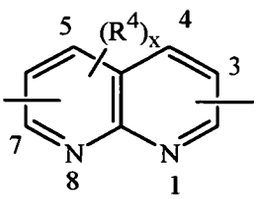
Q-35、



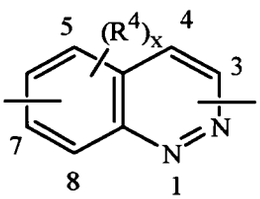
Q-36、



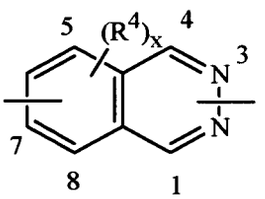
Q-37、



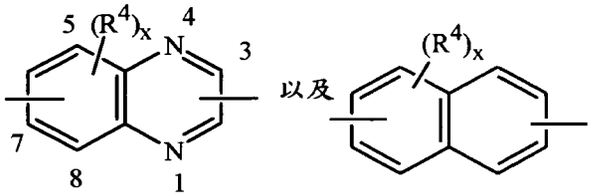
Q-38、



Q-39、



Q-40、



Q-41　　Q-42

其中一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳與式 1 之 SO_2 連接，且另一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳原子與式 1 之 C≡C 連接；當 R^4 與碳環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4a}，且當 R^4 與氮環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4b}；以及 x 為 0 至 5 之整數。

實施例 9. 一種實施例 8 之化合物，其中 Q 為選自於由 Q-4、Q-5、Q-12、Q-20、Q-22 及 Q-24 所組成之群組的環。

實施例 10. 一種實施例 9 之化合物，其中 Q 係選自於由 Q-4、Q-20 及 Q-24 所組成之群組。

實施例 10a. 一種實施例 10 之化合物，其中 Q 為 Q-4 或 Q-24。

實施例 11. 一種實施例 10 之化合物，其中 Q 為 Q-4。

實施例 12. 一種實施例 10 之化合物，其中 Q 為 Q-20。

實施例 13. 一種實施例 10 之化合物，其中 Q 為 Q-24。

實施例 14. 一種實施例 13 之化合物，其中連接 Q-24 與式 1 之其餘部分的該 SO_2 及 C≡C 基團係彼此對位地連接。

實施例 15. 一種實施例 13 之化合物，其中連接 Q-24 與式 1 之其餘部分的該 SO_2 及 C≡C 基團係彼此間位地連接。

實施例 16. 一種實施例 1 之化合物或實施例 1 至 15 之任一化合物，其中 x 為 0、1、2 或 3。

實施例 17. 一種實施例 16 之化合物，其中 x 為 0 或 1。

實施例 18. 一種實施例 17 之化合物，其中 x 為 0。

實施例 19. 一種實施例 17 之化合物，其中 x 為 1。

實施例 20. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 19 之任一化合物，其中各 R^{4a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

實施例 21. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 20 之任一化合物，其中 R^{4b} 為甲基。

實施例 22. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 17 之任一化合物，其中 R^3 為 $C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$、$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 $Si(R^{13})_3$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、

$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或G。

實施例23. 一種實施例22之化合物，其中R^3為C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基或C_2–C_6炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或G。

實施例24. 一種實施例23之化合物，其中R^3為C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基或C_2–C_6炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、OR^6及$S(O)_pR^{12}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、OR^6及$S(O)_pR^{12}$所組成之群組的取代基取代；或G。

實施例25. 一種實施例24之化合物，其中R^3為C_1–C_4烷基、C_3–C_6環烷基或G。

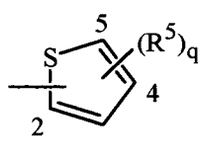
實施例26. 一種實施例25之化合物，其中R^3為G。

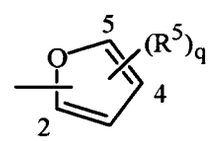
實施例26a. 一種實施例25之化合物，其中R^3為C_1–C_4烷基或C_3–C_6環烷基。

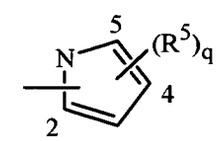
實施例27. 一種式1化合物或實施例1至22之任一化合物，其中 R^3 為 $C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$、$S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 或 $Si(R^{13})_3$。

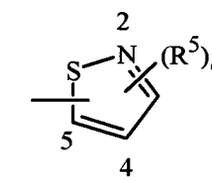
實施例28. 一種式1化合物或實施例1至26之任一化合物，其中G為選自於由展示2中之G-1至G-88所組成之群組的環

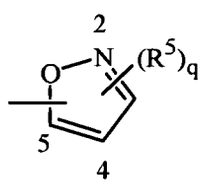
展示2

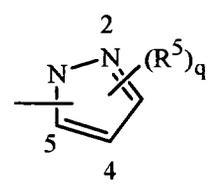

G-1、

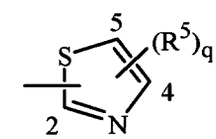

G-2、

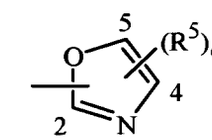

G-3、

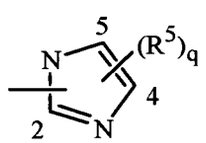

G-4、

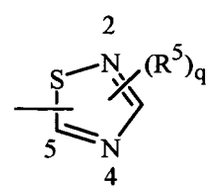

G-5、

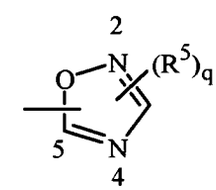

G-6、

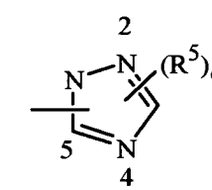

G-7、

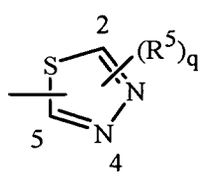

G-8、

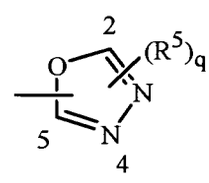

G-9、

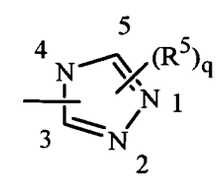

G-10、

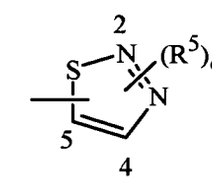

G-11、

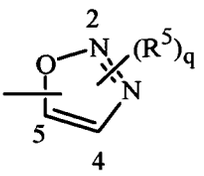

G-12、


G-13、

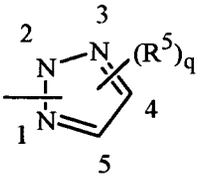

G-14、


G-15、

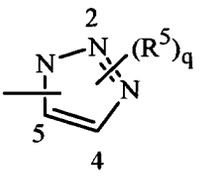

G-16、



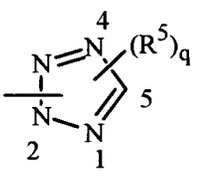
G-17



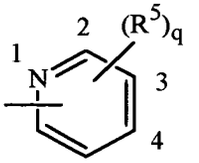
G-18



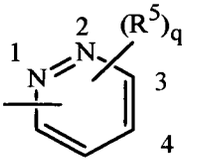
G-19



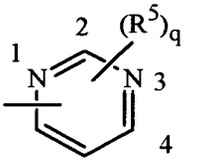
G-20



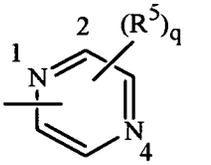
G-21



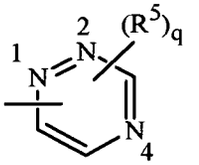
G-22



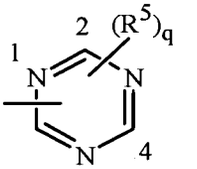
G-23



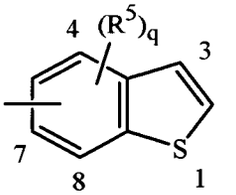
G-24



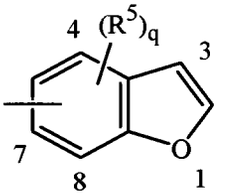
G-25



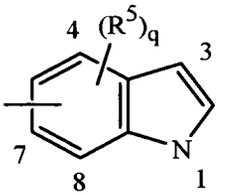
G-26



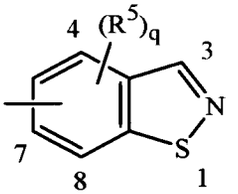
G-27



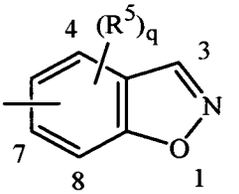
G-28



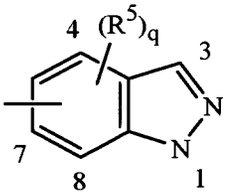
G-29



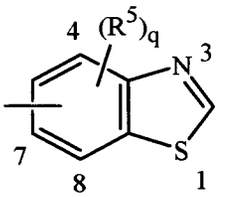
G-30



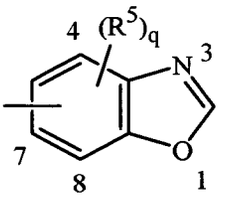
G-31



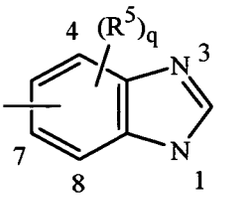
G-32



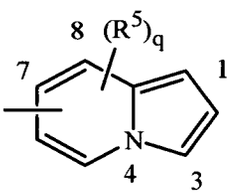
G-33



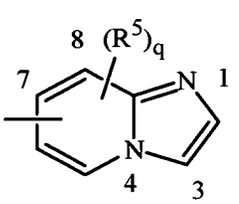
G-34



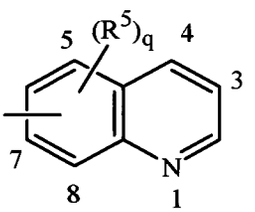
G-35



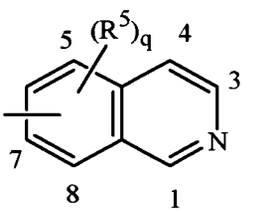
G-36



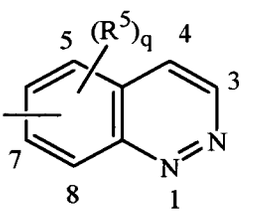
G-37



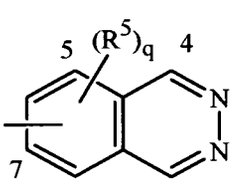
G-38



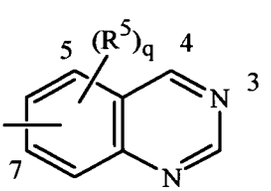
G-39



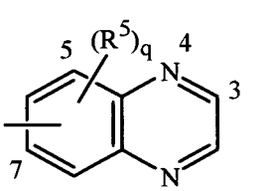
G-40



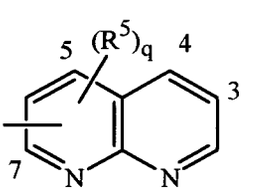
G-41



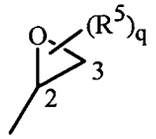
G-42



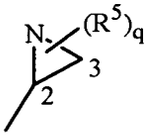
G-43



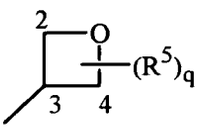
G-44



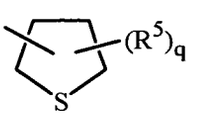
G-45 、



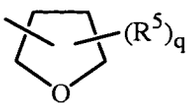
G-46 、



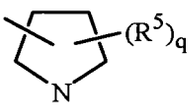
G-47 、



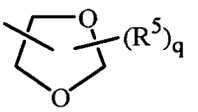
G-48 、



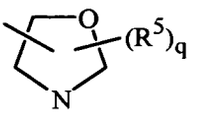
G-49 、



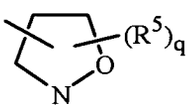
G-50 、



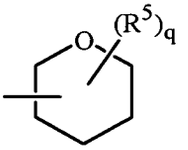
G-51 、



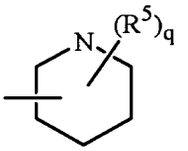
G-52 、



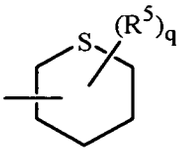
G-53 、



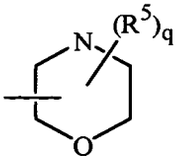
G-54 、



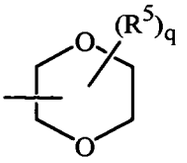
G-55 、



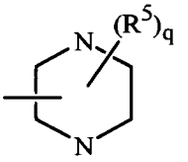
G-56 、



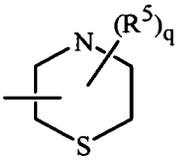
G-57 、



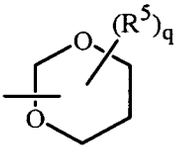
G-58 、



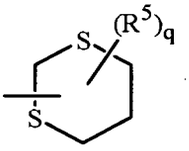
G-59 、



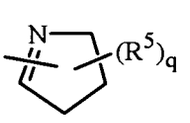
G-60 、



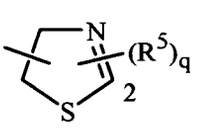
G-61 、



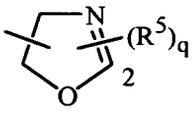
G-62 、



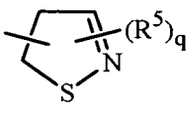
G-63 、



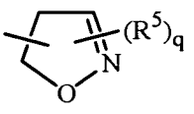
G-64 、



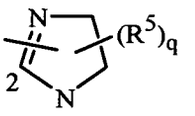
G-65 、



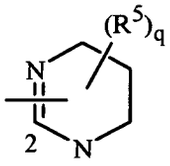
G-66 、



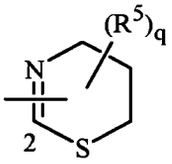
G-67 、



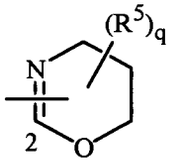
G-68 、



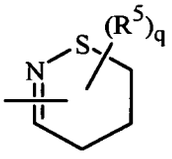
G-69 、



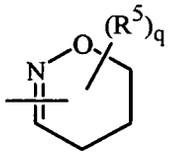
G-70 、



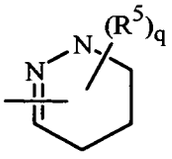
G-71 、



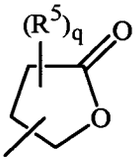
G-72 、



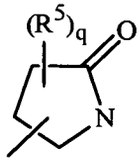
G-73 、



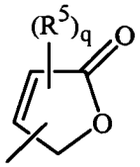
G-74 、



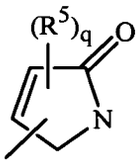
G-75 、



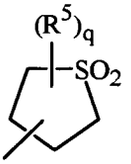
G-76 、



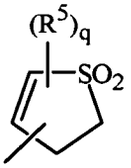
、



、

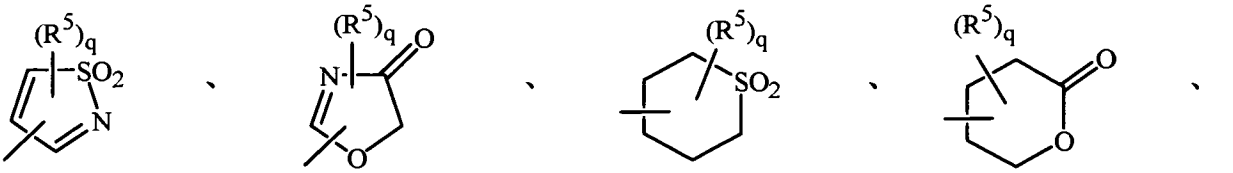


、

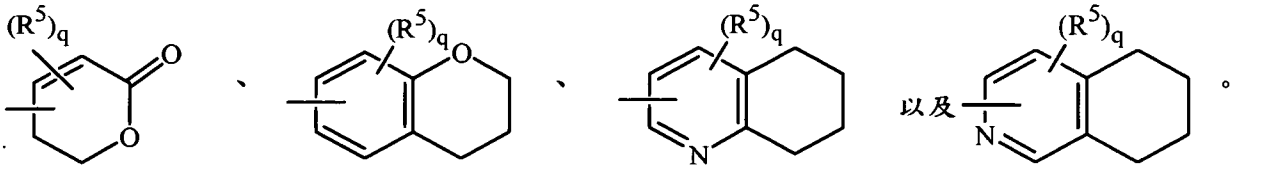


、

G-77 G-78 G-79 G-80



G-81 G-82 G-83 G-84



G-85 G-86 G-87 G-88

其中該浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳原子與式 1 之 C≡C 連接；當 R^5 與碳環員連接時，該 R^5 係選自 R^{5a}，且當 R^5 與氮環員連接時，該 R^5 係選自 R^{5b}；以及 q 為 0 至 5 之整數。

實施例 29. 一種實施例 28 之化合物，其中 G 係選自於由 G-1、G-2、G-4、G-7、G-10、G-21、G-23、G-27 及 G-33 所組成之群組。

實施例 30. 一種實施例 29 之化合物，其中 G 係選自於由 G-1、G-2、G-7、G-21 及 G-23 所組成之群組。

實施例 31. 一種實施例 30 之化合物，其中 G 係選自於由 G-1、G-7 及 G-21 所組成之群組。

實施例 31a. 一種實施例 28 之化合物，其中 G 係選自於由 G-45、G-47、G-48 及 G-49 所組成之群組。

實施例 32. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 26 與 28 至 31 之任一化合物，其中 R^3 為 C_1–C_4 烷基、

C_3–C_6 環烷基或選自於由 G-1、G-7 及 G-21 所組成之群組。

實施例 33. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 26 與 28 至 32 之任一化合物，其中 q 為 0、1、2 或 3。

實施例 34. 一種實施例 33 之化合物，其中 q 為 0 或 1。

實施例 35. 一種實施例 34 之化合物，其中 q 為 0。

實施例 36. 一種實施例 34 之化合物，其中 q 為 1。

實施例 37. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 26 與 28 至 36 之任一化合物，其中各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

實施例 38. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 26 與 28 至 37 之任一化合物，其中 R^{5b} 為甲基。

實施例 39. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 38 之任一化合物，其中各 R^6 係獨立為氫、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

實施例 40. 一種實施例 39 之化合物，其中各 R^6 係獨立為氫、C_5–C_6 烷基及 C_2–C_6 鹵烷基。

實施例 41. 一種實施例 40 之化合物，其中各 R^6 係獨立為氫、C_1–C_2 烷基或 C_1–C_2 鹵烷基。

實施例 42. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 41 之任一化合物，其中各 R^{7a} 係獨立為氫、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

實施例 43. 一種實施例 42 之化合物，其中各 R^{7a} 係獨立為氫、C_1–C_2 烷基或 C_1–C_2 鹵烷基。

實施例 44. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 43 之任一化合物，其中各 R^{7b} 係獨立為氫、C_1–C_2 烷基或 C_1–C_2 鹵烷基。

實施例 45. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 44 之任一化合物，其中 A 為 N。

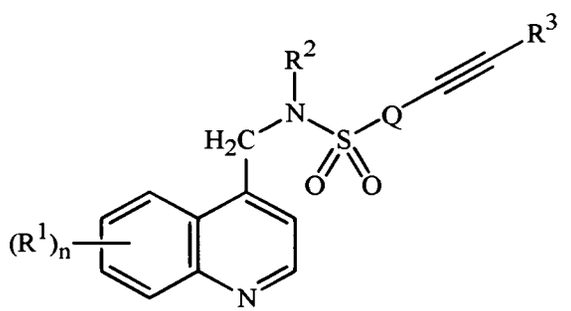
實施例 46. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 44 之任一化合物，其中 A 為 CH 或 CR^1。

實施例 47. 一種實施例 46 之化合物，其中 A 為 CH 或 CF。

實施例 48. 一種實施例 47 之化合物，其中 A 為 CH。

亦值得注意的是一種式 1P 化合物

實施例 AAA. 一種式 1P 化合物、一 *N*-氧化物或其鹽，



1P

其中

Q 為苯基或萘基，各選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{4a} 的取代基取代；或

Q 為 5 至 6 員雜芳環或 8 至 11 員雜芳雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多 4 個

雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多2個O、至多2個S及至多4個N原子，並且該環或環系選擇性地經至多5個獨立選自碳原子環員上的R^{4a}及氮原子環員上的R^{4b}的取代基取代；

各R^1係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基或C_2–C_6炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、OR^6及$S(O)_pR^{12}$所組成之群組的取代基取代；

R^2為氫、氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，

各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^3 為氫、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$、$S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 或 $Si(R^{13})_3$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；或 G。

G 為 5 至 6 員雜芳環、3 至 7 員非芳族雜環或 8 至 11 員芳族或非芳族雜環雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多 4 個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 及至多 4 個 N 原子，並且各環或環系選擇性地經至多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{5a} 及氮原子環員上的 R^{5b} 的取代基取代；

各 R^{4a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；

或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^{4b} 為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、

硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5b} 為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^6 係獨立為氫、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基或 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由

鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6烷氧基、C_1–C_6烷基胺基、C_2–C_8二烷基胺基、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基、C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基及C_3–C_6二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基亞磺醯基及C_1–C_4烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各R^{7a}係獨立為氫、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基或C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基或C_3–C_6二烷基胺基磺醯基；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6烷氧基、C_1–C_6烷基胺基、C_2–C_8二烷基胺基、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基、C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基及C_3–C_6

二烷基胺基磺醯基；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{7b} 係獨立為氫；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6 烷氧基、C_1–C_6 烷基胺基、C_2–C_8 二烷基胺基、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基及 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

R^8、R^9、R^{10} 及 R^{12} 各獨立為氫；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基、苯基、苄基、C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 鹵烷氧基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_2–C_8 二烷基胺基羰基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基、C_1–C_4 烷基磺醯基、

C_1–C_4 鹵烷基硫基、C_1–C_4 鹵烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{11} 係獨立為氫；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 鹵烷氧基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基、C_1–C_4 烷基磺醯基、C_1–C_4 鹵烷基硫基、C_1–C_4 鹵烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{13} 係獨立為 C_1–C_6 烷基或苯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、C_1–C_4 烷基及 C_1–C_4 鹵烷基所組成之群組的取代基取代；

n 為 0、1、2、3、4 或 5；以及

p 係 0、1 或 2。

本發明之實施例（包括以上實施例 1 至 48 與 AAA 以及任何其他本文中所述之實施例）可以任何方式組合，並且實施例中之變項的描述不僅適用於式 1 化合物，亦適用於其起始化合物與中間化合物，其可用於製備式 1 與式 1P 化合物。此外，本發明的實施例（包括上述實施例 1 至 48 與 AAA 以及任何其他本文中所述之實施例，與任何其組合）均適用於本發明之組成物與方法。

實施例 1 至 48 與 AAA 之組合可由以下說明：

實施例 AA. 一種如發明內容中所描述之式 1 化合物，其中

Q 為苯基或萘基，各選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{4a} 的取代基取代；或

Q 為 5 至 6 員雜芳環或 8 至 11 員雜芳雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多 4 個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 及至多 4 個 N 原子，並且該環或環系選擇性地經至多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{4a} 及氮原子環員上的 R^{4b} 的取代基取代；

A 為 N、CH 或 CR^1；

各 R^1 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^2 為氫、氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^3 為氫、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$、$S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 或 $Si(R^{13})_3$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 G。

G為5至6員芳族雜環、3至7員非芳族雜環或8至11員雜芳族或非芳族雜環雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多4個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多2個O、至多2個S及至多4個N原子，並且該環或環系選擇性地經至多5個獨立選自碳原子環員上的R^{5a}及氮原子環員上的R^{5b}的取代基取代；

各R^{4a}係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、OR^6及$S(O)_pR^{12}$所組成之群組的取代基取代；

R^{4b}為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及

$S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5b} 為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環

烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^6 係獨立為氫、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基或 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6 烷氧基、C_1–C_6 烷基胺基、C_2–C_8 二烷基胺基、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基及 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{7a} 係獨立為氫、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷

基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基或 C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基或 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基、各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6 烷氧基、C_1–C_6 烷基胺基、C_2–C_8 二烷基胺基、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基及 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{7b} 係獨立為氫；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6 烷氧基、C_1–C_6 烷基胺基、C_2–C_8 二烷基胺基、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯

基及 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

R^8、R^9、R^{10} 及 R^{12} 各獨立為氫；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基、苯基、苄基、C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 鹵烷氧基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_2–C_8 二烷基胺基羰基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基、C_1–C_4 烷基磺醯基、C_1–C_4 鹵烷基硫基、C_1–C_4 鹵烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{11} 係獨立為氫；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 鹵烷氧基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基、C_1–C_4 烷基磺醯基、C_1–C_4 鹵烷基硫基、C_1–C_4 鹵烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{13} 係獨立為 C_1–C_6 烷基或苯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、C_1–C_4 烷基及

C_1–C_4 鹵烷基所組成之群組的取代基取代；

n 為 0、1、2、3、4 或 5；以及

p 係 0、1 或 2。

實施例 A. 一種實施例 AAA 之化合物，其中

Q 為選自於由展示 1 中之 Q-1 至 Q-42 所組成之群組的環，其中一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳或氮原子與式 1 之 SO_2 連接，且另一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳與式 1 之 C≡C 連接；當 R^4 與碳環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4a}，且當 R^4 與氮環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4b}；以及 x 為 0 至 5 的整數；

各 ^{1} 獨立地係鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_3 烷基或 C_1–C_3 鹵烷基；

各 R^{4a} 獨立地係鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基；

R^{4b} 為甲基；

n 為 0、1 或 2；

R^3 為 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、

硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；或 G；

G 為選自於由展示 2 中之 G-1 至 G-88 所組成之群組的環；以及

各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

實施例 A1. 一種實施例 AA 之化合物，其中

Q 為選自於由展示 1 中之 Q-1 至 Q-42 所組成之群組的環，其中一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳或氮原子與式 1 之 SO_2 連接，且另一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳與式 1 之 C≡C 連接；當 R^4 與碳環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4a}，且當 R^4 與氮環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4b}；以及 x 為 0 至 5 的整數；

A 為 CH 或 CR^1；

各 R^1 獨立地係鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_3 烷基或 C_1–C_3 鹵烷基；

各 R^{4a} 獨立地係鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基；或 C_1–C_6 鹵烷基；

R^{4b} 為甲基；

n 為 0、1 或 2；

R^3 為 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、

$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 G；

G 為選自於由展示 2 中之 G-1 至 G-88 所組成之群組的環；以及

各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

實施例 B. 一種實施例 A 之化合物，其中

Q 為 Q-24；

x 為 0、1、2 或 3；

R^2 為氫或甲基；

G 係選自於由 G-1、G-2、G-4、G-7、G-10、G-21、G-23、G-27 及 G-33 所組成之群組；

q 為 0、1、2 或 3；以及

各 R^6 係獨立為氫、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

施例實 B1. 一種實施例 A1 之化合物，其中

Q 為 Q-4 或 Q-24；

x 為 0、1、2 或 3；

R^2 為氫或甲基；

G 係選自於由 G-1、G-2、G-4、G-7、G-10、G-21、G-23、G-27 及 G-33 所組成之群組；

q 為 0、1、2 或 3；以及

各 R^6 係獨立為氫、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

實施例 C. 一種實施例 B 之化合物，其中

各 R^1 係獨立為氟、氯、CH_3、CF_3、OCF_3 或 $OCHF_2$；

R^2 為氫；以及

R^3 為 C_1–C_4 烷基、C_3–C_6 環烷基或選自於由 G-1、G-7 及 G-21 所組成之群組。

實施例 C1. 一種實施例 B1 之化合物，其中

A 為 CH 或 CF；

各 R^1 係獨立為氟、氯、CH_3、CF_3、OCF_3 或 $OCHF_2$；

R^2 為氫；以及

R^3 為 C_1–C_4 烷基或 C_3–C_6 環烷基。

特定實施例包括選自由以下所組成之群組的式 1 化合物：

4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺；

4-(3-甲基 l-1-丁炔-1-基)-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺；

5-(2-環戊基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺；

5-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺；以及

5-(3-甲基-1-丁炔-1-基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺。

另外的特定實施例包括選自於由下列化合物所組成之群組的式 1 化合物：

N-[(8-氟-4-喹啉基)甲基]-4-(3-甲基-1-丁炔-1-基)-苯磺醯胺；以及

4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-[(8-氟-4-喹啉基)甲基]苯磺醯胺。

本發明中亦值得注意的實施例為包含前述任一實施例以及任何其他本文中所述實施例之化合物的組成物，以及其用於治療需要此類蠕蟲感染治療的動物之用途。

本發明中亦值得注意的實施例為包含殺寄生蟲有效量的前述任一實施例及任何其他本文中所述實施例之化合物以及至少一醫藥上或獸醫上可接受載劑或稀釋劑的組成物。

本發明中進一步值得注意的實施例為包含殺寄生蟲有效量的前述任一實施例及任何其他本文中所述實施例之化合物以及至少一醫藥上或獸醫上可接受載劑或稀釋劑的組成物，該組成物進一步包含至少一額外的生物活性化合物或藥劑。

本發明之實施例亦包括一種驅蟲劑組成物，該驅蟲劑組成物包含式1化合物（包括所有的立體異構物）或*N*-氧化物或其鹽以及至少一其他的驅蟲劑（例如至少一其他具有不同作用點的驅蟲劑）。

本發明之實施例亦包括治療需要此類蠕蟲感染治療的動物之方法，該方法包含腸內（例如口服）、腸外（例如藉由注射（包括皮下、肌肉內或靜脈注射））或局部投予該動物一殺寄生蟲有效量的式1化合物（包括所有的立體異構物）或 *N*-氧化物、或一醫藥上或獸醫上可接受鹽或一包含彼等之組成物。

本發明之實施例亦包括治療受蠕蟲感染的動物之方法，其中該動物為人類。

本發明之實施例亦包括治療需要此類蠕蟲感染治療的動物之方法，其中該動物為非人類。

本發明之實施例亦包括治療需要此類蠕蟲感染治療的動物之方法，其中該蠕蟲為線蟲。

本發明之實施例亦包括一種治療寄生蟲之方法，包含腸內（例如口服）、腸外（例如藉由注射（包括皮下、肌肉內或靜脈注射））或局部投予一殺寄生蟲有效量的式 1（包括所有的立體異構物）或 *N*-氧化物或其鹽（例如作為本文中所述的組成物）本發明之實施例亦包括控制蠕蟲之方法，包含使該蠕蟲或其環境與一殺寄生蟲有效量的式 1 化合物、*N*-氧化物或其鹽（例如作為本文中所述的組成物）接觸，前提為該等方法非為醫療治療人類或動物體的治療方法。

本發明之實施例亦包括式 1 化合物（包括所有的立體異構物）或 *N*-氧化物或其鹽、或前述任一實施例之用於用作動物藥物或更特定地殺寄生蟲動物藥物。該藥物可以處於本技術領域中任一認可的劑型，包括口服、局部、腸外或皮下劑型。

本發明之實施例亦包括式 1 化合物（包括所有的立體異構物）或 *N*-氧化物或其鹽、或前述任一實施例之用於製造用於保護動物免於蠕蟲侵害的藥物。該藥物可以處於本技術領域中任一認可的劑型，包括口服、局部、腸外或皮下劑型。

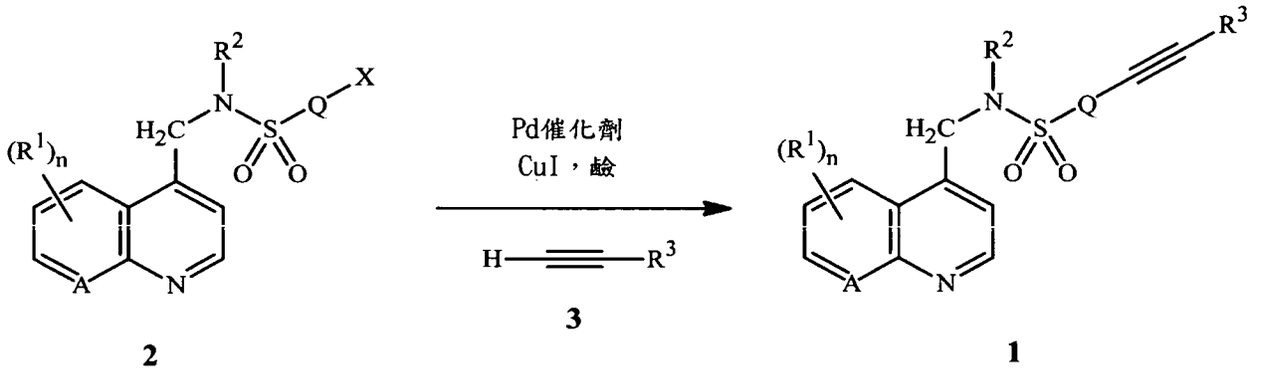
本發明之實施例亦包括式 1 化合物（包括所有的立體異構物）或 *N*-氧化物或其鹽、或前述任一實施例之用於包裝及呈現用於保護動物免於蠕蟲侵害。本發明之化合物可被包裝及呈現為任何適用於意圖的投藥模式之劑型。

本發明之實施例亦包括一種製造用於保護動物免於蠕蟲侵害的組成物之方法，其特徵為式 1 化合物（包括所有的立體異構物）或 *N*-氧化物或其鹽、或任何的前述實施例與至少一載劑或稀釋劑混合。本發明之化合物可被包裝及呈現為本技術領域中任一認可的劑型，包括口服、局部、腸外或皮下劑型。

以下如流程 1 至 10 中所述之一或多種方法及變體可用於製備式 1 化合物。除非另有說明，式 1 至 14 及式 1a 至 1d 化合物中 Q、A、R^1、R^2 及 R^3 的定義如上述發明內容中所界定。式 1a 至 1d 為式 1 的各種子集，且除非另有說明，所有式 1a 至 1d 的取代基的定義均如同上述為式 1 所界定者環境溫度或室溫界定為約 20–25 ℃。

式 1 化合物之製備可以藉由鈀在各種習知的薗頭（Sonogoshira）反應條件下催化式 3 之烷基或芳基乙炔與式 2 之芳基或雜芳基鹵化物偶合(J. Am. Chem. 2010, 132, 9585-9587；U.S. 7642391；J. Org. Chem. 2010, 75, 3518-3521；J. Org. Chem. 2008, 73, 6037-6040；J. Org. Chem. 2006, 71, 9499-9502；J. Org. Chem. 2005, 70, 4393-4396)，如流程 1 所示。

流程 1

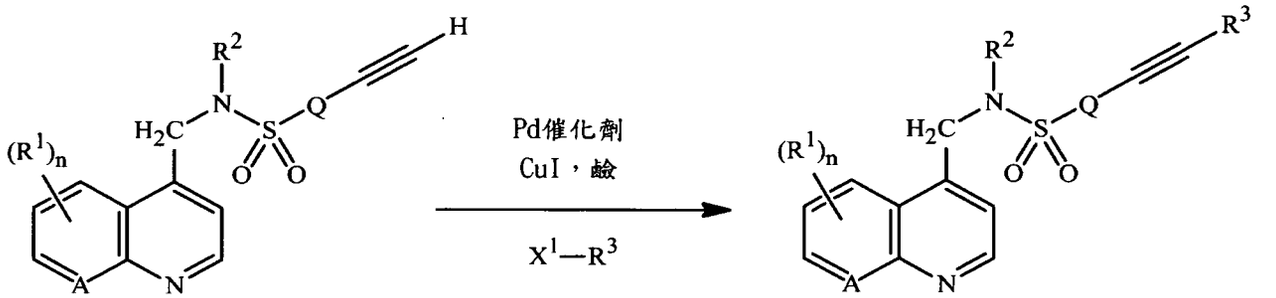


2

其中X為Cl、Br或I

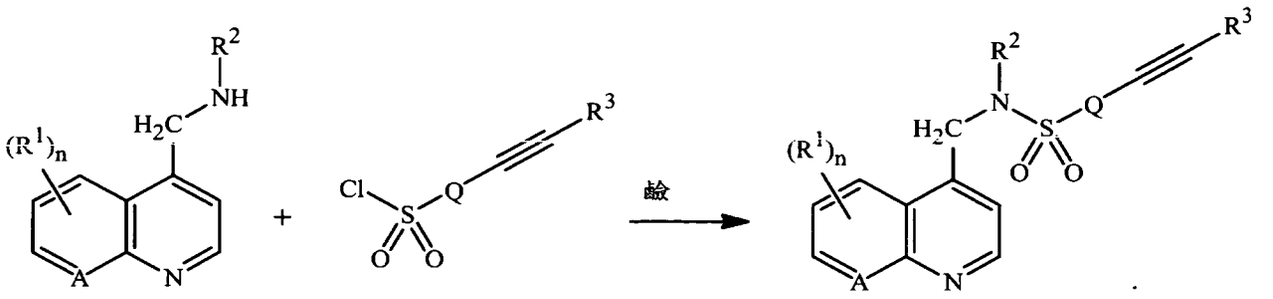
另一個使用薗頭反應製備式 1 化合物的方法顯示於流程 2。式 1a 化合物（其中 R^3 為氫）在鈀催化劑下與式 5 之芳基或雜芳基鹵化物偶合，以形成式 1 化合物。該反應通常是在室溫至約 150℃使用催化量的鈀催化劑（例如雙(三苯基膦)鈀(II)氯化物）以及選擇性催化量的銅(I)-碘化物在過量的鹼存在下（例如三乙胺、二異丙胺、K_2CO_3 或 Cs_2CO_3）於各種溶劑（例如四氫呋喃、甲苯、*N*,*N*-二甲基甲醯胺或 *N*-甲基吡咯啶酮）中進行。薗頭反應之代表性參考文獻如上所說明。

流程 2



式 1 化合物可以藉由式 6 之 4-雜芳基-甲胺與式 7 之芳基或雜芳基磺醯基氯化物反應來製備，通常是在鹼的存在中，如流程 3 所示。該反應可以在從 0℃ 到溶劑的回流溫度範圍中的溫度進行，較佳是在室溫到 100℃ 的範圍中。典型的溶劑包括脂族和芳族烴類，如己烷或甲苯；醚類如乙醚與異丙醚、四氫呋喃或二【口+哥】烷；酯類如醋酸乙酯；腈類如乙腈；酮類如丙酮或甲乙酮；醯胺類如二甲基甲醯胺及二甲基乙醯胺；以及鹵化烴類如二氯甲烷及氯仿。典型地用於該反應的鹼包括吡啶及經取代的吡啶如甲吡啶異構物，三烷胺類如三乙基、三丁基或二異丙基乙基胺及金屬碳酸鹽如鈉或鉀碳酸鹽。

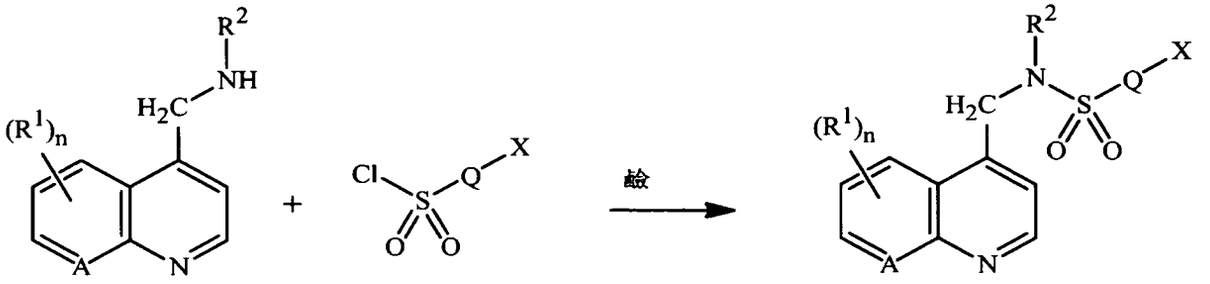
流程 3



6　　7　　1

式 2 化合物可以藉由式 6 之 4-雜芳基-甲胺與式 8 之芳基或雜芳基磺醯基氯化物反應來製備，通常是在鹼的存在中，如流程 4 所示。該反應可以在從 0℃到溶劑的回流溫度範圍中的溫度進行，較佳是在室溫到 100℃的範圍中。典型的溶劑包括脂族和芳族烴類，諸如己烷或甲苯；醚類諸如乙醚與異丙醚、四氫呋喃或二【口+哥】烷；酯類如醋酸乙酯；腈類如乙腈；酮類如丙酮或甲乙酮；醯胺類如二甲基甲醯胺及二甲基乙醯胺；以及鹵化烴類如二氯甲烷及氯仿。典型地用於該反應的鹼包括吡啶及經取代的吡啶如甲吡啶異構物，三烷胺類如三乙基、三丁基或二異丙基乙基胺及金屬碳酸鹽如鈉或鉀碳酸鹽。

流程 4

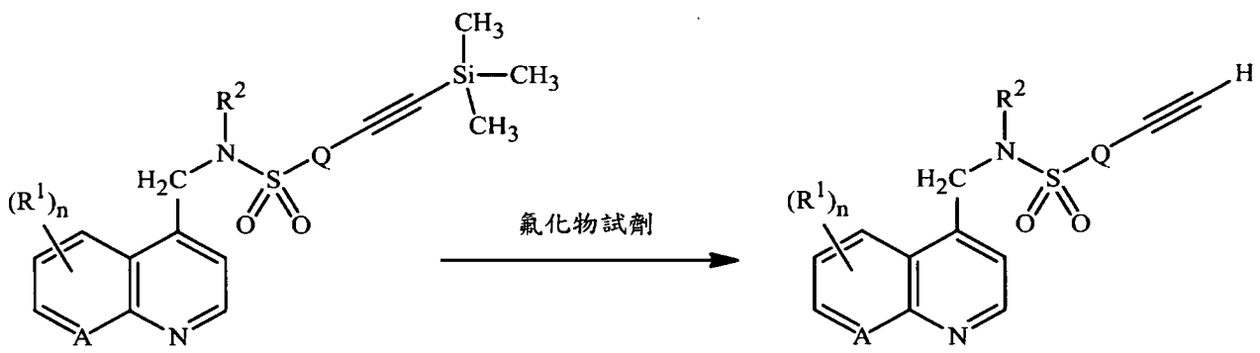


6　　8　　2

其中X為Cl、Br或I

式 1a 化合物（其中 R^3 為 H）可以藉由移除式 1b 化合物（其中 R^3 為三甲基矽烷基）之三甲基矽烷基來製備，如流程 5 所示。一般用於去矽烷化的條件為式 1b 化合物與過量的氟化物試劑（例如四丁銨氟化物）在從 0℃到室溫範圍中的溫度在溶解氟化物試劑與式 1b 化合物的溶劑或溶劑混合物（例如四氫呋喃與水）中反應。

流程 5

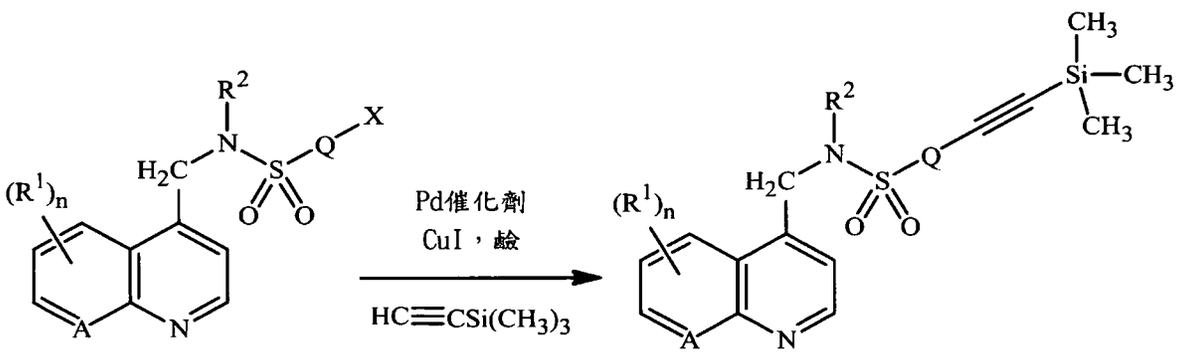


1b　　1a

其中R^3為三甲矽烷基　　其中R^3係H

式 1b 化合物可以藉由式 2 化合物與三甲基矽烷基乙炔在上述為薗頭反應說明的條件下反應而製備，如流程 6 所示。該反應通常是在室溫至約 150℃使用催化量的鈀催化劑（例如雙(三苯基膦)鈀(II)氯化物)以及選擇性催化量的銅(I)-碘化物在過量的鹼存在下（例如三乙胺、二異丙胺、K_2CO_3 或 Cs_2CO_3）於各種溶劑（例如四氫呋喃、甲苯、*N*,*N*-二甲基甲醯胺或 *N*-甲基吡咯啶酮）中進行。薗頭反應之代表性參考文獻如上所說明。

流程 6



2

其中X為Cl、Br或I

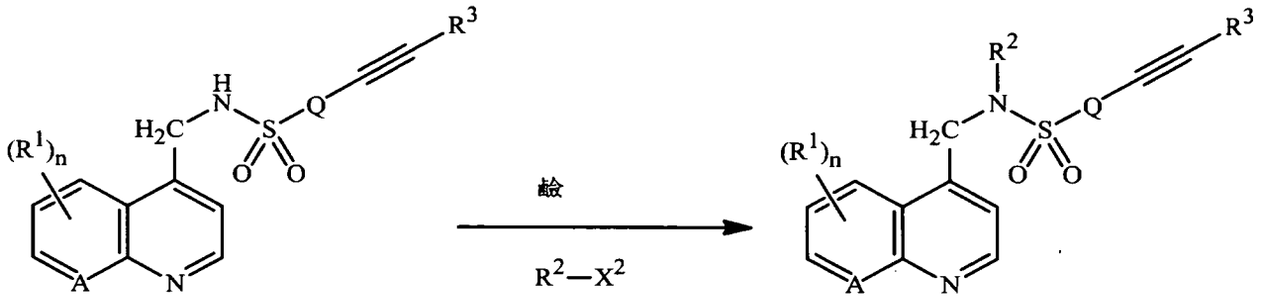
1b

其中R^3為三甲矽烷基

式 1c 化合物（其中 R^2 為烷基、經取代的烷基、醯基、磺醯基及類似者）可藉由式 1d 之喹啉磺醯胺（其中 R^2 為 H）與式 9 之各種烷化、醯化或磺醯化試劑在鹼存在下反應而製備，如流程 7 所示。典型的鹼包括吡啶及經取代的吡啶如甲吡啶異構物；三烷胺類如三乙基、三丁基或二異丙基乙基胺；氫化物如鈉氫化物；以及碳酸鹽如鉀或銫碳酸鹽。典型的溶劑包括乙腈、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺、醋酸乙酯及甲苯。

該反應通常是在室溫進行，但是也可在從室溫到溶劑的回流溫度範圍中的溫度進行。

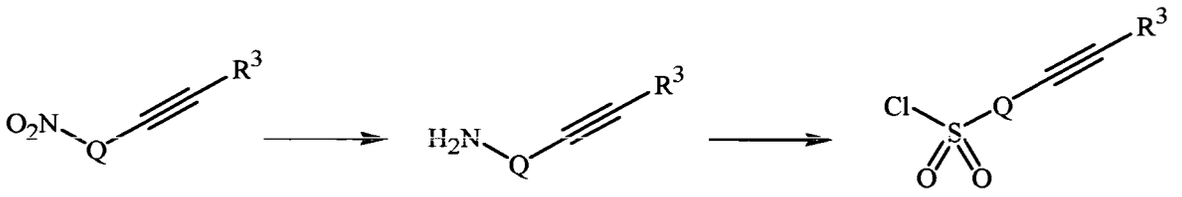
流程 7



其中R^2係H　　其中X^2為Cl、Br或I　　其中R^2為烷基、經取代的烷基、醯基或磺醯基

式 7 之磺醯基氯化物中間物也可以藉由各式各樣眾所周知的方法製備。一個特別有用的方法是藉由式 10 之芳族胺與雜芳族胺的重氮化與氯磺化作用，如流程 8 所示。這些方法與程序在化學文獻中有廣泛的記載。一組典型的條件包括在醋酸和鹽酸混合物中的亞硝酸鈉、氯化銅及二氧化硫。使用亞硫醯氯化物作為磺醯基氯化物來源的實驗細節可在實例 1、步驟 D 中找到。式 10 之胺類可立即從各種來源得到，且式 11 的芳族硝基與雜芳族硝基化合物之還原是很典型的。式 11 的硝基化合物可藉由前述的薗頭反應之變化而得。

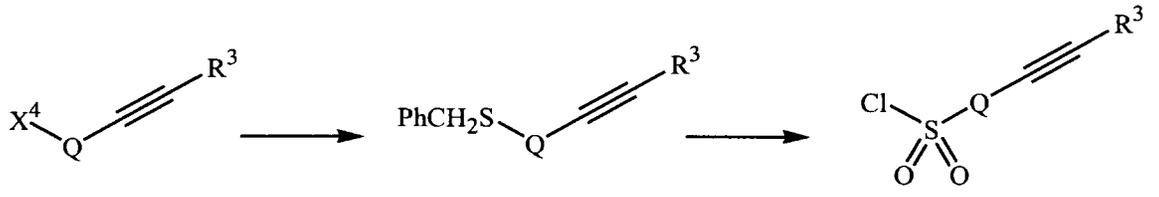
流程 8



11 10 7

製備式 7 之磺醯基氯化物中間物的替代可用程序係藉由將硫化物氧化性氯化成為對應的磺醯基氯化物，如流程 9 所示。在寬範圍的條件下以氯化試劑（包括氯、*N*-氯琥珀醯亞胺及鈉次氯酸鹽）處理式 12 之硫化物提供對應的式 7 磺醯基氯化物（參見例如世界專利公開案第 WO2007/147762 號；Tetrahedron Lett. 2010, 51 418-421）。式 12 之硫化物中間物可藉由各種習知的文獻記載程序以苄基硫醇置換式 13 之芳基或雜芳基鹵化物而得到。

流程 9



13 12 7

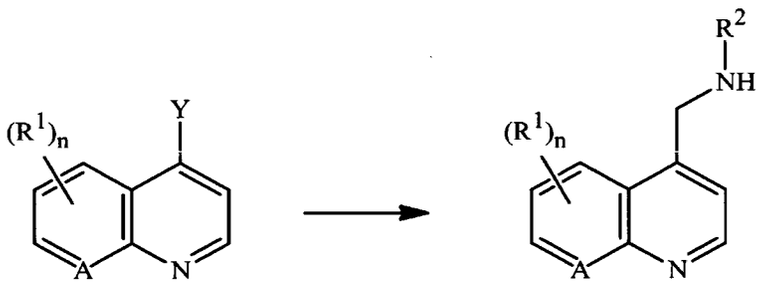
其中X^4為Cl、Br或I

式 6 之喹啉與【口+奈】啶為文獻中習知的或可以藉由各種方法由式 14a 至 14d 之中間物製備（世界專利

公開案 WO 2007/052262)，顯示於流程 10。可以將式 14a 之肟類立即還原成為式 6 之胺類（其中 R^2 為 H)。使用溶於甲醇的鈀與銨甲酸鹽的具體程序係描述於實例 1。用於此還原的其他方法可以在以下參考文獻中找到：J. Org. Chem. 1989, 54, 1731-5 與歐洲專利公開案 EP 1571150。式 6 中的 R^2 基團可以藉由還原胺化或烷化反應來導入。式 14a 之肟類可藉由使用羥胺處理而從式 14b 之對應醛類得到。式 14b 之醛類可以藉由各種方法由對應的溴衍生物 14d 製備，該等方法包括金屬鹵素交換及使用二甲基甲醯胺處理。參見例如 J. Med. Chem. 2009, 52, 6966-6978；Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2010, 20, 1347-1351 及 J. Med. Chem. 2009, 52, 6966-6978。

式 6 之喹啉與【口+奈】啶也可以藉由催化氫化式 14c 之腈類而製備。可應用於此轉化的參考文獻包括以下：世界專利公開案 WO 2008/007211；世界專利公開案 WO 2008/090434；世界專利公開案 WO 2007/104726 及世界專利公開案 WO 2008/079292。腈類 14c 可以由對應的溴衍生物 14d 與氰化物來源反應而製備。參見例如 Organic Letters 2007, 9, 5525-5528；J. Med. Chem. 1992, 35, 2761-8；Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2005, 15, 4520-4525。

流程 10



14
a Y為CH=NOH
b Y為CHO
c Y為CN
d Y為Br

6

已認知到，上述用於製備式 1 化合物的一些試劑及反應條件，可能無法與某些存在於中間物中的官能性相容。在這些實例中，併入保護/去保護序列或官能基相互轉換至該合成中，將有助於獲得所欲產物。保護基的使用和選擇對熟習化學合成之技藝人士而言是顯而易見的（參見例如 Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.；Wiley: New York, 1991）。熟習該項技術者會認知到，在一些情況下，在採用如在任何個別流程中所敘述的特定試劑之後，可能需要進行額外未詳細說明的常規合成步驟以完成式 1 化合物的合成。熟習該項技術者亦會認知到，可能必須以不同於所呈現之特定順序所意味的次序，來進行以上方案中所說明步驟之組合以製備式 1 化合物。

熟習該項技術者亦會認知到，式 1 化合物與本文中所述之中間物可經過各式親電子、親核、基團、有機金屬、氧化與還原反應以加入取代基或修飾現有取代基。

即使沒有進一步的闡述，相信使用上述說明的本領域具有通常知識者仍能夠最大程度地利用本發明。因此，下面的合成實例應理解為僅僅是說明性的，而且不管是以任何方式，都不作為此處揭露內容的限制。下面合成實例的步驟說明一整體合成轉變之各步驟的一個製程，且用於每個步驟的起始原料可能不一定需要藉由一特定製備路程來製備，該特定製備路程的製程係在其他實例或步驟中有敘述者。環境溫度或室溫界定為約20–25℃。百分比為以重量計，除了層析溶劑混合物或另有指明者。除非特別指出，則層析溶劑混合物係以體積份及體積百分比計。MPLC 係指在矽膠上的中壓液相層析。^{1}H NMR 光譜係以四甲基矽烷之下場 ppm 記述；「s」意為單峰，「d」意為雙重峰，「dd」意為雙組雙重峰，「ddd」意為雙組的雙組雙重峰，「t」意為三重峰，「m」意為多重峰，而「br s」意為寬峰。關於質譜儀數據，所述之數值係為藉由加入 H^+（分子量為 1）至分子中以產生藉由使用大氣壓力化學離子化（AP^+）以質譜儀觀察之 M+1 峰所形成之母分子離子分子量（M）。

合成實例 1

4-[2-(2-吡啶基)乙炔基]-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺(化合物編號 4)之製備

步驟 A：　4-喹啉甲醛肟之製備

於溶於 65 mL 乙醇的 4-喹啉甲醛(10.0 g, 62.5 mmol)中加入羥胺 HCl (4.81 g, 68.75 mmol)與 3.1 mL 的水，然後滴加吡啶(11.2 mL, 137 mmol)。在室溫下將該反應混

合物攪拌整夜。加入水(30 mL)並於冰浴中將反應混合物冷卻，以沉澱出固體。過濾此固體並使用乙醇和水洗滌，而且在氮氣中乾燥，以獲得 11.0 g 的標題化合物。^{1}H NMR (DMSO) δ 12.02 (s, 1H) 8.94 (d, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.83 (t, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.68 (t, 1H)。

步驟 B： 4-啉甲胺之製備

在氮氣中於 500 mL 圓底燒瓶中加入 10% Pd/C (0.85 g)，然後加入 4-喹啉甲醛肟(11.0 g, 63 mmol) (即實例 1、步驟 A 之產物)及銨甲酸鹽(16.8 g, 257 mmol)。小心加入甲醇(200 mL)並將反應混合物加熱至 40 至 45 ℃持續 8 小時，然後在室溫攪拌整夜。使該反應混合物過濾通過矽藻土，並以甲醇洗滌。之後在減壓下濃縮濾液至約 20 mL，然後以 300 mL 的二氯甲烷稀釋並以飽和碳酸鈉水溶液(200 mL)洗滌。將二氯甲烷相以硫酸鎂乾燥並在減壓下濃縮，以獲得油狀物。在矽膠上使用醋酸乙酯：甲醇(9:1)到純甲醇的梯度層析該油狀物，以提供 6.0 g 的標題化合物。

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 8.89 (d, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.72 (t, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.48 (d, 1H), 4.38 (s, 2H)。

步驟 C： 4-[2-(2-吡啶基)乙炔基]苯胺之製備

於 2-乙炔基吡啶(1.0 g, 4.60 mmol)溶於二異丙胺(20 mL)的溶液中加入銅(I)氯化物(87 mg, 0.46 mmol)、雙(三苯基膦)-鈀(II)二氯化物(32 mg, 0.46 mmol)。以氬

氣吹洗產生的溶液 15 分鐘，然後以 4-碘苯胺(0.57 g, 5.52 mmol)處理。加熱該反應混合物並在 60℃攪拌 1 小時。然後將該反應混合物倒入水中並用醋酸乙酯萃取。之後分離出有機相、用水與飽和 NaCl 溶液洗滌、乾燥（$MgSO_4$）及過濾。在減壓下濃縮有機相、在矽膠管柱層析（己烷作為洗提液），以提供標題化合物(0.670 g)，為固體。

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 8.6 (d, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.2 (m, 1H), 6.67 (d, 2H), 4.0 (s, 2H)。

步驟 D：　4-[2-(2-吡啶基)乙炔基]苯磺醯基氯化物之製備

在 0℃將飽和亞硝酸鈉水溶液(320 mg, 4.52 mmol)滴加於 4-[2-(2-吡啶基)乙炔基]苯胺(850 mg, 4.35 mmol)（即實例 1、步驟 C 之產物）溶於濃鹽酸(5.1 mL)中，並在 0℃攪拌該反應混合物持續 1 小時。在另一個裝有銅(II)氯化物(21 mg, 0.21 mmol)溶於水(10.2 mL)的溶液且冷卻到 0℃的燒瓶中滴加磺醯基氯化物(2.06 gm, 17.4 mmol)，並在 0℃攪拌該溶液持續 1 小時。然後在室溫將重氮鹽溶液滴加加入該銅鹽溶液中。將產生的混合物在室溫攪拌 16 小時。然後將該反應混合物倒入水中並用醋酸乙酯萃取。用水與飽和 NaCl 水溶液洗滌有機相、乾燥（$MgSO_4$）及過濾。在減壓下濃縮有機相、在矽膠管柱層析（己烷作為洗提液），以提供標題化合物(0.150 g)，為固體。

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 8.65(d, 1H), 7.77(m, 1H), 7.55(m, 6H)。

步驟 E： 4-[2-(2-吡啶基)乙炔基]-*N*-(4-喹啉基甲基)-苯磺醯胺之製備

於 4-喹啉甲胺(300 mg, 1.35 mmol) (即實例 1、步驟 B 之產物)溶於二氯甲烷的溶液中加入三乙胺(0.45 mL, 3.32 mmol)，然後加入 4-[2-(2-吡啶基)乙炔基]苯磺醯基氯化物(0.420 mg, 1.5 mmol) (即實例 1、步驟 D 之產物)。在室溫攪拌該反應混合物持續 16 小時。用水處理該反應混合物並用醋酸乙酯(30 mL)萃取。用水(30 mL)與飽和 NaCl 水溶液(10 mL)洗滌有機相、以無水硫酸鈉乾燥及過濾。在減壓下濃縮溶劑並在矽膠管柱層析(50%醋酸乙酯/己烷作為洗提液)以提供標題化合物，本發明之化合物，為固體(80mg)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ8.88 (d, 1H), 8.68 (d, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.91 (m, 3H), 7.77 (m, 4H), 7.55 (m, 2H), 7.31 (d, 2H), 5.2 (bs, 1H), 4.75 (d, 2H)。

合成實例 2

4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺之製備(化合物編號 2)

步驟 A： 4-碘基-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺之製備

在 0℃於 4-喹啉甲胺氫氯化物(3.0 g, 15.4 mmol)溶於二氯甲烷(30 mL)的溶液中加入三乙胺(4.6 g, 46.3 mmol)。將該混合物攪拌 15 分鐘。加入 4-碘基苯磺醯

基氯化物(5.1 g, 17.0 mmol)並在室溫攪拌該反應混合物持續 18 小時。濃縮該反應混合物、用水處理殘渣並用醋酸乙酯萃取。合併該等有機相、用飽和 NaCl 水溶液洗滌、用無水硫酸鈉乾燥及過濾。在減壓下濃縮有機相，並在矽膠管柱層析殘渣(50%醋酸乙酯/己烷作為洗提液)，以提供標題化合物(3.8 g)，為固體。

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 8.84 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.86 (m, 3H), 7.78 (t, 1H), 7.58 (m, 3H), 7.32 (d, 1H), 4.9 (t, 1H), 4.8 (d, 2H)。

步驟 B：　製備 of4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-苯磺醯胺

在環丙基乙炔(0.18 g 2.82 mmol)溶於除氣的四氫呋喃(5 mL)之溶液中加入銅(I)碘化物(0.179 g, 0.094 mmol)，然後加入三乙胺(1.14 g, 11.31 mmol)。之後在室溫攪拌該反應混合物持續 10 分鐘。然後用雙(三苯基膦)鈀(II)氯化物(0.033 g, 0.04 mmol)和 4-碘基-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺(0.4 g, 0.9 mmol) (即實例 2、步驟 A 之產物)處理該反應混合物，並在室溫攪拌 14 小時。用水處理該反應混合物並用醋酸乙酯萃取。合併該等有機相、用飽和 NaCl 水溶液洗滌、用無水硫酸鈉乾燥及過濾。在減壓下濃縮有機相，並在矽膠管柱層析(50%醋酸乙酯/己烷作為洗提液)以提供標題化合物，本發明之化合物，為固體(0.23 g)，熔點 157-159℃

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 8.8 (d, 1H), 8.1 (d, 1H), 7.9 (d, 1H), 7.8 (m, 2H), 7.7 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.3 (s, 1H), 4.9 (t, 1H), 4.6 (d, 2H), 1.5 (m, 1H), 0.9 (m, 4H)。

合成實例 3

5-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺之製備 (化合物編號 15)

步驟 A： 5-溴-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺之製備

在 0℃用三乙胺(3.12 g, 30.92 mmol)處理 4-喹啉甲胺氫氯化物(2 g, 10.3 mmol)溶於二氯甲烷(20 mL)的溶液，然後攪拌 15 分鐘。將 5-溴-噻吩磺醯基氯化物(2.96 g, 11.34 mmol)加入該反應混合物中然後在室溫攪拌 14 小時。濃縮該反應混合物、用水處理殘渣並用醋酸乙酯萃取。合併該等有機相、用飽和 NaCl 水溶液洗滌、用無水硫酸鈉乾燥、過濾及在真空下濃縮。在矽膠管柱(50%醋酸乙酯/己烷作為洗提液)層析殘渣，以提供標題化合物，為固體(1.3 g)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 8.84 (d, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.78 (t, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.08 (d, 1H), 5.0 (t, 1H), 4.75 (d, 2H)。

步驟 B： 5-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺之製備

用三苯基膦(0.027 g, 0.104 mmol)然後用三(二苄基丙酮)二鈀(0)(0.108 g, 0.104 mmol)處理環丙基乙炔

(0.20 g, 3.13 mmol)溶於除氣的三乙胺(10 mL)之溶液，之後攪拌該反應混合物 10 分鐘。然後加入 5-溴-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺(0.4 g, 1.04 mmol) (即實例 3、步驟 A 之產物)，並在室溫將該反應混合物攪拌 14 小時。用水處理該反應混合物並用醋酸乙酯萃取。合併該等有機相、用飽和 NaCl 水溶液洗滌、用無水硫酸鈉乾燥、過濾及在真空下濃縮。在矽膠管柱(50%醋酸乙酯/己烷作為洗提液)層析殘渣，以提供標題化合物，本發明之化合物，為固體(0.08 g)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 8.85 (d, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.6 (t, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.0 (d, 1H), 5.0 (t, 1H), 4.65 (d, 2H), 1.5 (m, 1H), 0.9 (m, 4H)。

合成實例 4

4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(1,8-【口+奈】啶-4-基甲基)-苯磺醯胺之製備(化合物編號 48)

步驟 A：　1,8-【口+奈】啶-4-甲醛肟之製備

在室溫於 1,8-【口+奈】啶-4-甲醛(4.0 g, 25.3 mmol)溶於甲醇(60 mL)的溶液中加入羥胺氫氯化物(2.28 g, 32.9 mmol)和醋酸鈉(2.49 g, 30.379 mmol)。將該反應混合物於室溫攪拌 2 小時。在真空下濃縮該反應混合物、加入 20 mL 的水並攪拌漿液 1 小時及過濾，以提供標題化合物(3.5 g)，為固體。

MS (AP^+ (M+1))：174。

步驟 B： 1,8-【口+奈】啶-4-甲胺之製備

在氫氣氛圍下在 1,8-【口+奈】啶-4-甲醛肟(1 g, 5.78 mmol) (即步驟 A 之產物)溶於乙醇(60 mL)的溶液中加入在活性碳(500 mg)的 10%鈀。將該反應混合物於室溫攪拌 3 小時。將該反應混合物過濾並在真空下濃縮，以提供標題化合物(0.6 g)，為半固體。在下個步驟中使用粗反應產物而不進一步純化。

MS (AP^+ (M+1))：160。

步驟 C： 4-碘基-*N*-(1,8-【口+奈】啶-4-基甲基)-苯磺醯胺之製備

在 0℃於 1,8-【口+奈】啶-4-甲胺(0.5 g, 3.14 mmol) (即步驟 B 之產物)溶於乙醇(8 mL)的溶液中加入三乙胺(1.27 g, 12.5 mmol)。攪拌該反應混合物 15 分鐘然後用碘基苯磺醯基氯化物(1.14 g, 3.77 mmol)處理。將該反應混合物於室溫攪拌 2 小時。在真空下濃縮該反應混合物、用水處理並用二氯甲烷萃取。合併該等有機相、用飽和 NaCl 水溶液洗滌及用無水硫酸鈉乾燥。過濾該混合物並在減壓下濃縮。將粗殘渣裝在矽膠管柱並用 10%溶於氯仿的 MeOH 洗提，以提供標題化合物(0.23 g)，為固體。

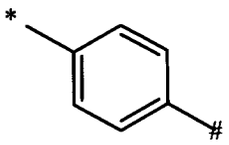
MS (AP^+ (M+1))：426。

步驟 D： 4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(1,8-【口+奈】啶-4-基甲基)-苯磺醯胺之製備

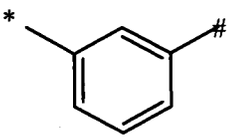
在環丙基乙炔(0.139 g, 0.70 mmol)溶於除氣的四氫呋喃(15 mL)的溶液中加入銅(I)碘化物(0.013 g, 0.070 mmol)，然後加入三乙胺(0.855 g, 8.465 mmol)與雙(三苯基膦)鈀(II)二氯化物(0.024 g, 0.034 mmol)。然後攪拌該反應混合物 10 分鐘。加入 4-碘基-*N*-(1,8-【口+奈】啶-4-基甲基)-苯磺醯胺(0.3 g, 0.705 mmol) (即步驟 C 之產物)並在 90℃攪拌該反應混合物 4 小時。將該反應混合物冷卻至室溫、在真空下濃縮、用水處理及用二氯甲烷萃取。合併該等有機相、用飽和 NaCl 水溶液洗滌、用無水硫酸鈉乾燥及過濾。在減壓下濃縮二氯甲烷以及裝在矽膠管柱並用 80%的醋酸乙酯/己烷(80%)洗提，以提供標題化合物，本發明之化合物，為固體(0.040 g)。^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 9.08 (s, 1H), 8.98 (d, 1H), 8.68(d, 1H), 7.75 (d, 2H), 7.65 (m, 1H), 7.6 (d, 1H), 7.45 (d, 2H), 4.65 (s, 2H), 1.9 (d, 2H), 1.5 (m, 1H), 0.75 (d, 2H). MS (AP^+ (M+1)): 364。

藉由本文中所述製程以及該技術領域中習知方法，可製備出下面表 1 到表 18 的化合物。下面表 1 至 18 中所用之縮寫如下面所示：Me 表示甲基，Et 表示乙基，Pr 表示丙基，Bu 表示丁基，Hex 表示己基，n 表示正，i 表示異，s 表示二級，t 表示三級，c 表示環，p 表示對，m 表示間，以及 Ph 表示苯基。

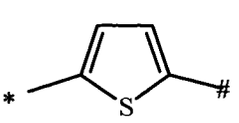
以下顯示的片段 Q^1-1 至 Q^1-14 為表 1 至 18 中所指。



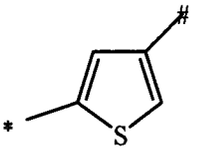
Q^1-1



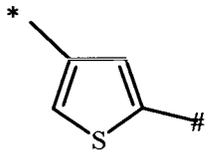
Q^1-2



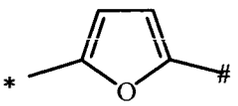
Q^1-3



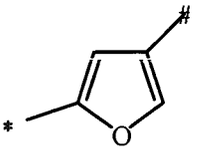
Q^1-4



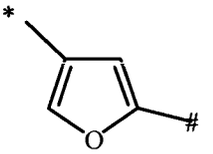
Q^1-5



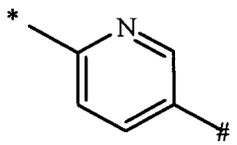
Q^1-6



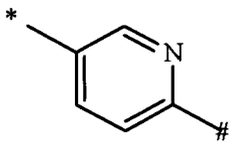
Q^1-7



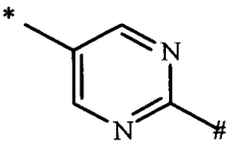
Q^1-8



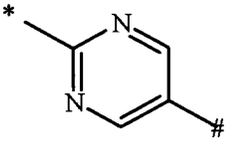
Q^1-9



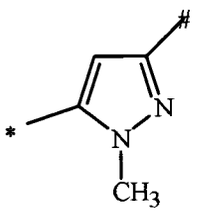
Q^1-10



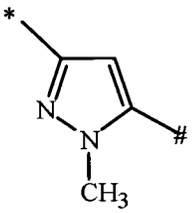
Q^1-11



Q^1-12



Q^1-13



Q^1-14

* 為 Q 基團與式 1 中的磺醯基(SO_2)之連接點。

\# 為 Q 基團與式 1 中的乙炔基團之連接點。

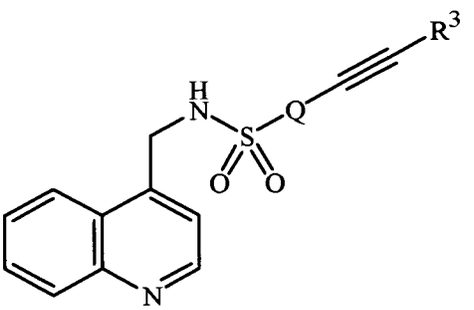


表 1

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
甲基	Q^1-1	甲基	Q^1-2	甲基	Q^1-3
乙基	Q^1-1	乙基	Q^1-2	乙基	Q^1-3
n-丙基	Q^1-1	n-丙基	Q^1-2	n-丙基	Q^1-3
n-丁基	Q^1-1	n-丁基	Q^1-2	n-丁基	Q^1-3

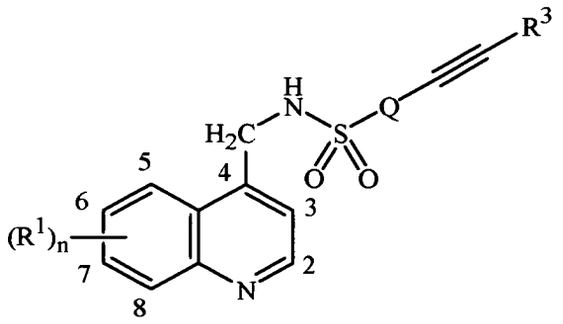
R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
i-丙基	Q^1-1	i-丙基	Q^1-2	i-丙基	Q^1-3
i-丁基	Q^1-1	i-丁基	Q^1-2	i-丁基	Q^1-3
s-丁基	Q^1-1	s-丁基	Q^1-2	s-丁基	Q^1-3
t-丁基	Q^1-1	t-丁基	Q^1-2	t-丁基	Q^1-3
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-1	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-2	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-3
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-1	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-2	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-3
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-1	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-2	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-3
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-1	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-2	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-3
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-1	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-2	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-3
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-1	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-2	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-3
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-1	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-2	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-3
c-丙基	Q^1-1	c-丙基	Q^1-2	c-丙基	Q^1-3
c-戊基	Q^1-1	c-戊基	Q^1-2	c-戊基	Q^1-3
c-己基	Q^1-1	c-己基	Q^1-2	c-己基	Q^1-3
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-1	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-2	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-3
$Si(CH_3)_3$	Q^1-1	$Si(CH_3)_3$	Q^1-2	$Si(CH_3)_3$	Q^1-3
2-吡啶基	Q^1-1	2-吡啶基	Q^1-2	2-吡啶基	Q^1-3
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-1	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-2	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-3
2-嘧吩基	Q^1-1	2-嘧吩基	Q^1-2	2-嘧吩基	Q^1-3
5-Cl-2-嘧吩基	Q^1-1	5-Cl-2-嘧吩基	Q^1-2	5-Cl-2-嘧吩基	Q^1-3
2-嘧啶基	Q^1-1	2-嘧啶基	Q^1-2	2-嘧啶基	Q^1-3
4-嘧啶基	Q^1-1	4-嘧啶基	Q^1-2	4-嘧啶基	Q^1-3
2-噻唑基	Q^1-1	2-噻唑基	Q^1-2	2-噻唑基	Q^1-3
5-噻唑基	Q^1-1	5-噻唑基	Q^1-2	5-噻唑基	Q^1-3
2-呋喃甲醯基	Q^1-1	2-呋喃甲醯基	Q^1-2	2-呋喃甲醯基	Q^1-3
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-1	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-2	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-3
甲基	Q^1-4	甲基	Q^1-5	甲基	Q^1-6
乙基	Q^1-4	乙基	Q^1-5	乙基	Q^1-6
n-丙基	Q^1-4	n-丙基	Q^1-5	n-丙基	Q^1-6
n-丁基	Q^1-4	n-丁基	Q^1-5	n-丁基	Q^1-6
i-丙基	Q^1-4	i-丙基	Q^1-5	i-丙基	Q^1-6
i-丁基	Q^1-4	i-丁基	Q^1-5	i-丁基	Q^1-6
s-丁基	Q^1-4	s-丁基	Q^1-5	s-丁基	Q^1-6
t-丁基	Q^1-4	t-丁基	Q^1-5	t-丁基	Q^1-6
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-4	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-5	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-6

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
$CH_2CH{\equiv}CH$	Q^1-4	$CH_2CH{\equiv}CH$	Q^1-5	$CH_2CH{\equiv}CH$	Q^1-6
$CH(CH_3){=}CH_2$	Q^1-4	$CH(CH_3){=}CH_2$	Q^1-5	$CH(CH_3){=}CH_2$	Q^1-6
$CH(CH_3){=}CHCH_3$	Q^1-4	$CH(CH_3){=}CHCH_3$	Q^1-5	$CH(CH_3){=}CHCH_3$	Q^1-6
$CH(CH_3)CH{=}CH_2$	Q^1-4	$CH(CH_3)CH{=}CH_2$	Q^1-5	$CH(CH_3)CH{=}CH_2$	Q^1-6
$CH{=}C(CH_3)_2$	Q^1-4	$CH{=}C(CH_3)_2$	Q^1-5	$CH{=}C(CH_3)_2$	Q^1-6
$CH_2C(CH_3){=}CH_2$	Q^1-4	$CH_2C(CH_3){=}CH_2$	Q^1-5	$CH_2C(CH_3){=}CH_2$	Q^1-6
c-丙基	Q^1-4	c-丙基	Q^1-5	c-丙基	Q^1-6
c-戊基	Q^1-4	c-戊基	Q^1-5	c-戊基	Q^1-6
c-己基	Q^1-4	c-己基	Q^1-5	c-己基	Q^1-6
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-4	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-5	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-6
$Si(CH_3)_3$	Q^1-4	$Si(CH_3)_3$	Q^1-5	$Si(CH_3)_3$	Q^1-6
2-吡啶基	Q^1-4	2-吡啶基	Q^1-5	2-吡啶基	Q^1-6
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-4	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-5	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-6
2-噻吩基	Q^1-4	2-噻吩基	Q^1-5	2-噻吩基	Q^1-6
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-4	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-5	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-6
2-嘧啶基	Q^1-4	2-嘧啶基	Q^1-5	2-嘧啶基	Q^1-6
4-嘧啶基	Q^1-4	4-嘧啶基	Q^1-5	4-嘧啶基	Q^1-6
2-噻唑基	Q^1-4	2-噻唑基	Q^1-5	2-噻唑基	Q^1-6
5-噻唑基	Q^1-4	5-噻唑基	Q^1-5	5-噻唑基	Q^1-6
2-呋喃甲醯基	Q^1-4	2-呋喃甲醯基	Q^1-5	2-呋喃甲醯基	Q^1-6
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-4	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-5	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-6
甲基	Q^1-7	甲基	Q^1-8	甲基	Q^1-9
乙基	Q^1-7	乙基	Q^1-8	乙基	Q^1-9
n-丙基	Q^1-7	n-丙基	Q^1-8	n-丙基	Q^1-9
n-丁基	Q^1-7	n-丁基	Q^1-8	n-丁基	Q^1-9
i-丙基	Q^1-7	i-丙基	Q^1-8	i-丙基	Q^1-9
i-丁基	Q^1-7	i-丁基	Q^1-8	i-丁基	Q^1-9
s-丁基	Q^1-7	s-丁基	Q^1-8	s-丁基	Q^1-9
t-丁基	Q^1-7	t-丁基	Q^1-8	t-丁基	Q^1-9
$CH_2CH{=}CH_2$	Q^1-7	$CH_2CH{=}CH_2$	Q^1-8	$CH_2CH{=}CH_2$	Q^1-9
$CH_2CH{\equiv}CH$	Q^1-7	$CH_2CH{\equiv}CH$	Q^1-8	$CH_2CH{\equiv}CH$	Q^1-9
$CH(CH_3){=}CH_2$	Q^1-7	$CH(CH_3){=}CH_2$	Q^1-8	$CH(CH_3){=}CH_2$	Q^1-9
$CH(CH_3){=}CHCH_3$	Q^1-7	$CH(CH_3){=}CHCH_3$	Q^1-8	$CH(CH_3){=}CHCH_3$	Q^1-9
$CH(CH_3)CH{=}CH_2$	Q^1-7	$CH(CH_3)CH{=}CH_2$	Q^1-8	$CH(CH_3)CH{=}CH_2$	Q^1-9
$CH{=}C(CH_3)_2$	Q^1-7	$CH{=}C(CH_3)_2$	Q^1-8	$CH{=}C(CH_3)_2$	Q^1-9

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-7	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-8	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-9
c-丙基	Q^1-7	c-丙基	Q^1-8	c-丙基	Q^1-9
c-戊基	Q^1-7	c-戊基	Q^1-8	c-戊基	Q^1-9
c-己基	Q^1-7	c-己基	Q^1-8	c-己基	Q^1-9
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-7	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-8	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-9
$Si(CH_3)_3$	Q^1-7	$Si(CH_3)_3$	Q^1-8	$Si(CH_3)_3$	Q^1-9
2-吡啶基	Q^1-7	2-吡啶基	Q^1-8	2-吡啶基	Q^1-9
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-7	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-8	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-9
2-噻吩基	Q^1-7	2-噻吩基	Q^1-8	2-噻吩基	Q^1-9
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-7	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-8	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-9
2-嘧啶基	Q^1-7	2-嘧啶基	Q^1-8	2-嘧啶基	Q^1-9
4-嘧啶基	Q^1-7	4-嘧啶基	Q^1-8	4-嘧啶基	Q^1-9
2-噻唑基	Q^1-7	2-噻唑基	Q^1-8	2-噻唑基	Q^1-9
5-噻唑基	Q^1-7	5-噻唑基	Q^1-8	5-噻唑基	Q^1-9
2-呋喃甲醯基	Q^1-7	2-呋喃甲醯基	Q^1-8	2-呋喃甲醯基	Q^1-9
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-7	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-8	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-9
甲基	Q^1-10	甲基	Q^1-11	甲基	Q^1-12
乙基	Q^1-10	乙基	Q^1-11	乙基	Q^1-12
n-丙基	Q^1-10	n-丙基	Q^1-11	n-丙基	Q^1-12
n-丁基	Q^1-10	n-丁基	Q^1-11	n-丁基	Q^1-12
i-丙基	Q^1-10	i-丙基	Q^1-11	i-丙基	Q^1-12
i-丁基	Q^1-10	i-丁基	Q^1-11	i-丁基	Q^1-12
s-丁基	Q^1-10	s-丁基	Q^1-11	s-丁基	Q^1-12
t-丁基	Q^1-10	t-丁基	Q^1-11	t-丁基	Q^1-12
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-10	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-11	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-12
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-10	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-11	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-12
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-10	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-11	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-12
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-10	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-11	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-12
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-10	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-11	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-12
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-10	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-11	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-12
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-10	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-11	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-12
c-丙基	Q^1-10	c-丙基	Q^1-11	c-丙基	Q^1-12
c-戊基	Q^1-10	c-戊基	Q^1-11	c-戊基	Q^1-12
c-己基	Q^1-10	c-己基	Q^1-11	c-己基	Q^1-12
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-10	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-11	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-12

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
$Si(CH_3)_3$	Q^1-10	$Si(CH_3)_3$	Q^1-11	$Si(CH_3)_3$	Q^1-12
2-吡啶基	Q^1-10	2-吡啶基	Q^1-11	2-吡啶基	Q^1-12
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-10	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-11	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-12
2-噻吩基	Q^1-10	2-噻吩基	Q^1-11	2-噻吩基	Q^1-12
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-10	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-11	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-12
2-嘧啶基	Q^1-10	2-嘧啶基	Q^1-11	2-嘧啶基	Q^1-12
4-嘧啶基	Q^1-10	4-嘧啶基	Q^1-11	4-嘧啶基	Q^1-12
2-噻唑基	Q^1-10	2-噻唑基	Q^1-11	2-噻唑基	Q^1-12
5-噻唑基	Q^1-10	5-噻唑基	Q^1-11	5-噻唑基	Q^1-12
2-呋喃甲醚基	Q^1-10	2-呋喃甲醚基	Q^1-11	2-呋喃甲醚基	Q^1-12
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-10	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-11	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-12
甲基	Q^1-13	2-吡啶基	Q^1-13	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-14
乙基	Q^1-13	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-13	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-14
n-丙基	Q^1-13	2-噻吩基	Q^1-13	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-14
n-丁基	Q^1-13	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-13	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-14
i-丙基	Q^1-13	2-嘧啶基	Q^1-13	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-14
i-丁基	Q^1-13	4-嘧啶基	Q^1-13	c-丙基	Q^1-14
s-丁基	Q^1-13	2-噻唑基	Q^1-13	c-戊基	Q^1-14
t-丁基	Q^1-13	5-噻唑基	Q^1-13	c-己基	Q^1-14
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-13	2-呋喃甲醚基	Q^1-13	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-14
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-13	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-13	$Si(CH_3)_3$	Q^1-14
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-13	甲基	Q^1-14	2-吡啶基	Q^1-14
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-13	乙基	Q^1-14	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-14
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-13	n-丙基	Q^1-14	2-噻吩基	Q^1-14
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-13	n-丁基	Q^1-14	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-14
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-13	i-丙基	Q^1-14	2-嘧啶基	Q^1-14
c-丙基	Q^1-13	i-丁基	Q^1-14	4-嘧啶基	Q^1-14
c-戊基	Q^1-13	s-丁基	Q^1-14	2-噻唑基	Q^1-14
c-己基	Q^1-13	t-丁基	Q^1-14	5-噻唑基	Q^1-14
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-13	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-14	2-呋喃甲醚基	Q^1-14
$Si(CH_3)_3$	Q^1-13	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-14	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-14

表 2 至 15 係關於顯示於下的式 T-1 之結構。$(R^1)_n$ 表示一個取代基或多個取代基的組合。



T-1

表 2

Q 為 Q^1-1

R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$
c-丙基	2-F	i-丁基	2-F	i-丙基	2-F
s-丁基	2-F	c-己基	2-F	t-丁基	2-F
2-吡啶基	2-F	2-噻吩基	2-F	n-丁基	2-F
4-嘧啶基	2-F	$Si(CH_3)_3$	2-F	2,2-diMe-c-丙基	2-F
c-丙基	3-F	i-丁基	3-F	i-丙基	3-F
s-丁基	3-F	c-己基	3-F	t-丁基	3-F
2-吡啶基	3-F	2-噻吩基	3-F	n-丁基	3-F
4-嘧啶基	3-F	$Si(CH_3)_3$	3-F	2,2-diMe-c-丙基	3-F
c-丙基	5-F	i-丁基	5-F	i-丙基	5-F
s-丁基	5-F	c-己基	5-F	t-丁基	5-F
2-吡啶基	5-F	2-噻吩基	5-F	n-丁基	5-F
4-嘧啶基	5-F	$Si(CH_3)_3$	5-F	2,2-diMe-c-丙基	5-F
c-丙基	6-F	i-丁基	6-F	i-丙基	6-F
s-丁基	6-F	c-己基	6-F	t-丁基	6-F
2-吡啶基	6-F	2-噻吩基	6-F	n-丁基	6-F
4-嘧啶基	6-F	$Si(CH_3)_3$	6-F	2,2-diMe-c-丙基	6-F
c-丙基	7-F	i-丁基	7-F	i-丙基	7-F
s-丁基	7-F	c-己基	7-F	t-丁基	7-F
2-吡啶基	7-F	2-噻吩基	7-F	n-丁基	7-F

R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$
4-嘧啶基	7-F	$Si(CH_3)_3$	7-F	2,2-diMe-c-丙基	7-F
c-丙基	8-F	i-丁基	8-F	i-丙基	8-F
s-丁基	8-F	c-己基	8-F	t-丁基	8-F
2-吡啶基	8-F	2-噻吩基	8-F	n-丁基	8-F
4-嘧啶基	8-F	$Si(CH_3)_3$	8-F	2,2-diMe-c-丙基	8-F
c-丙基	2-Cl	i-丁基	2-Cl	i-丙基	2-Cl
s-丁基	2-Cl	c-己基	2-Cl	t-丁基	2-Cl
2-吡啶基	2-Cl	2-噻吩基	2-Cl	n-丁基	2-Cl
4-嘧啶基	2-Cl	$Si(CH_3)_3$	2-Cl	2,2-diMe-c-丙基	2-Cl
c-丙基	3-Cl	i-丁基	3-Cl	i-丙基	3-Cl
s-丁基	3-Cl	c-己基	3-Cl	t-丁基	3-Cl
2-吡啶基	3-Cl	2-噻吩基	3-Cl	n-丁基	3-Cl
4-嘧啶基	3-Cl	$Si(CH_3)_3$	3-Cl	2,2-diMe-c-丙基	3-Cl
c-丙基	5-Cl	i-丁基	5-Cl	i-丙基	5-Cl
s-丁基	5-Cl	c-己基	5-Cl	t-丁基	5-Cl
2-吡啶基	5-Cl	2-噻吩基	5-Cl	n-丁基	5-Cl
4-嘧啶基	5-Cl	$Si(CH_3)_3$	5-Cl	2,2-diMe-c-丙基	5-Cl
c-丙基	6-Cl	i-丁基	6-Cl	i-丙基	6-Cl
s-丁基	6-Cl	c-己基	6-Cl	t-丁基	6-Cl
2-吡啶基	6-Cl	2-噻吩基	6-Cl	n-丁基	6-Cl
4-嘧啶基	6-Cl	$Si(CH_3)_3$	6-Cl	2,2-diMe-c-丙基	6-Cl
c-丙基	7-Cl	i-丁基	7-Cl	i-丙基	7-Cl
s-丁基	7-Cl	c-己基	7-Cl	t-丁基	7-Cl
2-吡啶基	7-Cl	2-噻吩基	7-Cl	n-丁基	7-Cl
4-嘧啶基	7-Cl	$Si(CH_3)_3$	7-Cl	2,2-diMe-c-丙基	7-Cl
c-丙基	8-Cl	i-丁基	8-Cl	i-丙基	8-Cl
s-丁基	8-Cl	c-己基	8-Cl	t-丁基	8-Cl
2-吡啶基	8-Cl	2-噻吩基	8-Cl	n-丁基	8-Cl
4-嘧啶基	8-Cl	$Si(CH_3)_3$	8-Cl	2,2-diMe-c-丙基	8-Cl
c-丙基	2-CF_3	i-丁基	2-CF_3	i-丙基	2-CF_3
s-丁基	2-CF_3	c-己基	2-CF_3	t-丁基	2-CF_3
2-吡啶基	2-CF_3	2-噻吩基	2-CF_3	n-丁基	2-CF_3
4-嘧啶基	2-CF_3	$Si(CH_3)_3$	2-CF_3	2,2-diMe-c-丙基	2-CF_3
c-丙基	3-CF_3	i-丁基	3-CF_3	i-丙基	3-CF_3
s-丁基	3-CF_3	c-己基	3-CF_3	t-丁基	3-CF_3

R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$
2-吡啶基	3-CF_3	2-噻吩基	3-CF_3	n-丁基	3-CF_3
4-嘧啶基	3-CF_3	$Si(CH_3)_3$	3-CF_3	2,2-diMe-c-丙基	3-CF_3
c-丙基	5-CF_3	i-丁基	5-CF_3	i-丙基	5-CF_3
s-丁基	5-CF_3	c-己基	5-CF_3	t-丁基	5-CF_3
2-吡啶基	5-CF_3	2-噻吩基	5-CF_3	n-丁基	5-CF_3
4-嘧啶基	5-CF_3	$Si(CH_3)_3$	5-CF_3	2,2-diMe-c-丙基	5-CF_3
c-丙基	6-CF_3	i-丁基	6-CF_3	i-丙基	6-CF_3
s-丁基	6-CF_3	c-己基	6-CF_3	t-丁基	6-CF_3
2-吡啶基	6-CF_3	2-噻吩基	6-CF_3	n-丁基	6-CF_3
4-嘧啶基	6-CF_3	$Si(CH_3)_3$	6-CF_3	2,2-diMe-c-丙基	6-CF_3
c-丙基	7-CF_3	i-丁基	7-CF_3	i-丙基	7-CF_3
s-丁基	7-CF_3	c-己基	7-CF_3	t-丁基	7-CF_3
2-吡啶基	7-CF_3	2-噻吩基	7-CF_3	n-丁基	7-CF_3
4-嘧啶基	7-CF_3	$Si(CH_3)_3$	7-CF_3	2,2-diMe-c-丙基	7-CF_3
c-丙基	8-CF_3	i-丁基	8-CF_3	i-丙基	8-CF_3
s-丁基	8-CF_3	c-己基	8-CF_3	t-丁基	8-CF_3
2-吡啶基	8-CF_3	2-噻吩基	8-CF_3	n-丁基	8-CF_3
4-嘧啶基	8-CF_3	$Si(CH_3)_3$	8-CF_3	2,2-diMe-c-丙基	8-CF_3
c-丙基	2-Me	i-丁基	2-Me	i-丙基	2-Me
s-丁基	2-Me	c-己基	2-Me	t-丁基	2-Me
2-吡啶基	2-Me	2-噻吩基	2-Me	n-丁基	2-Me
4-嘧啶基	2-Me	$Si(CH_3)_3$	2-Me	2,2-diMe-c-丙基	2-Me
c-丙基	3-Me	i-丁基	3-Me	i-丙基	3-Me
s-丁基	3-Me	c-己基	3-Me	t-丁基	3-Me
2-吡啶基	3-Me	2-噻吩基	3-Me	n-丁基	3-Me
4-嘧啶基	3-Me	$Si(CH_3)_3$	3-Me	2,2-diMe-c-丙基	3-Me
c-丙基	5-Me	i-丁基	5-Me	i-丙基	5-Me
s-丁基	5-Me	c-己基	5-Me	t-丁基	5-Me
2-吡啶基	5-Me	2-噻吩基	5-Me	n-丁基	5-Me
4-嘧啶基	5-Me	$Si(CH_3)_3$	5-Me	2,2-diMe-c-丙基	5-Me
c-丙基	6-Me	i-丁基	6-Me	i-丙基	6-Me
s-丁基	6-Me	c-己基	6-Me	t-丁基	6-Me
2-吡啶基	6-Me	2-噻吩基	6-Me	n-丁基	6-Me
4-嘧啶基	6-Me	$Si(CH_3)_3$	6-Me	2,2-diMe-c-丙基	6-Me
c-丙基	7-Me	i-丁基	7-Me	i-丙基	7-Me

R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$
s-丁基	7-Me	c-己基	7-Me	t-丁基	7-Me
2-吡啶基	7-Me	2-噻吩基	7-Me	n-丁基	7-Me
4-嘧啶基	7-Me	$Si(CH_3)_3$	7-Me	2,2-diMe-c-丙基	7-Me
c-丙基	8-Me	i-丁基	8-Me	i-丙基	8-Me
s-丁基	8-Me	c-己基	8-Me	t-丁基	8-Me
2-吡啶基	8-Me	2-噻吩基	8-Me	n-丁基	8-Me
4-嘧啶基	8-Me	$Si(CH_3)_3$	8-Me	2,2-diMe-c-丙基	8-Me
c-丙基	2-OMe	i-丁基	2-OMe	i-丙基	2-OMe
s-丁基	2-OMe	c-己基	2-OMe	t-丁基	2-OMe
2-吡啶基	2-OMe	2-噻吩基	2-OMe	n-丁基	2-OMe
4-嘧啶基	2-OMe	$Si(CH_3)_3$	2-OMe	2,2-diMe-c-丙基	2-OMe
c-丙基	2-OEt	i-丁基	2-OEt	i-丙基	2-OEt
s-丁基	2-OEt	c-己基	2-OEt	t-丁基	2-OEt
2-吡啶基	2-OEt	2-噻吩基	2-OEt	n-丁基	2-OEt
4-嘧啶基	2-OEt	$Si(CH_3)_3$	2-OEt	2,2-diMe-c-丙基	2-OEt
c-丙基	2-O-iPr	i-丁基	2-O-iPr	i-丙基	2-O-iPr
s-丁基	2-O-iPr	c-己基	2-O-iPr	t-丁基	2-O-iPr
2-吡啶基	2-O-iPr	2-噻吩基	2-O-iPr	n-丁基	2-O-iPr
4-嘧啶基	2-O-iPr	$Si(CH_3)_3$	2-O-iPr	2,2-diMe-c-丙基	2-O-iPr
c-丙基	2-O-iBu	i-丁基	2-O-iBu	i-丙基	2-O-iBu
s-丁基	2-O-iBu	c-己基	2-O-iBu	t-丁基	2-O-iBu
2-吡啶基	2-O-iBu	2-噻吩基	2-O-iBu	n-丁基	2-O-iBu
4-嘧啶基	2-O-iBu	$Si(CH_3)_3$	2-O-iBu	2,2-diMe-c-丙基	2-O-iBu
c-丙基	2-O-nBu	i-丁基	2-O-nBu	i-丙基	2-O-nBu
s-丁基	2-O-nBu	c-己基	2-O-nBu	t-丁基	2-O-nBu
2-吡啶基	2-O-nBu	2-噻吩基	2-O-nBu	n-丁基	2-O-nBu
4-嘧啶基	2-O-nBu	$Si(CH_3)_3$	2-O-nBu	2,2-diMe-c-丙基	2-O-nBu
c-丙基	5,7-diCl	i-丁基	5,7-diCl	i-丙基	5,7-diCl
s-丁基	5,7-diCl	c-己基	5,7-diCl	t-丁基	5,7-diCl
2-吡啶基	5,7-diCl	2-噻吩基	5,7-diCl	n-丁基	5,7-diCl
4-嘧啶基	5,7-diCl	$Si(CH_3)_3$	5,7-diCl	2,2-diMe-c-丙基	5,7-diCl
c-丙基	6,7-diCl	i-丁基	6,7-diCl	i-丙基	6,7-diCl
s-丁基	6,7-diCl	c-己基	6,7-diCl	t-丁基	6,7-diCl
2-吡啶基	6,7-diCl	2-噻吩基	6,7-diCl	n-丁基	6,7-diCl
4-嘧啶基	6,7-diCl	$Si(CH_3)_3$	6,7-diCl	2,2-diMe-c-丙基	6,7-diCl

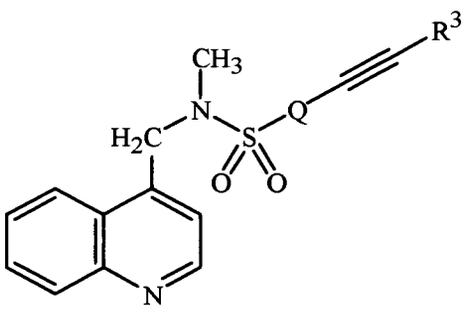
R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$	R^3	$(R^1)_n$
c-丙基	5,8-diCl	i-丁基	5,8-diCl	i-丙基	5,8-diCl
s-丁基	5,8-diCl	c-己基	5,8-diCl	t-丁基	5,8-diCl
2-吡啶基	5,8-diCl	2-噻吩基	5,8-diCl	n-丁基	5,8-diCl
4-嘧啶基	5,8-diCl	$Si(CH_3)_3$	5,8-diCl	2,2-diMe-c-丙基	5,8-diCl
c-丙基	7,8-diCl	i-丁基	7,8-diCl	i-丙基	7,8-diCl
s-丁基	7,8-diCl	c-己基	7,8-diCl	t-丁基	7,8-diCl
2-吡啶基	7,8-diCl	2-噻吩基	7,8-diCl	n-丁基	7,8-diCl
4-嘧啶基	7,8-diCl	$Si(CH_3)_3$	7,8-diCl	2,2-diMe-c-丙基	7,8-diCl
c-丙基	5,7-diCl	i-丁基	5,7-diCl	i-丙基	5,7-diCl
s-丁基	5,7-diCl	c-己基	5,7-diCl	t-丁基	5,7-diCl
2-吡啶基	5,7-diCl	2-噻吩基	5,7-diCl	n-丁基	5,7-diCl
4-嘧啶基	5,7-diCl	$Si(CH_3)_3$	5,7-diCl	2,2-diMe-c-丙基	5,7-diCl
c-丙基	6,8-diF	i-丁基	6,8-diF	i-丙基	6,8-diF
s-丁基	6,8-diF	c-己基	6,8-diF	t-丁基	6,8-diF
2-吡啶基	6,8-diF	2-噻吩基	6,8-diF	n-丁基	6,8-diF
4-嘧啶基	6,8-diF	$Si(CH_3)_3$	6,8-diF	2,2-diMe-c-丙基	6,8-diF
c-丙基	7,8-diF	i-丁基	7,8-diF	i-丙基	7,8-diF
s-丁基	7,8-diF	c-己基	7,8-diF	t-丁基	7,8-diF
2-吡啶基	7,8-diF	2-噻吩基	7,8-diF	n-丁基	7,8-diF
4-嘧啶基	7,8-diF	$Si(CH_3)_3$	7,8-diF	2,2-diMe-c-丙基	7,8-diF

本揭露也包括表 3 至表 15，其中每一個表的架構與以上表 2 相同，不同之處僅在於表 2 的表標題（即「Q 為 Q^1-1」被以下顯示的各個表標題取代。例如，在表 3 中表標題為「Q 為 Q^1-2」且 R^3 與$(R^1)_n$之定義如同上表 2。因此，表 3 的第一項具體揭露一種式 1 化合物，其中 Q 為 Q^1-2，R^3 為 c-Pr 以及$(R^1)_n$為 2-氟。

表	表標題	表	表標題
3	Q 為 Q^1-2	10	Q 為 Q^1-9
4	Q 為 Q^1-3	11	Q 為 Q^1-10
5	Q 為 Q^1-4	12	Q 為 Q^1-11

表	表標題	表	表標題
6	Q 為 Q^1-5	13	Q 為 Q^1-12
7	Q 為 Q^1-6	14	Q 為 Q^1-13
8	Q 為 Q^1-7	15	Q 為 Q^1-14
9	Q 為 Q^1-8		

表 16

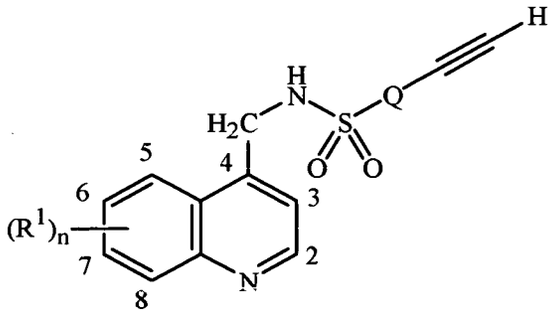


R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
甲基	Q^1-1	甲基	Q^1-2	甲基	Q^1-3
乙基	Q^1-1	乙基	Q^1-2	乙基	Q^1-3
n-丙基	Q^1-1	n-丙基	Q^1-2	n-丙基	Q^1-3
n-丁基	Q^1-1	n-丁基	Q^1-2	n-丁基	Q^1-3
i-丙基	Q^1-1	i-丙基	Q^1-2	i-丙基	Q^1-3
i-丁基	Q^1-1	i-丁基	Q^1-2	i-丁基	Q^1-3
s-丁基	Q^1-1	s-丁基	Q^1-2	s-丁基	Q^1-3
t-丁基	Q^1-1	t-丁基	Q^1-2	t-丁基	Q^1-3
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-1	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-2	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-3
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-1	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-2	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-3
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-1	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-2	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-3
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-1	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-2	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-3
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-1	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-2	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-3
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-1	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-2	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-3
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-1	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-2	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-3
c-丙基	Q^1-1	c-丙基	Q^1-2	c-丙基	Q^1-3
c-戊基	Q^1-1	c-戊基	Q^1-2	c-戊基	Q^1-3
c-己基	Q^1-1	c-己基	Q^1-2	c-己基	Q^1-3

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-1	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-2	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-3
$Si(CH_3)_3$	Q^1-1	$Si(CH_3)_3$	Q^1-2	$Si(CH_3)_3$	Q^1-3
2-吡啶基	Q^1-1	2-吡啶基	Q^1-2	2-吡啶基	Q^1-3
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-1	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-2	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-3
2-噻吩基	Q^1-1	2-噻吩基	Q^1-2	2-噻吩基	Q^1-3
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-1	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-2	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-3
2-嘧啶基	Q^1-1	2-嘧啶基	Q^1-2	2-嘧啶基	Q^1-3
4-嘧啶基	Q^1-1	4-嘧啶基	Q^1-2	4-嘧啶基	Q^1-3
2-噻唑基	Q^1-1	2-噻唑基	Q^1-2	2-噻唑基	Q^1-3
5-噻唑基	Q^1-1	5-噻唑基	Q^1-2	5-噻唑基	Q^1-3
2-呋喃甲醯基	Q^1-1	2-呋喃甲醯基	Q^1-2	2-呋喃甲醯基	Q^1-3
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-1	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-2	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-3
甲基	Q^1-4	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-4	2-吡啶基	Q^1-4
乙基	Q^1-4	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-4	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-4
n-丙基	Q^1-4	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-4	2-噻吩基	Q^1-4
n-丁基	Q^1-4	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-4	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-4
i-丙基	Q^1-4	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-4	2-嘧啶基	Q^1-4
i-丁基	Q^1-4	c-丙基	Q^1-4	4-嘧啶基	Q^1-4
s-丁基	Q^1-4	c-戊基	Q^1-4	2-噻唑基	Q^1-4
t-丁基	Q^1-4	c-己基	Q^1-4	5-噻唑基	Q^1-4
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-4	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-4	2-呋喃甲醯基	Q^1-4
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-4	$Si(CH_3)_3$	Q^1-4	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-4

如以上流程 2 所揭露，式 1a 化合物（即式 1 其中 R^3 為 H)為可用於製備式 1 化合物的中間物。本發明包括但不限於表 17 中所揭露之式 1a 化合物的例示性物種。

表 17



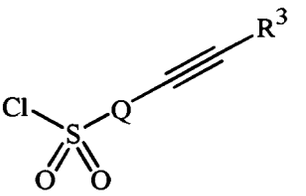
$(R^1)_n$表示一個取代基或多個取代基之組合，並且無$(R^1)_n$取代基則以破折號「-」表示。

$(R^1)_n$	Q	$(R^1)_n$	Q	$(R^1)_n$	Q
-	Q^1-1	-	Q^1-2	-	Q^1-3
8-F	Q^1-1	8-F	Q^1-2	8-F	Q^1-3
6,8-二-F	Q^1-1	6,8-二-F	Q^1-2	6,8-二-F	Q^1-3
6,8-二-Me	Q^1-1	6,8-二-Me	Q^1-2	6,8-二-Me	Q^1-3
3-F	Q^1-1	3-F	Q^1-2	3-F	Q^1-3
8-F-3-Me	Q^1-1	8-F-3-Me	Q^1-2	8-F-3-Me	Q^1-3
-	Q^1-4	-	Q^1-5	-	Q^1-6
8-F	Q^1-4	8-F	Q^1-5	8-F	Q^1-6
6,8-二-F	Q^1-4	6,8-二-F	Q^1-5	6,8-二-F	Q^1-6
6,8-二-Me	Q^1-4	6,8-二-Me	Q^1-5	6,8-二-Me	Q^1-6
3-F	Q^1-4	3-F	Q^1-5	3-F	Q^1-6
8-F-3-Me	Q^1-4	8-F-3-Me	Q^1-5	8-F-3-Me	Q^1-6
-	Q^1-7	-	Q^1-8	-	Q^1-9
8-F	Q^1-7	8-F	Q^1-8	8-F	Q^1-9
6,8-二-F	Q^1-7	6,8-二-F	Q^1-8	6,8-二-F	Q^1-9
6,8-二-Me	Q^1-7	6,8-二-Me	Q^1-8	6,8-二-Me	Q^1-9
3-F	Q^1-7	3-F	Q^1-8	3-F	Q^1-9
8-F-3-Me	Q^1-7	8-F-3-Me	Q^1-8	8-F-3-Me	Q^1-9
-	Q^1-10	-	Q^1-11	-	Q^1-12
8-F	Q^1-10	8-F	Q^1-11	8-F	Q^1-12
6,8-二-F	Q^1-10	6,8-二-F	Q^1-11	6,8-二-F	Q^1-12
6,8-二-Me	Q^1-10	6,8-二-Me	Q^1-11	6,8-二-Me	Q^1-12
3-F	Q^1-10	3-F	Q^1-11	3-F	Q^1-12

$(R^1)_n$	Q	$(R^1)_n$	Q	$(R^1)_n$	Q
8-F-3-Me	Q^1-10	8-F-3-Me	Q^1-11	8-F-3-Me	Q^1-12
-	Q^1-13	-	Q^1-14		
8-F	Q^1-13	8-F	Q^1-14		
6,8-二-F	Q^1-13	6,8-二-F	Q^1-14		
6,8-二-Me	Q^1-13	6,8-二-Me	Q^1-14		
3-F	Q^1-13	3-F	Q^1-14		
8-F-3-Me	Q^1-13	8-F-3-Me	Q^1-14		

如上述流程 3 中所揭露，式 7 化合物為可用於製備式 1 化合物的中間物。本發明包括但不限於表 18 中所揭露之式 7 化合物的例示性物種。

表 18



R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
甲基	Q^1-1	甲基	Q^1-2	甲基	Q^1-3
乙基	Q^1-1	乙基	Q^1-2	乙基	Q^1-3
n-丙基	Q^1-1	n-丙基	Q^1-2	n-丙基	Q^1-3
n-丁基	Q^1-1	n-丁基	Q^1-2	n-丁基	Q^1-3
i-丙基	Q^1-1	i-丙基	Q^1-2	i-丙基	Q^1-3
i-丁基	Q^1-1	i-丁基	Q^1-2	i-丁基	Q^1-3
s-丁基	Q^1-1	s-丁基	Q^1-2	s-丁基	Q^1-3
t-丁基	Q^1-1	t-丁基	Q^1-2	t-丁基	Q^1-3
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-1	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-2	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-3
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-1	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-2	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-3
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-1	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-2	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-3
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-1	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-2	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-3

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-1	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-2	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-3
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-1	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-2	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-3
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-1	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-2	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-3
c-丙基	Q^1-1	c-丙基	Q^1-2	c-丙基	Q^1-3
c-戊基	Q^1-1	c-戊基	Q^1-2	c-戊基	Q^1-3
c-己基	Q^1-1	c-己基	Q^1-2	c-己基	Q^1-3
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-1	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-2	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-3
$Si(CH_3)_3$	Q^1-1	$Si(CH_3)_3$	Q^1-2	$Si(CH_3)_3$	Q^1-3
2-吡啶基	Q^1-1	2-吡啶基	Q^1-2	2-吡啶基	Q^1-3
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-1	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-2	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-3
2-噻吩基	Q^1-1	2-噻吩基	Q^1-2	2-噻吩基	Q^1-3
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-1	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-2	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-3
2-嘧啶基	Q^1-1	2-嘧啶基	Q^1-2	2-嘧啶基	Q^1-3
4-嘧啶基	Q^1-1	4-嘧啶基	Q^1-2	4-嘧啶基	Q^1-3
2-噻唑基	Q^1-1	2-噻唑基	Q^1-2	2-噻唑基	Q^1-3
5-噻唑基	Q^1-1	5-噻唑基	Q^1-2	5-噻唑基	Q^1-3
2-呋喃甲醯基	Q^1-1	2-呋喃甲醯基	Q^1-2	2-呋喃甲醯基	Q^1-3
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-1	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-2	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-3
甲基	Q^1-4	甲基	Q^1-5	甲基	Q^1-6
乙基	Q^1-4	乙基	Q^1-5	乙基	Q^1-6
n-丙基	Q^1-4	n-丙基	Q^1-5	n-丙基	Q^1-6
n-丁基	Q^1-4	n-丁基	Q^1-5	n-丁基	Q^1-6
i-丙基	Q^1-4	i-丙基	Q^1-5	i-丙基	Q^1-6
i-丁基	Q^1-4	i-丁基	Q^1-5	i-丁基	Q^1-6
s-丁基	Q^1-4	s-丁基	Q^1-5	s-丁基	Q^1-6
t-丁基	Q^1-4	t-丁基	Q^1-5	t-丁基	Q^1-6
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-4	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-5	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-6
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-4	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-5	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-6
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-4	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-5	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-6
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-4	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-5	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-6
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-4	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-5	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-6
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-4	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-5	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-6
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-4	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-5	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-6
c-丙基	Q^1-4	c-丙基	Q^1-5	c-丙基	Q^1-6
c-戊基	Q^1-4	c-戊基	Q^1-5	c-戊基	Q^1-6

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
c-己基	Q^1-4	c-己基	Q^1-5	c-己基	Q^1-6
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-4	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-5	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-6
$Si(CH_3)_3$	Q^1-4	$Si(CH_3)_3$	Q^1-5	$Si(CH_3)_3$	Q^1-6
2-吡啶基	Q^1-4	2-吡啶基	Q^1-5	2-吡啶基	Q^1-6
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-4	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-5	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-6
2-噻吩基	Q^1-4	2-噻吩基	Q^1-5	2-噻吩基	Q^1-6
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-4	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-5	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-6
2-嘧啶基	Q^1-4	2-嘧啶基	Q^1-5	2-嘧啶基	Q^1-6
4-嘧啶基	Q^1-4	4-嘧啶基	Q^1-5	4-嘧啶基	Q^1-6
2-噻唑基	Q^1-4	2-噻唑基	Q^1-5	2-噻唑基	Q^1-6
5-噻唑基	Q^1-4	5-噻唑基	Q^1-5	5-噻唑基	Q^1-6
2-呋喃甲醯基	Q^1-4	2-呋喃甲醯基	Q^1-5	2-呋喃甲醯基	Q^1-6
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-4	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-5	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-6
甲基	Q^1-7	甲基	Q^1-8	甲基	Q^1-9
乙基	Q^1-7	乙基	Q^1-8	乙基	Q^1-9
n-丙基	Q^1-7	n-丙基	Q^1-8	n-丙基	Q^1-9
n-丁基	Q^1-7	n-丁基	Q^1-8	n-丁基	Q^1-9
i-丙基	Q^1-7	i-丙基	Q^1-8	i-丙基	Q^1-9
i-丁基	Q^1-7	i-丁基	Q^1-8	i-丁基	Q^1-9
s-丁基	Q^1-7	s-丁基	Q^1-8	s-丁基	Q^1-9
t-丁基	Q^1-7	t-丁基	Q^1-8	t-丁基	Q^1-9
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-7	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-8	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-9
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-7	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-8	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-9
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-7	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-8	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-9
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-7	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-8	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-9
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-7	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-8	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-9
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-7	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-8	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-9
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-7	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-8	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-9
c-丙基	Q^1-7	c-丙基	Q^1-8	c-丙基	Q^1-9
c-戊基	Q^1-7	c-戊基	Q^1-8	c-戊基	Q^1-9
c-己基	Q^1-7	c-己基	Q^1-8	c-己基	Q^1-9
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-7	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-8	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-9
$Si(CH_3)_3$	Q^1-7	$Si(CH_3)_3$	Q^1-8	$Si(CH_3)_3$	Q^1-9
2-吡啶基	Q^1-7	2-吡啶基	Q^1-8	2-吡啶基	Q^1-9
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-7	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-8	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-9

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
2-噻吩基	Q^1-7	2-噻吩基	Q^1-8	2-噻吩基	Q^1-9
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-7	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-8	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-9
2-嘧啶基	Q^1-7	2-嘧啶基	Q^1-8	2-嘧啶基	Q^1-9
4-嘧啶基	Q^1-7	4-嘧啶基	Q^1-8	4-嘧啶基	Q^1-9
2-噻唑基	Q^1-7	2-噻唑基	Q^1-8	2-噻唑基	Q^1-9
5-噻唑基	Q^1-7	5-噻唑基	Q^1-8	5-噻唑基	Q^1-9
2-呋喃甲醯基	Q^1-7	2-呋喃甲醯基	Q^1-8	2-呋喃甲醯基	Q^1-9
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-7	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-8	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-9
甲基	Q^1-10	甲基	Q^1-11	甲基	Q^1-12
乙基	Q^1-10	乙基	Q^1-11	乙基	Q^1-12
n-丙基	Q^1-10	n-丙基	Q^1-11	n-丙基	Q^1-12
n-丁基	Q^1-10	n-丁基	Q^1-11	n-丁基	Q^1-12
i-丙基	Q^1-10	i-丙基	Q^1-11	i-丙基	Q^1-12
i-丁基	Q^1-10	i-丁基	Q^1-11	i-丁基	Q^1-12
s-丁基	Q^1-10	s-丁基	Q^1-11	s-丁基	Q^1-12
t-丁基	Q^1-10	t-丁基	Q^1-11	t-丁基	Q^1-12
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-10	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-11	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-12
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-10	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-11	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-12
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-10	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-11	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-12
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-10	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-11	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-12
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-10	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-11	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-12
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-10	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-11	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-12
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-10	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-11	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-12
c-丙基	Q^1-10	c-丙基	Q^1-11	c-丙基	Q^1-12
c-戊基	Q^1-10	c-戊基	Q^1-11	c-戊基	Q^1-12
c-己基	Q^1-10	c-己基	Q^1-11	c-己基	Q^1-12
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-10	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-11	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-12
$Si(CH_3)_3$	Q^1-10	$Si(CH_3)_3$	Q^1-11	$Si(CH_3)_3$	Q^1-12
2-吡啶基	Q^1-10	2-吡啶基	Q^1-11	2-吡啶基	Q^1-12
4-Cl-2-吡啶基	Q^1-10	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-11	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-12
2-噻吩基	Q^1-10	2-噻吩基	Q^1-11	2-噻吩基	Q^1-12
5-Cl-2-噻吩基	Q^1-10	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-11	5-Cl-2-噻吩基	Q^1-12
2-嘧啶基	Q^1-10	2-嘧啶基	Q^1-11	2-嘧啶基	Q^1-12
4-嘧啶基	Q^1-10	4-嘧啶基	Q^1-11	4-嘧啶基	Q^1-12
2-噻唑基	Q^1-10	2-噻唑基	Q^1-11	2-噻唑基	Q^1-12

R^3	Q	R^3	Q	R^3	Q
5-噻唑基	Q^1-10	5-噻唑基	Q^1-11	5-噻唑基	Q^1-12
2-呋喃甲醯基	Q^1-10	2-呋喃甲醯基	Q^1-11	2-呋喃甲醯基	Q^1-12
1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-10	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-11	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-12
甲基	Q^1-13	2-吡啶基	Q^1-13	$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-14
乙基	Q^1-13	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-13	$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-14
n-丙基	Q^1-13	2-嘧吩基	Q^1-13	$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-14
n-丁基	Q^1-13	5-Cl-2-嘧吩基	Q^1-13	$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-14
i-丙基	Q^1-13	2-嘧啶基	Q^1-13	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-14
i-丁基	Q^1-13	4-嘧啶基	Q^1-13	c-丙基	Q^1-14
s-丁基	Q^1-13	2-噻唑基	Q^1-13	c-戊基	Q^1-14
t-丁基	Q^1-13	5-噻唑基	Q^1-13	c-己基	Q^1-14
$CH_2CH=CH_2$	Q^1-13	2-呋喃甲醯基	Q^1-13	2,2-diMe-c-丙基	Q^1-14
$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-13	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-13	$Si(CH_3)_3$	Q^1-14
$CH(CH_3)=CH_2$	Q^1-13	甲基	Q^1-14	2-吡啶基	Q^1-14
$CH(CH_3)=CHCH_3$	Q^1-13	乙基	Q^1-14	4-Cl-2-吡啶基	Q^1-14
$CH(CH_3)CH=CH_2$	Q^1-13	n-丙基	Q^1-14	2-嘧吩基	Q^1-14
$CH=C(CH_3)_2$	Q^1-13	n-丁基	Q^1-14	5-Cl-2-嘧吩基	Q^1-14
$CH_2C(CH_3)=CH_2$	Q^1-13	i-丙基	Q^1-14	2-嘧啶基	Q^1-14
c-丙基	Q^1-13	i-丁基	Q^1-14	4-嘧啶基	Q^1-14
c-戊基	Q^1-13	s-丁基	Q^1-14	2-噻唑基	Q^1-14
c-己基	Q^1-13	t-丁基	Q^1-14	5-噻唑基	Q^1-14
2,2-diMe-c-丙基	Q^1-13	$CH_2CH=CH_2$	Q^1-14	2-呋喃甲醯基	Q^1-14
$Si(CH_3)_3$	Q^1-13	$CH_2CH\equiv CH$	Q^1-14	1-Me-3-(CF_3)吡唑-5-基	Q^1-14

本發明之化合物大體而言將用於作為組成物（即配方）中的蠕蟲控制活性成分，且該組成物具有至少一選自醫藥上或獸醫上可接受載劑或稀釋劑的額外成分。將配方或組成物成分選擇為與活性成分的物理性質、投藥模式及諸如處理的動物類型等因素一致。

式 1 化合物較佳係用於未修飾的形式或較佳係與傳統用於醫藥或獸醫配方技藝中的佐藥一起使用，因此，可以習知的方式處理，以提供例如可乳化的濃縮物、可直接稀釋的溶液、稀釋的乳劑、可溶性散劑、細粒或在聚合物物質中的微膠囊。至於該組成物，依據預定的目標和當時的情況選擇施加方法。

在獸醫部分的應用是藉由現有的方法，如藉由腸內投予的形式，例如包括泡騰劑的錠劑、膠囊、微膠囊、飲料、灌藥製劑（溶液、乳劑、懸浮液）、顆粒、糊劑、散劑、丸劑（boli）、食品添加劑或栓劑；或藉由腸外投予，諸如藉由注射液（包括肌肉內、皮下、靜脈內、腹膜內）或植入物；藉由經鼻投予；藉由局部投予，例如以浸泡或浸漬、噴霧、洗滌、以散劑塗佈或經由澆潑配方施用於動物之較小區域之形式，及經由包含本發明之化合物或組成物之物品（諸如頸環、耳環、尾帶、肢帶或韁繩）。

本發明之化合物可以控制的釋放型式投予，例如以皮下緩慢釋放的配方。

該配方（即藥劑）、含有式 1 活性成分的配製或組成物、或這些活性成分與其他活性成分的組合、以及選擇性的固體或液體佐藥係以該技術領域中習知的方式生產，例如使用散佈組成物充分混合及/或磨碎活性成分，例如使用溶劑、固體載劑及選擇性的表面活性化合物（界面活性劑）。

問題中的溶劑可以是：醇類如乙醇、丙醇或丁醇和二醇以及其醚類和酯類，如丙二醇、二丙二醇醚、乙二

醇、乙二醇單甲基或乙基醚，酮類如環己酮、異佛酮或二乙醯酮醇（diacetanol alcohol），強極性溶劑如 *N*-甲基-2-吡咯啶酮、二甲基亞碸或二甲基甲醯胺、或水，植物油如油菜、蓖麻、椰子或黃豆油以及若適合的話還有聚矽氧油。

對於包括靜脈內、肌肉內及皮下注射之非經腸投予而言，本發明之化合物可調配為於油性或水性媒劑中之懸浮液、溶液或乳液，且可含有諸如懸浮液、穩定劑及/或分散劑之添加劑。本發明之化合物亦可經調配用於快速注射或連續輸液。用於注射之醫藥及獸醫組成物包括水溶性形式活性成分（例如，活性化合物之鹽）之水溶液，較佳於含有醫藥及獸醫調配技術中已知之其他賦形劑或助劑的生理學相容緩衝劑中之水溶液。此外，於親脂性媒劑中可製備活性化合物之懸浮液。合適親脂性媒劑包括脂肪油（諸如，芝麻油）、合成脂肪酸酯（諸如，油酸乙酯及三酸甘油酯）或諸如脂質體之物質。水性注射懸浮液可含有增加懸浮液黏度之物質，諸如羧甲纖維素納、山梨糖醇、或葡聚糖。用於注射之配方可以單位劑型存在，例如存在安瓿或多劑量容器中。或者，活性成分可呈粉末形式以便在使用前用合適媒劑（例如，無菌無熱原水）組配。

除上文所述之配方外，本發明之化合物亦可調配為儲槽式製劑。該等長效配方可藉由植入（例如，皮下或肌肉內）或藉由肌肉內或皮下注射來投予。本發明之化合物可與合適聚合性或疏水性材料一起調配（例如，與藥理學上可接受之油調配為乳液）、與離子交換樹脂一

起調配、或調配為微溶衍生物（諸如（但不限於）微溶鹽）以用於此投予途徑。

對於藉由吸入投予而言，本發明之化合物可使用加壓包裝或噴霧器及適當推進劑（例如（但不限於）二氯二氟甲烷、三氯氟甲烷、二氯四氟乙烷或二氧化碳）以氣霧劑噴霧形式來傳遞。在加壓氣霧劑之狀況下，單位劑量可藉由提供閥來控制以傳遞經計量之量。可將於吸入器或吹入器中使用之（例如）明膠膠囊及藥筒調配成含有化合物與合適粉末基質（諸如，乳糖或澱粉）之粉末混合物。

已發現本發明之化合物具有有利之藥物動力學及藥效學性質，提供自經口投藥及攝入之系統可用性。因此，在欲保護之動物攝入後，血液中有效殺寄生蟲劑濃度之本發明化合物可保護已處理動物免受吸血害蟲侵害。因此，值得注意的是用於保護動物免於無脊椎動物寄生害蟲感染的組成物，其形式係用於口服投予（即除了殺寄生蟲有效量的本發明化合物之外包含一或多個選自適用於口服投藥黏合劑和填充劑的載劑及飼料濃縮載劑）。

對於以溶液（對於吸收最易利用之形式）、乳液、懸浮液、糊劑、凝膠、膠囊、錠劑、食團、散劑、顆粒、瘤胃保留物及飼料/水/舔瑰（lick blocks）之形式經口投藥而言，本發明之化合物可與該領域中已知之適於經口投予組成物的黏合劑/填充劑一起調配，該等黏合劑/填充劑諸如糖及糖衍生物（例如，乳糖、蔗糖、甘露糖醇、山梨糖醇）、澱粉（例如，玉米澱粉、小麥澱粉、米澱

粉、馬鈴薯澱粉)、纖維素及衍生物(例如甲基纖維素、羧甲基纖維素、乙基羥基纖維素)、蛋白質衍生物(例如,玉米蛋白、明膠)及合成聚合物(例如聚乙烯醇、聚乙烯吡咯啶酮)。必要時,可添加潤滑劑(例如,硬脂酸鎂)、破碎劑(例如,交聯之聚乙烯吡咯啶酮、瓊脂、褐藻酸)及染料或顏料。糊劑及凝膠通常亦含有黏著劑(例如,阿拉伯膠、褐藻酸、膨潤土、纖維素、三仙膠、膠狀矽酸鋁鎂)以幫助保持組成物與口腔接觸且不易噴出。

假使驅蟲劑以飼料濃縮物的形式存在,則使用的載劑為例如性能飼料、飼料穀物或蛋白質濃縮物。此類飼料濃縮物或組成物除了活性成分外也可以含有添加劑、維生素、抗生素、化療藥物或其他的殺蟲劑,主要為抑菌劑、抑真菌劑、抑球蟲劑或者甚至是激素製劑、具有合成代謝作用的物質或促進生長的物質,該等物質影響屠宰動物的肉品或以另一種方式有益於有機體。假使將組成物或其中包含的式 1 活性成分直接添加到飼料或飲水槽,則配製的飼料或飲料所含的活性成分較佳是在以重量計大約 0.0005 到 0.02% (5 至 200 ppm)的濃度。

亦可使用例如傳統的栓劑基質(諸如,可可脂或其他甘油酯)將式 1 化合物調配於直腸組成物(諸如,栓劑或保留灌腸劑)中。

用於局部投予之配方通常呈散劑、乳膏、懸浮液、噴霧、乳液、泡沫、糊劑、氣霧劑、軟膏、油膏或凝膠之形式。局部配方更通常為水溶性溶液,其可呈在使用

之前稀釋之濃縮物形式。適於局部投予之殺寄生蟲組成物通常包含本發明之化合物及一或多種局部合適之載劑。在將殺寄生蟲組成物局部施加到動物的外表而呈一條線或一個點（即「點噴滴」治療）中，該活性成分在動物的表面上遷移，以覆蓋該動物之大部分或全部的外表面積。因此，用於局部定位投予之配方通常包含至少一種便於活性成分在皮上遷移及/或滲入動物表皮中之有機溶劑。該等配方中之載劑包括：丙二醇、二醇、石蠟、芳香族化合物、酯（諸如肉豆蔻酸異丙酯）、乙二醇醚、醇類（諸如乙醇、正丙醇、2-辛基十二醇或油醇）；單羧酸酯類中的溶液，如肉豆蔻酸異丙酯、棕櫚酸異丙酯、月桂酸草酸酯、油酸油酯、油酸癸酯、月桂酸己基酯、油基油酸酯、油酸癸酯、鏈長 C_{12}-C_{18} 之飽和脂肪醇的己酸酯；二羧酸酯溶液、諸如鄰苯二甲酸二丁酯、間苯二甲酸二異丙酯、己二酸二異丙酯、己二酸二正丁酯或脂族酸酯溶液，例如二醇。亦存在獲知於醫藥或美容界之結晶抑制劑或分散劑可為有利的。

澆潑或點噴滴方法包括施加殺寄生蟲的組成物到皮膚或表皮的特定位置，有利的是到動物的頸部或骨幹。這藉由應用棉花棒或噴灑澆潑或點噴滴配方到表皮的一個相對較小區域而發生，由於配方中的成分之擴散性質及藉由動物移動的協助，活性物質幾乎自動地從該區域被分散到大範圍的毛皮上。澆潑配方通常藉由在動物之背中線（背部）或肩膀上以一或數條線或以點噴滴來施用。配方更通常藉由沿動物背部、沿脊柱傾倒來施用。配方亦可藉由其他習知方法施用於動物，該等使用

方法包括將浸透之材料在動物之至少一較小區域上擦拭，或使用市售施用器、藉助於注射器、藉由噴霧或藉由使用噴霧管道（spray race）來將其施用。澆潑或點噴滴配方可適當地含有載劑，該載劑促進快速散佈於宿主動物的皮膚表面或表皮中，而且通常被視為散佈油。適當的載劑為例如油性溶液；酒精和異丙醇溶液如 2-辛基十二醇或油醇；於單羧酸酯中之溶液，諸如肉豆蔻酸異丙酯、棕櫚酸異丙酯、十二酸草酸酯、油酸油醇酯（oleic acid oleyl ester）、油酸癸酯（oleic acid decyl ester）、月桂酸己酯、油酸油酯（油基油酸酯）、油酸癸酯（decyl oleate）、鏈長 C_{12}-C_{18} 之飽和脂肪醇之癸酸酯；二羧酸酯溶液、諸如鄰苯二甲酸二丁酯、間苯二甲酸二異丙酯、己二酸二異丙酯、己二酸二正丁酯或是還有脂族酸酯溶液，例如二醇。額外地存在分散劑可以是有利的，如醫藥或化粧品工業中習知之一者。實例為 2-吡咯烷酮、2-(*N*-烷基)吡咯烷酮、丙酮、聚乙二醇及其醚類和酯類、丙二醇或合成的甘油三酯。

油性溶液包括例如植物油如橄欖油、花生油、芝麻油、松油、亞麻仁油或蓖麻油。植物油也可以以環氧化的形式存在。也可以使用烷烴和矽油。

澆潑或點噴滴配方通常含有以重量計 1 至 20%的式 1 化合物、以重量計 0.1 至 50%的分散劑以及以重量計 45 至 98.9%的溶劑。

澆潑或點噴滴方法用於畜牧動物尤其有利，諸如牛、馬、羊或豬，其中以口服或注射方式處理動物是困難或耗時的。由於其簡易性，此類方法當然也可以用於

其他所有動物，包括個別家畜或寵物，並深受動物的飼主喜愛，因為其往往可以在獸醫專家不存在下進行。

本發明之配方通常包括抗氧化劑，諸如 BHT（丁基化羥基甲苯）。抗氧化劑一般以 0.1-5%（重量/體積）之量存在。

該組成物也可以含有其他的添加劑，如穩定劑，例如適合的環氧化植物油（環氧化椰子油、菜籽油或黃豆油）；消泡劑例如矽油、防腐劑（例如對羥基苯甲酸甲酯和對羥基苯甲酸丙酯）、黏度調節劑、增稠劑（例如卡波姆、玉米澱粉、聚乙烯、聚乙烯吡咯烷酮、食用黏土或黃原膠組成）黏合劑和增黏劑或其它活性成分，以達到特殊效果。

對式 1 化合物為中性的並且對被處理的宿主動物沒有有害影響的其他生物活性物質或添加劑、以及礦物鹽或維生素也可加入所述的組成物。

作為一項規則，依據本發明的驅蟲劑組成物含有以重量計 0.1 至 99%（尤其是以重量計 0.1 至 95%）的式 1 活性成分、以重量計 99.9 至 1%（尤其是以重量計 99.8 至 5%）的固體或液體摻合物，該摻合物包括以重量計 0 至 25%（尤其是以重量計 0.1 至 25%）的界面活性劑。

儘管較佳的是將商業產品配製為濃縮物，但是最終使用者通常會使用稀釋的製劑。

在依據本發明的各個害蟲控制方法或依據本發明的各個害蟲控制組成物中，可以使用式 1 活性成分之全部立體構型或其混合物。

本發明還包括預防性保護溫血動物（特別是生產的牲畜、家畜和寵物）對抗寄生蠕蟲的方法，其特徵在於該式活性成分或由其製備的活性成分配方係作為飼料或飲料添加劑或處於固體或液體的形式、口服或注射或腸外地被投予給該動物。本發明亦包括依據本發明的式1化合物，以用於該方法中之一者。

在下面的實例中，所有的配方均以常規方式製備。化合物編號係指索引表A至C中的化合物。不需要進一步闡述，據信熟悉該項技藝之人士在使用前述描述後可以最大程度地利用本發明。因此，以下實例僅為說明之用，而絕非用於限制本發明之揭露內容。除非另有說明，百分比為按重量計。

實例A

顆粒	a)	b)
化合物2	5%	10%
高嶺土	94%	-
高度分散的矽酸	1%	-
厄帖浦石	-	90%

該活性成分溶於二氯甲烷中，噴灑到載劑上，而且溶劑後續藉由在真空下蒸發而濃縮。此類顆粒可以與動物飼料混合。

實例 B

無塵顆粒	
化合物 5	3%
聚乙二醇(分子量 200)	3%
高嶺土	94%

將細微研磨的活性成分均勻地在混合器中施加到高嶺土，該高嶺土已經被聚乙二醇濕潤。如此得到無塵塗佈細粒。

實例 C

錠劑或丸劑（Boli）	
1) 化合物 14	33.00%
1) 甲基纖維素	0.80%
1) 高度分散的矽酸	0.80%
1) 玉米澱粉	8.40%
2) 結晶乳糖	22.50%
2) 玉米澱粉	17.00%
2) 微晶纖維素	16.50%
2) 硬脂酸鎂	1.00%

1) 將甲基纖維素與水攪拌。在材料膨潤之後，將矽酸攪入並使該混合物均勻地懸浮。將該活性成分與玉米澱粉混合。將水懸浮液加工到該混合物中並捏成團。將產生的團經由 12 M 篩子製粒並乾燥。

2) 將全部 4 個賦形劑充分混合。

3) 將依據 1 和 2 得到的初步混合物混合並壓成錠劑或丸劑。

實例 D

可注射的：油性媒液（緩慢釋放）	
1) 化合物 15	0.1 – 1.0 g
1) 花生油	ad 100 mL
2) 化合物 17	0.1 – 1.0 g
2) 芝麻油	ad 100 mL

將活性成分溶於部分的油中並攪拌之，若需要的話使用溫和加熱，然後在對所需體積冷卻之後，並經由孔徑為 0.22 μm 的適當膜濾器無菌過濾。

「ad」意指足夠的此成分被加入其他成分的混合物中，以製成特定總體積（在此案例中為 100 mL）的配方。

實例 E

可注射的：水可混溶的溶劑（平均釋放速率）	
1) 化合物 2	0.1 – 1.0 g
1) 4-羥甲基-1,3-二氧雜環戊烷（丙三醇縮甲醛（glycerol formal））	40 g
1) 1,2-丙二醇	ad 100 mL
2) 化合物 5	0.1 – 1.0 g
2) 甘油二甲基縮酮	40 g
2) 1,2-丙二醇	ad 100 mL

將活性成分溶於部分的溶劑中並攪拌之、製成所需體積並經由孔徑為 0.22 μm 的適當膜濾器無菌過濾。

實例 F

可注射的：含水溶質（快速釋放）	
1) 化合物 14	0.1 – 1.0 g
1) 聚乙氧化蓖麻油（40 個環氧乙烷單元）	10 g
1) 1,2-丙二醇	20 g
1) 苄基醇	1 g
1) 注射用水	ad 100 mL
2) 化合物 15	0.1 – 1.0 g
2) 聚乙氧化單油酸山梨醇酐（20 個環氧乙烷單元）	8 g
2) 4-羥甲基-1,3-二氧雜環戊烷(丙三醇縮甲醛)	20 g
2) 苄基醇	1 g
2) 注射用水	ad 100 mL

活性成分溶於溶劑與界面活性劑中並以水製成所需體積。然後將溶液經由孔徑為 0.22 μm 的適當膜濾器無菌過濾。

實例 G

澆潑	
1) 化合物 17	5 g
1) 肉豆蔻酸異丙酯	10 g
1) 異丙醇	ad 100 mL
2) 化合物 2	2 g
2) 月桂酸己基酯	5 g
2) 中鏈三酸甘油酯	15 g
2) 乙醇	ad 100 mL

澆潑	
3) 化合物 5	2 g
3) 油酸油基酯	5 g
3) *N*-甲基-吡咯啶酮	40 g
3) 異丙醇	ad 100 mL

亦可較佳地將含水的系統用於口服及/或瘤胃內應用。

一般對於獸醫學用途而言，向動物投予殺寄生蟲有效量之式 1 化合物、*N*-氧化物或其鹽類以使其免遭蠕蟲寄生害蟲侵害。殺寄生蟲有效量是達到減少目標蠕蟲寄生蟲害蟲出現或活動的顯著效果所需的活性成分量。熟悉該項技藝之人士可察知殺寄生蟲有效劑量、其投藥模式與頻率會因本發明之不同化合物與組成物、理想的殺寄生蟲作用與持續時間、目標蠕蟲動物害蟲種類、欲保護的動物、使用模式與相似者而變化，以及可經由簡單的實驗確認達到特定結果所需的量。

對於向恆溫動物投予而言，本發明化合物之劑量通常在每公斤動物體重約 0.01 mg 至約 100 mg 之範圍內，更通常在每公斤動物體重約 0.5 mg 至約 100 mg 之範圍內。對於局部（例如，經皮）投予而言，浸液及噴霧通常含有約 0.5 ppm 至約 5000 ppm、更通常約 1 ppm 至約 3000 ppm 之本發明化合物。

本發明化合物對線蟲綱（蛔蟲）、吸蟲綱（吸蟲）、棘頭動物及條蟲綱（條蟲）等成員具有活性。重要的蠕蟲是那些造成哺乳動物和家禽（如羊、豬、山羊、牛、

馬、驢、狗、貓、豚鼠和鳥類）患得嚴重疾病者。本指示之典型線蟲為：捻轉胃蟲（Haemonchus）、毛樣線蟲（Trichostrongylus）、皺胃寄生蟲（Teladorsagia）、犬心絲蟲（Dirofilaria）、奧斯特線蟲（Ostertagia）、細頸線蟲（Nematodirus）、古柏線蟲（Cooperia）、蛔蟲（Ascaris）、鉤蟲（Bunostonum）、豬腸結節蟲（Oesophagostonum）、夏伯脫線蟲（Charbertia）、鞭形線蟲（Trichuris）、圓線蟲（Strongylus）、樣線蟲（Trichonema）、網尾線蟲（Dictyocaulus）、毛細線蟲（Capillaria）、盲腸蟲（Heterakis）、弓首線蟲（Toxocara）、蛔蟲（Ascaridia）、尖尾線蟲（Oxyuris）、鉤口線蟲（Ancylostoma）、狹頭鉤蟲（Uncinaria）、弓蛔線蟲（Toxascaris）以及馬蛔蟲（Parascaris）。吸蟲包括薑片蟲(Fasciolideae)族，特別是牛羊肝吸蟲(Fasciola hepatica)。某些害蟲的種類細頸線蟲、古柏線蟲及豬腸結節蟲侵染宿主動物的腸道，而其他種類的捻轉胃蟲、奧斯特線蟲寄生在胃中，以及種類網尾線蟲那些是寄生在肺組織中。可以在內部細胞組織和器官（例如心臟、血管、淋巴管和皮下組織）中發現絲蟲（Filariidae 和 Setariidae）族寄生蟲。一種顯著的寄生蟲是狗的心絲蟲，犬心絲蟲。重要的條蟲綱（條蟲）害蟲包括條蟲（Mesocestoidae）科，尤其是條蟲（Mesocestoides）屬，特別是有線條蟲（M. lineatus）；複孔屬(Dilepidide)，尤其是犬條蟲（Dipylidium caninum）、約優克斯條蟲屬(Joyeuxiella spp)，特別是喬伊條蟲(Joyeuxiella pasquali)及雙孔屬(Diplopylidium spp.)，以及帶科（Taeniidae），

尤其是豆狀條蟲（Taenia pisiformis）、獐條蟲（Taenia cervi）、羊條蟲（Taenia ovis）、胞狀條蟲（Taneia hydatigena）、多頭條蟲（Taenia multiceps）、貓條蟲（Taenia taeniaeformis）、無鉤條蟲（Taenia serialis）及包條蟲（Echinocuccus spp.），最佳為胞狀條蟲、羊條蟲、多頭條蟲、無鉤條蟲；顆粒性包生條蟲（Echinocuccus granulosus）與多房性包生條蟲（Echinococcus multilocularis），以及多頭條蟲（Multiceps multiceps）。另一個值得注意的寄生蟲是在馬身上的葉狀裸頭條蟲（Anoplocephala perfoliata）。

本發明之化合物可適用於人類致病寄生蟲的控制。其中，出現在消化道的典型代表為鉤口線蟲、鉤蟲（Necator）、蛔蟲、糞桿線蟲（Strongyloides）、旋毛蟲（Trichinella）、毛細線蟲、鞭形線蟲及蟯蟲（Enterobius）等物種。本發明之化合物對抗來自絲蟲族科的吳策線蟲（Wuchereria）、布魯格氏絲蟲（Brugia）、旋盤尾絲蟲（Onchocerca）及羅阿絲蟲（Loa）等寄生蟲物種也是有效的，該等蟲出現在血液中、在組織中及在各種器官中，而且對抗龍線蟲（Dracunculus）及糞桿線蟲和旋毛蟲物種的寄生蟲也是有效的，該等蟲特別是會感染胃腸道。

許多其他蠕蟲屬及種為該領域中所已知，且亦預期其可由本發明之化合物治療。這些係非常詳細列舉於Textbook of Veterinary Clinical Parasitology 第 1 冊, Helminths, E. J. L. Soulsby, F. A. Davis Co., Philadelphia, Pa.；Helminths, Arthropods 與 Protozoa（Monnig's

Veterinary Helminthology and Entomology 第 6 版)E. J. L. Soulsby, The Williams and Wilkins Co., Baltimore, Md。

本發明之化合物及組成物適於對抗侵染動物對象之寄生蟲，該等動物對象包括野生動物、家畜及農業勞動動物中之彼等動物對象，諸如牛、綿羊、山羊、馬、豬、驢、駱駝、野牛、水牛、兔、母雞、火雞、鴨及鵝（例如，出於肉、乳、乳酪、蛋、毛皮、皮革、羽毛及/或羊毛之目的而飼養）。藉由對抗寄生蟲，減少了死亡和性能降低（就肉、奶、毛、皮、蛋等方面而言），使得施加含有本發明之化合物的組成物允許更經濟和更簡單地飼養動物。

本發明之化合物與組成物尤其適合對抗侵擾動物伴侶及寵物（如狗、貓、及寵物鳥）、研究及實驗用動物（如倉鼠、天竺鼠、大鼠、小鼠），以及在動物園內、野生動物棲息地及/或馬戲團內飼養的動物之寄生蟲。

此發明之一實施例中，動物較佳的是脊椎動物，更佳的是哺乳動物或鳥類。在一特定實施例中，動物對象為哺乳動物（包括類人猿，諸如人類)。其他哺乳動物對象包括靈長類動物（例如，猴）、牛科動物（例如，畜牛或奶牛）、豬科動物（例如，家豬或豬）、綿羊科動物（例如，山羊或綿羊）、馬科動物（例如，馬）、犬科動物（例如，狗）、貓科動物（例如，家貓）、駱駝、鹿、驢、野牛、水牛、羚羊、兔及齧齒動物（例如，豚鼠、松鼠、大鼠、小鼠、沙鼠及倉鼠)。鳥類包括鴨科（Anatidae）（天鵝、鴨及鵝）、鳩鴿科（Columbidae）（例如，斑鳩及鴿子）、雉科（Phasianidae）（例如，鷓

鴿、松雞及火雞）、Thesienidae（例如，家雞）、鸚鵡科（例如，長尾鸚鵡、金剛鸚鵡及鸚鵡）、獵禽及平胸類鳥（例如，鴕鳥）。

經本發明化合物治療或保護之鳥可與商業或非商業鳥類飼養有關。此等鳥尤其包括鴨科（諸如，天鵝、鴨及鵝）、鳩鴿科（諸如，斑鳩及鴿子）、雉科（諸如，鷓鴣、松雞及火雞）、Thesienidae（諸如，家雞）、及鸚鵡科（諸如，長尾鸚鵡、金剛鸚鵡及經飼養用於寵物或收藏家市場之鸚鵡）

由於上述細節的結果，本發明進一步重要的態樣係關於控制溫血動物上的寄生蟲之複合製劑，其特徵在於該等製劑除了式 1 化合物之外還含有至少一另外的活性成分及至少一生理上可接受的載劑，該活性成分具有相同的或不同的活性領域。本發明並不限於 2 倍的組合。

依據本發明的式 1 化合物可被單獨使用或與其他的生物滅除劑結合使用。彼等可與具有相同活性領域的殺蟲劑結合，例如為了增加活性，或與具有另一種活性領域的物質結合，例如為了增大活性範圍。假使配方係施加於外部，則添加所謂的驅蟲劑也可以是合理的。彼等也可以與抗菌組成物結合使用。將攻擊少年期寄生蟲的化合物添加到功能主要是作為殺成蟲劑者可以是非常有利的。依此類方式，將可掩護產生巨大經濟損失的那些寄生蟲之最大範圍。此外，此動作將大大地有助於避免形成阻抗。許多組合也導致協同效應，即可以減少活性成分的總量，從生態學的觀點來看這是可取的。較

佳的組合夥伴及尤其較佳的組合夥伴基團例舉於下，藉此該等組合除了式 1 化合物之外還可含有一或多個這些夥伴。

值得注意的是另外的、選自本領域習知的驅蟲劑之生物活性化合物或藥劑，例如巨環內酯，包括但不限於阿佛菌素（avermectins）及其衍生物（例如伊維菌素（ivermectin）、莫西菌素（moxidectin）、米爾貝黴素（milbemycin））、苯並咪唑類（例如阿苯達唑（albendazole）、三氯苯達唑（triclabendazole）、坎苯達唑（cambendazole）、芬苯達唑（fenbendazole）、氟苯達唑（flubendazole）、甲苯達唑（mebendazole）、奧芬達唑（oxfendazole）、奧苯噠唑（oxibendazole）、帕苯達唑（parbendazole））、水楊醯苯胺（salicylanilides）（例如氯氰碘柳胺（closantel）、氯羥柳胺（oxyclozanide））、經取代的酚（例如硝碘酚腈（nitroxynil））、四氫嘧啶（tetrahydropyrimidines）（例如雙羥萘酸噻吩嘧啶（pyrantel pamoate）、奧克太爾（oxantel）、莫倫太（morantel））、咪唑並噻唑（imidazothiazoles）（例如左旋咪唑（levamisole）、四嘧唑（tetramizole））及吡喹酮（praziquantel）。另外的本領域習知之驅蟲劑包括對郝青醯胺（paraherquamide）/馬可氟汀（marcfortine）類之類似物及衍生物、硝硫氰酯（nitroscanate）及環酯肽（cyclic depsipeptides），例如艾默德斯（emodepside）。

值得特別注意的是選自上述阿佛菌素化合物之抗寄生物劑類別的適用於本發明組成物之生物活性化合物或藥劑。阿佛菌素（avermectin）化合物家族是一系

列非常有效力的抗寄生蟲劑，已知可用於對抗哺乳類動物身上各類的內寄生蟲與外寄生蟲。在此類別中用於本發明之範疇內的重要化合物為伊維菌素。伊維菌素（ivermectin）是一種阿巴汀（avermectin）的半合成衍生物，一般是由至少 80%的 22,23-二氫阿佛菌素（dihydroavermectin）B_{1a}以及少於 20%的 22,23-二氫阿佛菌素（dihydroavermectin）B_{1b}製造而成。

其他值得注意的阿佛菌素為阿維菌素（abamectin）、多拉菌素（doramectin）、地馬菌素（dimadectin）、拉替菌素（latidectin）、雷皮菌素（lepimectin）、色拉菌素（selamectin）、倍脈心（milbemycin）及其衍生物包括但不限於密滅汀（milbemectin）、莫西菌素（moxidectin）、奈馬克丁（nemadectin）及殺蹣菌素（milbemycin）D、因滅汀（emamectin）及依普菌素（eprinomectin）。依普菌素（Eprinomectin）化學名稱為 4"-表-乙醯胺基-4"-去氧-阿佛菌素（avermectin）B_1。依普菌素係特定研發用於所有牛類及年齡群。其為第一種顯示出對抗體內寄生蟲及體外寄生蟲之廣譜活性同時亦在肉及乳中留下最少殘餘物的阿佛菌素。其具有在局部傳遞時高度有效之額外益處。

亦值得注意的為小節芽孢酸（nodulisporic acid）及其衍生物，係本領域中習知的一類強效內和異位抗寄生蟲劑化合物。三種天然產生的小節芽孢酸之分離與純化係揭露於美國專利第 5,399,582 號。該等化合物之衍生物係描述於 WO 96/29073 與美國專利第 5,945,317、

5,962,499、5,834,260、6,399,796、6,221,894、6,136,838、5,595,991、5,299,582 及 5,614,546 號。

本發明之組成物選擇性地包含一或多種以下抗寄生蟲化合物之組合：咪唑并[1,2-b]嗒【口+井】(imidazo[1,2-b]pyridazine)化合物，如藉由 2004 年 12 月 22 日申請之美國申請案第 11/019,597 號，於 2004 年 12 月 22 日提出申請並於 2005 年 8 月 18 日公開為 U.S. 2005-0182059A1；三氟甲磺醯胺苯肟醚衍生物，如 2005 年 9 月 21 日提出申請的美國專利申請序號第 11/231,423 號所述，現為美國專利 7,312,248；以及 *N*-[(苯氧基)苯基]-1,1,1-三氟甲磺醯胺和 *N*-[(苯基硫基)苯基]-1,1,1-三氟甲磺醯胺衍生物，如 2005 年 6 月 9 日提出申請的美國臨時專利申請序號第 60/688,898 號所述，並於 2006 年 12 月 14 日公開為 US 2006-0281695A1。

本發明之組成物亦可進一步包含殺吸蟲劑(flukicide)。合適之殺吸蟲劑包括（例如）三氯苯達唑（triclabendazole）、芬苯達唑（fenbendazole）、阿苯達唑（albendazole）、氯舒隆（clorsulon）及奧苯達唑（oxibendazole）。應瞭解上述組合可進一步包括抗生素、抗寄生蟲及抗吸蟲活性化合物之組合。

除上述組合之外，亦預期提供如本文所述之本發明方法及化合物與諸如微量元素、消炎藥、抗感染藥、激素、皮膚病學製劑（包括殺菌劑及消毒劑）及免疫生物製劑（諸如，疫苗及抗血清）之其他動物健康藥物的組合，以預防疾病。

舉例而言，該等抗感染劑包括一或多種抗生素，其選擇性地在使用本發明化合物或方法在治療期間共投予（例如，以組合之組成物及/或以分開劑型）。適於此目的之技術已知之抗生素包括（例如）下文所列之彼等抗生素。

可用的抗生素為氯黴素類似物如氟苯尼考（florfenicol），亦習知為 D-(蘇型)-1-(4-甲基磺醯基苯基)-2-二氯乙醯胺基-3-氟-1-丙醇。其他值得注意的氯黴素類似物包括甲磺氯黴素（thiamphenicol）及 D-(蘇型)-1-(4-甲基磺醯基苯基)-2-二氟乙醯胺基-3-氟-1-丙醇。其他的氟苯尼考類似物及/或前藥已經被揭露而且這樣的類似物也可以被用於本發明之組成物與方法中（例如美國專利申請案公開號第 2004/0082553 號，現為美國專利第 7,041,670 號；美國專利申請案序號第 11/016,794 號，現為美國專利第 7,153,842 號；以及美國專利申請案序號第 11/018,156 號，於 2004 年 12 月 21 日提出申請，現為美國專利第 7,361,689 號）。

其他可用於本發明的可用抗生素為巨環內酯抗生素，如替米考星（tilmicosin）與土拉霉素（tulathromycin）。

其他適用的巨環內酯抗生素包括酮內醋（ketolide）類化合物，或更特定言之，氮雜內醋（azalide）類化合物。所描述的混合物於例如 U.S. 6,514,945、U.S. 6,472,371、U.S. 6,270,768、U.S. 6,437,151、U.S. 6,271,255、U.S. 6,239,112、U.S. 5,958,888、U.S. 6,339,063 與 U.S. 6,054,434 中描述。

其他的抗生素可包括 β-內醯胺如頭孢菌素（cephalosporins），例如賽得福（ceftiofur）、頭孢喹肟（cefquinome）等，以及青黴素，例如盤尼西林、氨苄青黴素（ampicillin）、阿莫西林（amoxicillin）或阿莫西林與克拉維酸（clavulanic acid）或其他 β 內醯胺酶抑制劑之組合。

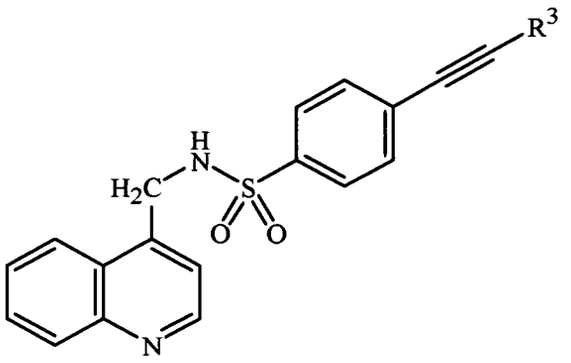
其他可用之抗生素類別包括氟喹諾酮類（fluoroquinolones），例如舉例來說有恩氟奎琳羧酸（enrofloxacin）、大安氟奎琳羧酸（danofloxacin）、二氟沙星（difloxacin）、奧比沙星（orbifloxacin）、馬波沙星（marbofloxacin）。

其他適用的抗生素包括四環素，尤其是氯四環素及氧四環素。

由本文中所述方法製備的本發明代表性化合物顯示於索引表 A 至 D，^{1}H NMR 數據見索引表 E。關於質譜儀數據（AP^+ (M+1)），所述之數值為為藉由加入 H^+（分子量為 1）至分子中以產生藉由使用大氣壓力化學離子化（AP^+）以質譜儀觀察之 M+1 峰所形成之母分子離子分子量（M）。未報導在含有多個鹵素之化合物的情況下出現之替代分子離子峰（例如 M+2 或 M+4）。經報導之 M+1 峰係藉由質譜測定術利用大氣壓力化學離子化法（AP^+）或電噴灑離子化（electrospray ionization，ESI）觀察而得。

以下縮寫用於索引表中，如下：Cmpd 意指化合物且 CF_3 意指三氟甲基。

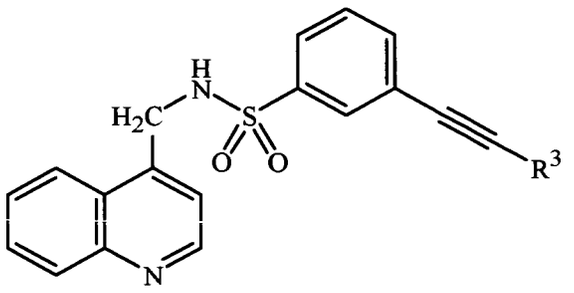
索引表 A



Cmpd	R^3	AP+ (M+1)	m.p. (℃)
1	環己基	405	151-153
2	環丙基	363	157-159
3	環戊基	391	185-187
4	2-吡啶基	400	138-142
5	異丙基	365	146-149
6	5-Cl-2-噻吩基		161-163
7	噻吩基		157-160
8	三級丁基	377	143-146
9	3-Cl-5-(CF_3)-2-吡啶基		196-198
10	5-(CF_3)-2-吡啶基		182-185
11	CH_2(環己基)	419	130-132
12	H		154-157
13	二級丁基	**	158-161
21	乙基	**	142-144
22	CH_2(環戊基)	**	119-121
23	異丁基	377	150-152
24	甲基	337	164-166
28	$Si(CH_3)_3$		150-153

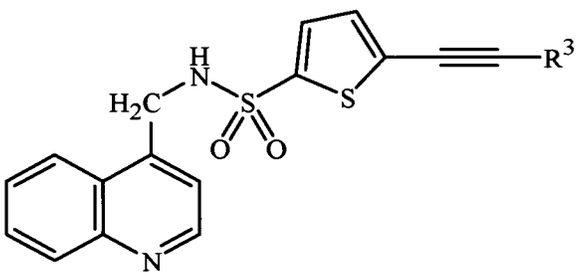
** ^{1}H NMR 數據見索引表 E。

索引表 B



Cmpd	R^3	AP+ (M+1)	m.p. (℃)
16	異丙基	365	
18	環丙基	363	
19	環己基	405	106-108
20	環戊基	391	137-138

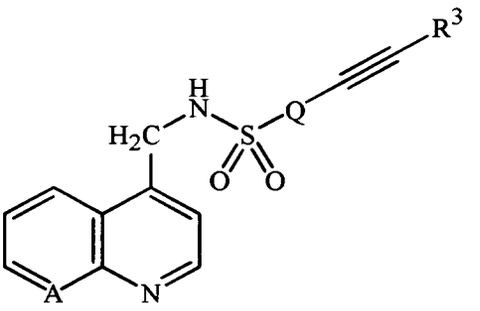
索引表 C

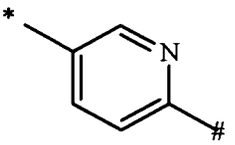
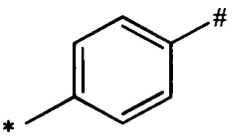
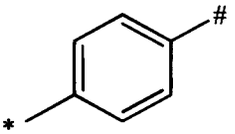
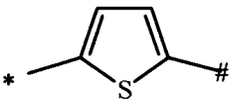
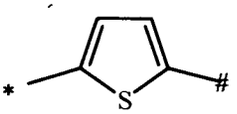
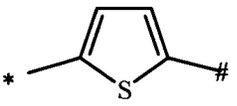


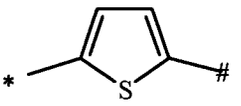
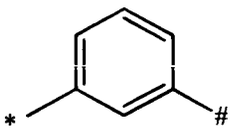
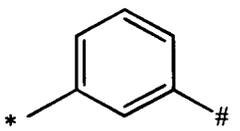
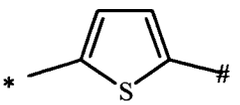
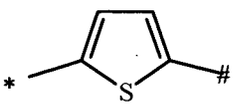
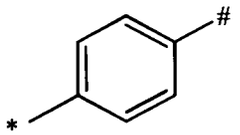
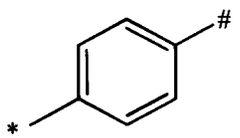
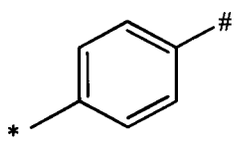
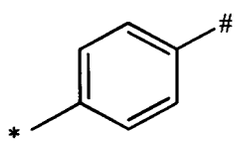
Cmpd	R^3	AP+ (M+1)	m.p. (℃)
14	環戊基	397	
15	環丙基	369	
17	異丙基	371	
29	$Si(CH_3)_3$		125-127
30	環己基		81-84
31	二級丁基		98-99
32	三級丁基		80-83
33	2-吡啶基		164-166

Cmpd	R^3	AP+ (M+1)	m.p. (℃)
36	CH_2(環戊基)		98-100
39	CH_2(環己基)		75-77
40	CH_2CH_3	357	
41	CH_3		139-141

索引表 D



Cmpd	Q	R^3	A	AP+ (M+1)	m.p. (℃)
25		環丙基	CH		166-168
26		異丙基	CF	383	
27		環丙基	CF		58-60
34		環丙基	CF		68-70
35		環戊基	CF		68-70
37		環己基	CF		87-89

Cmpd	Q	R^3	A	AP+ (M+1)	m.p. (℃)
38		異丙基	CF		123-126
42		異丙基	CF		88-90
43		環丙基	CF		82-84
44		異丙基	N		190-192
45		環丙基	N		172-174
46		異丙基	N		195-197
47		環己基	N		173-175
48		環丙基	N		193-195
49		環戊基	N		165-167

* 為 Q 基團與式 1 中的磺醯基(SO_2)之連接點。

\# 為 Q 基團與式 1 中的乙炔基團之連接點。

索引表 E

Cmpd 編號	^{1}H NMR 數據 [a]
13	δ ($CDCl_3$) 1.06 (t, 3H), 1.28 (m, 3H), 1.58 (m, 2H), 2.78 (m, 1H), 4.6 (d, 2H), 4.96 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.5 (d, 2H), 7.58 (d, 1H), 7.73 (t, 1H), 7.8 (d, 2H), 7.92 (d, 1H), 8.12 (d, 1H), 8.82 (1H, d)。
21	δ ($CDCl_3$) 1.24 (m, 3H), 2.46 (m, 2H), 4.62 (d, 2H), 4.85 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.5 (d, 2H), 7.58 (t, 1H), 7.74 (t, 1H), 7.8 (d, 2H), 7.89 (d, 1H), 8.12 (d, 1H), 8.82 (d, 1H)。
22	δ ($CDCl_3$) 1.38 (m, 2H), 1.6 (m, 2H), 1.7 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.15 (m, 1H), 2.45 (d, 2H), 4.6 (d, 2H), 4.96 (t, 1H), 7.3 (m, 1H), 7.5 (d, 2H), 7.56 (t, 1H), 7.73 (t, 1H), 7.8 (d, 2H), 7.89 (d, 1H), 8.12 (d, 1H), 8.82 (m, 1H)。

[a] ^{1}H NMR 數據為來自四甲基矽烷，以 ppm 低磁場表示。除非另有指出，否則為 $CDCl_3$ 溶液。DMSO-d_6 為 $CD_3S(O)CD_3$。偶合係以(s)-單峰、(d)-二重峰、(t)-三重峰、(m)-多重峰、(dd)-雙二重峰、(br s)-寬單峰標明。

下列試驗闡明本發明化合物對特定寄生害蟲之控制效力。而，該化合物提供之害蟲控制保護不限於這些物種。化合物編號則參照索引表 A–D 中的化合物。

本發明生物實例

試驗 A

為了評估撚轉胃蟲(Haemonchus contortus)的控制，將試驗化合物溶解在培養基（厄爾平衡鹽緩沖液）中，其中含有撚轉胃蟲蟲卵，以獲得最終的測試化合物濃度為 2.0 ppm。測試單元評估 120 小時後的死亡率，之後蟲卵孵出，並已經前進到 L3 階段。

以下的測試化合物導致100%的死亡率：1、2、3、4、5、6、7、8、13、15、16、17、18及20。

試驗 B

為了評估撚轉胃蟲(Haemonchus contortus)的控制，在第3天讓每隻小鼠口服600 L3撚轉胃蟲幼蟲而感染。在第0天，以每公斤體重10.0 mg的速率強飼感染的小鼠溶於丙二醇/甘油形式溶液的測試化合物(n=1)。在第5天，讓小鼠安樂死，並評估相對於媒液劑量控制的撚轉胃蟲之負擔。在各種研究這些化合物的試驗中用於撚轉胃蟲的編號工具範圍是92至184。

化合物編號	功效%
1	12
2	60
3	90
4	89
5	90
6	36
7	60
8	48
13	56
14	8
15	93

測試 C

為了評估撚轉胃蟲(Haemonchus contortus)的控制，在第36天讓每隻重量約35 Kg的小羊口服10,000撚轉胃蟲L3幼蟲而感染。在第1天進行糞蛋計數以確

定蠕蟲負擔。在第 0 天，以每公斤體重 5.0 mg 的速率強飼感染的小羊溶於丙二醇/甘油形式溶液的測試化合物(n=1)。在第 8 天，讓小羊安樂死，並評估相對於媒液劑量控制的撚轉胃蟲之負擔。以下的測試化合物導致≥75%的成蟲減少：2、3、4 及 5。

【圖式簡單說明】

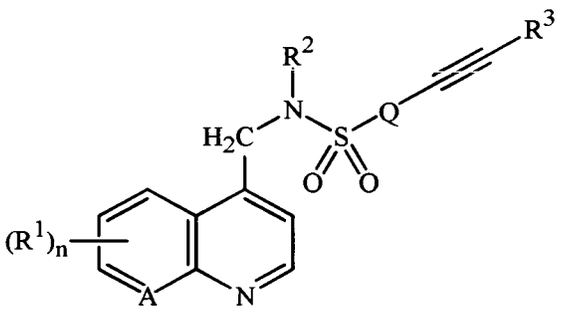
無

【主要元件符號說明】

無

七、申請專利範圍：

1. 一種式 1 化合物、一 *N*-氧化物或其鹽，



1

其中

Q 為苯基或萘基，各選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{4a} 的取代基取代；或

Q 為一 5 至 6 員雜芳環或一 8 至 11 員雜芳雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多 4 個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 及至多 4 個 N 原子，並且該環或環系選擇性地經至多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{4a} 及氮原子環員上的 R^{4b} 的取代基取代；

A 為 N、CH 或 CR^1；

各 R^1 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之

群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^2 為氫、氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

R^3 為氫、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$、$S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 或 $Si(R^{13})_3$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 G，

G為一5至6員芳族雜環、一3至7員非芳族雜環或一8至11員芳族或非芳族雜環雙環系，各環或環系含有選自碳原子及至多4個雜原子的環員，該雜原子係獨立選自至多2個O、至多2個S及至多4個N原子，並且該環或環系選擇性地經至多5個獨立選自碳原子環員上的R^{5a}及氮原子環員上的R^{5b}的取代基取代；

各R^{4a}係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、OR^6及$S(O)_pR^{12}$所組成之群組的取代基取代；

R^{4b}為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$或$S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$及$S(O)_2NR^{10}R^{11}$所組成之群組的取代基取代；或C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、

C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^{5b} 為氰基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 或 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6 及 $S(O)_pR^{12}$ 所組成之群組的取代基取代；

各 R^6 係獨立為氫、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基或 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯

基；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6 烷氧基、C_1–C_6 烷基胺基、C_2–C_8 二烷基胺基、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基及 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、C_1–C_4 烷氧基、C_1–C_4 烷基硫基、C_1–C_4 烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各 R^{7a} 係獨立為氫、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基或 C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基或 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基；或 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基、C_2–C_6 炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6 烷氧基、C_1–C_6 烷基胺基、C_2–C_8 二烷基胺基、C_2–C_6 烷羰基、C_2–C_6 烷氧羰基、C_2–C_6 烷基胺基羰基、C_3–C_6 二烷基胺基羰基、C_1–C_6 烷基硫基、C_1–C_6 烷基亞磺醯基、C_1–C_6 烷基磺醯基、C_2–C_6 烷基胺基磺醯基及 C_3–C_6 二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨

立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基亞磺醯基及C_1–C_4烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各R^{7b}係獨立為氫；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_6烷氧基、C_1–C_6烷基胺基、C_2–C_8二烷基胺基、C_2–C_6烷羰基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_3–C_6二烷基胺基羰基、C_1–C_6烷基硫基、C_1–C_6烷基亞磺醯基、C_1–C_6烷基磺醯基、C_2–C_6烷基胺基磺醯基及C_3–C_6二烷基胺基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

R^8、R^9、R^{10}及R^{12}各獨立為氫；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基、苯基、苄基、C_3–C_7環烷基、C_4–C_8環烷烷基或C_5–C_7環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4鹵烷氧基、C_2–C_6烷氧羰基、C_2–C_6烷基胺基羰基、C_2–C_8二烷基胺基羰基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基亞磺醯基、C_1–C_4烷基磺醯基、C_1–C_4鹵烷基硫基、C_1–C_4鹵烷基亞磺醯基及C_1–C_4鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

各R^{11}係獨立為氫；或C_1–C_6烷基、C_2–C_6烯基、C_2–C_6炔基或苄基、各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4烷基、C_1–C_4鹵烷基、C_1–C_4烷氧基、C_1–C_4鹵烷氧基、C_1–C_4烷基硫基、C_1–C_4烷基

亞磺醯基、C_1–C_4 烷基磺醯基、C_1–C_4 鹵烷基硫基、C_1–C_4 鹵烷基亞磺醯基及 C_1–C_4 鹵烷基磺醯基所組成之群組的取代基取代；

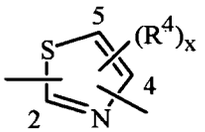
各 R^{13} 係獨立為 C_1–C_6 烷基或苯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、C_1–C_4 烷基及 C_1–C_4 鹵烷基所組成之群組的取代基取代；

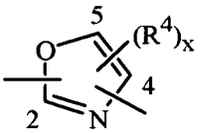
n 為 0、1、2、3、4 或 5；以及

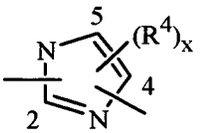
p 係 0、1 或 2。

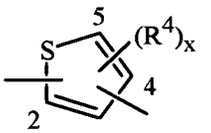
2. 如請求項 1 所述之化合物，其中

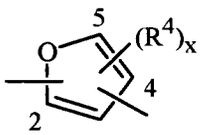
Q 為一選自於由

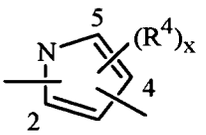

Q-1

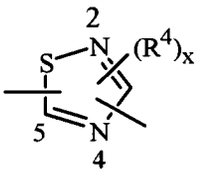

Q-2

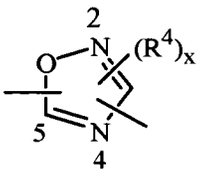

Q-3

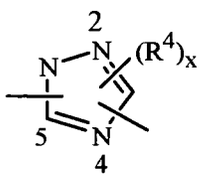

Q-4

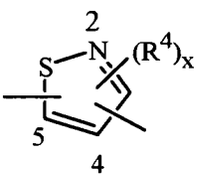

Q-5

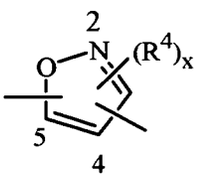

Q-6

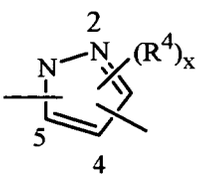

Q-7

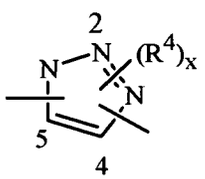

Q-8

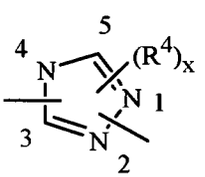

Q-9

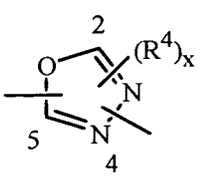

Q-10

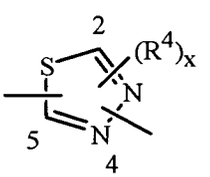

Q-11

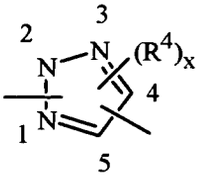

Q-12

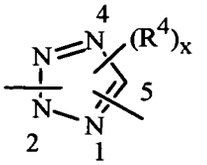


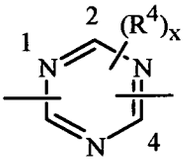


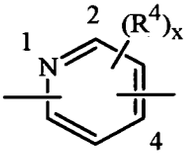


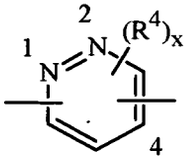


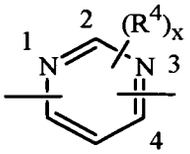
Q-13 

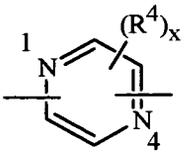
Q-14 

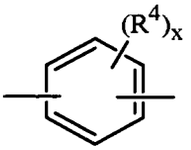
Q-15 

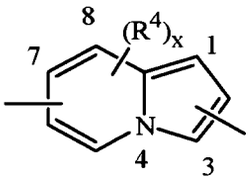
Q-16 

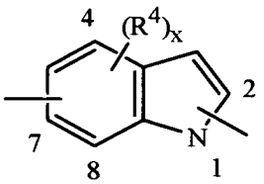
Q-17 

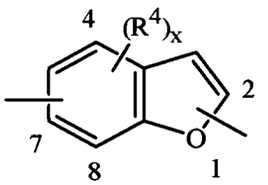
Q-18 

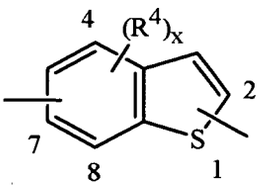
Q-19 

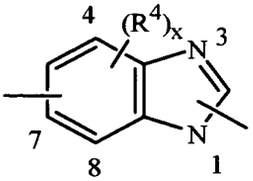
Q-20 

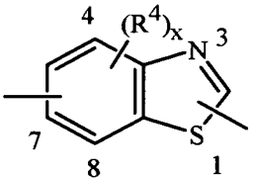
Q-21 

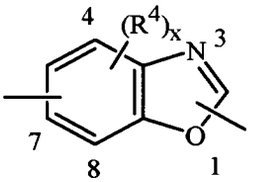
Q-22 

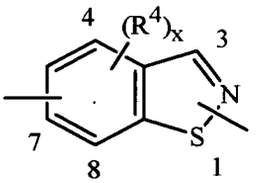
Q-23 

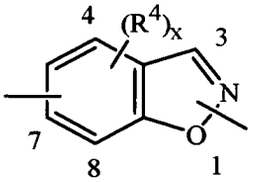
Q-24 

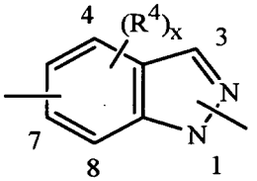
Q-25 

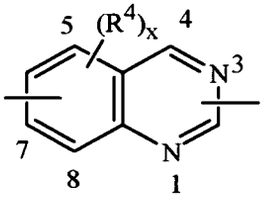
Q-26 

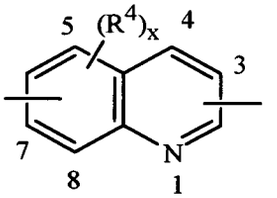
Q-27 

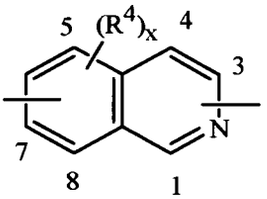
Q-28 

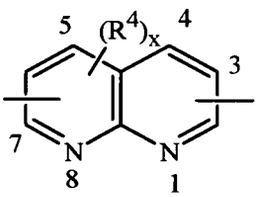
Q-29 

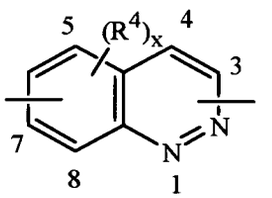
Q-30 

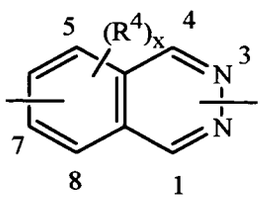
Q-31 

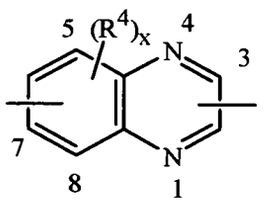
Q-32 

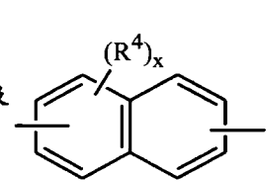
Q-33 

Q-34 

Q-35 

Q-36 

Q-37 

Q-38 

Q-39

Q-40

Q-41

以及

Q-42

所組成之群組的環，其中一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳與式 1 之 SO_2 連接，且另一個浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳與式 1 之 C≡C 連接；當 R^4 與碳環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4a}，且當 R^4 與氮環員連接時，該 R^4 係選自 R^{4b}；及 x 為一 0 至 5 之整數；

A 為 CH 或 CR^1；

各 R^1 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_3 烷基或 C_1–C_3 鹵烷基；

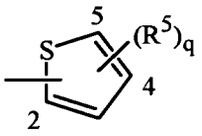
各 R^{4a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基；

R^{4b} 係甲基；

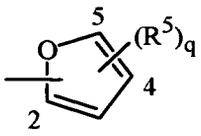
n 為 0、1 或 2；

R^3 為 C_1–C_6 烷基、C_2–C_6 烯基或 C_2–C_6 炔基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 C_3–C_7 環烷基、C_4–C_8 環烷烷基或 C_5–C_7 環烯基，各選擇性地經獨立選自於由鹵素、氰基、硝基、C_1–C_4 烷基、C_1–C_4 鹵烷基、OR^6、$NR^{7a}R^{7b}$、$C(O)R^8$、$C(O)OR^9$、$C(O)NR^{10}R^{11}$、$S(O)_pR^{12}$ 及 $S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 所組成之群組的取代基取代；或 G；

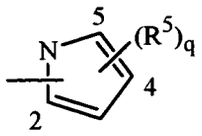
G 為一選自於由



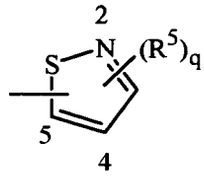
G-1



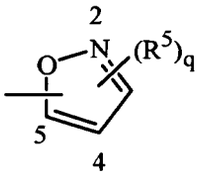
G-2



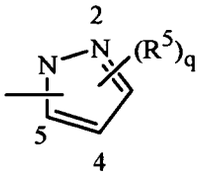
G-3



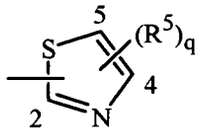
G-4



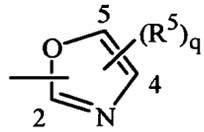
G-5



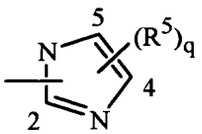
G-6



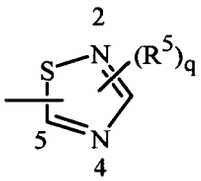
G-7



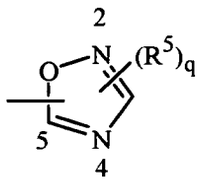
G-8



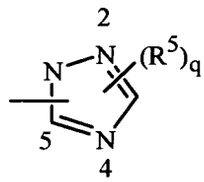
G-9



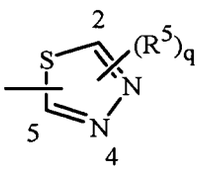
G-10



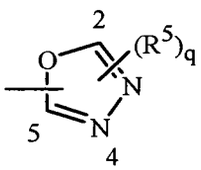
G-11



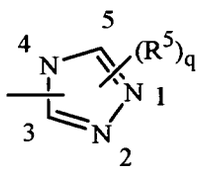
G-12



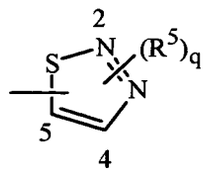
G-13



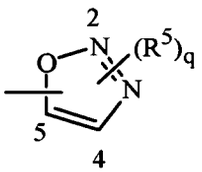
G-14



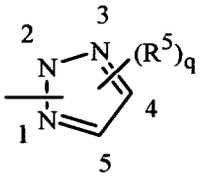
G-15



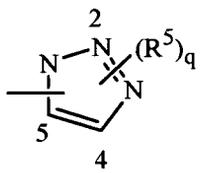
G-16



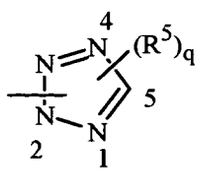
G-17



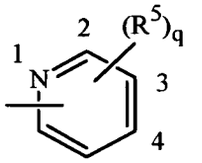
G-18



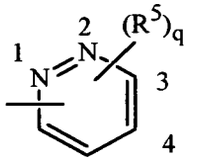
G-19



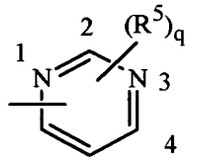
G-20



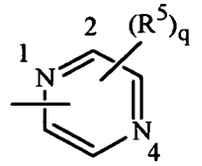
G-21



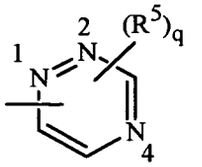
G-22



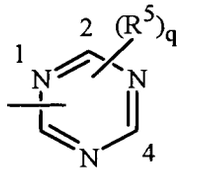
G-23



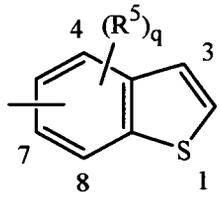
G-24



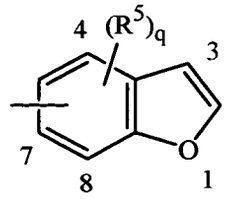
G-25



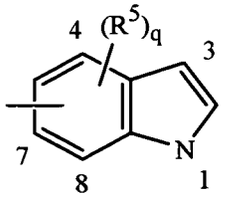
G-26



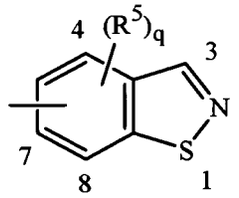
G-27



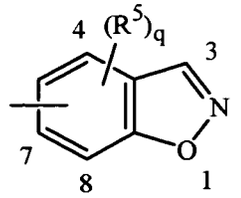
G-28



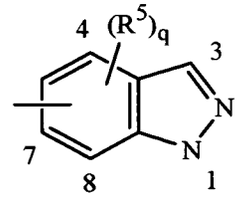
G-29



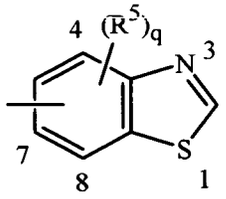
G-30



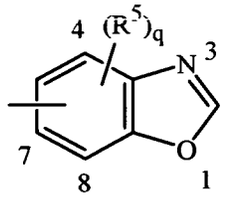
G-31



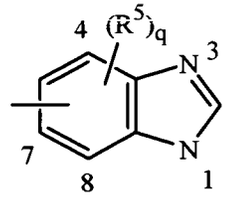
G-32



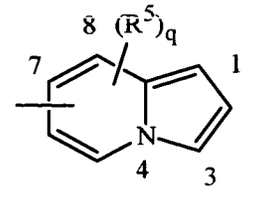
G-33



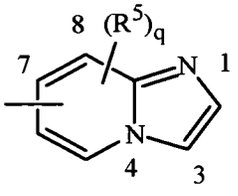
G-34



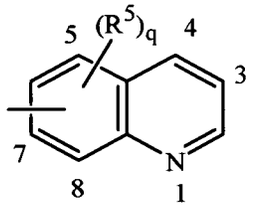
G-35



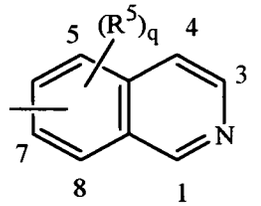
G-36



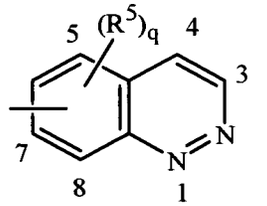
G-37



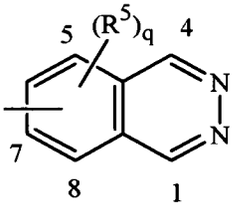
G-38



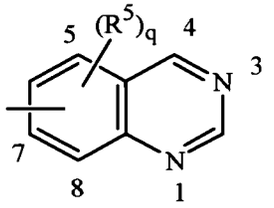
G-39



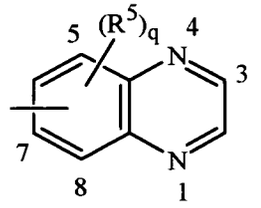
G-40



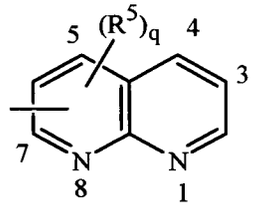
G-41



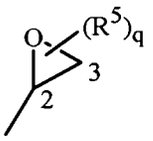
G-42



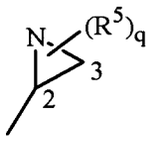
G-43



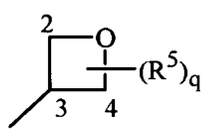
G-44



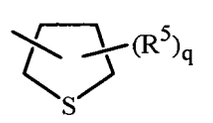
G-45



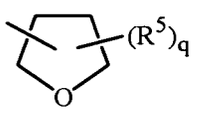
G-46



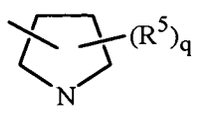
G-47



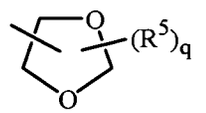
G-48



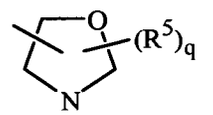
G-49



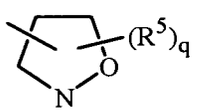
G-50



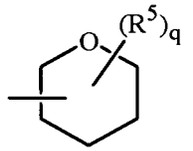
G-51



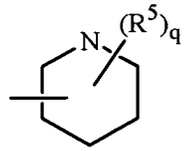
G-52



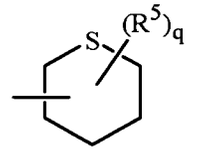
G-53



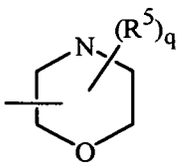
G-54

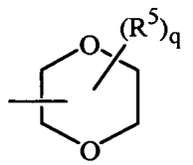


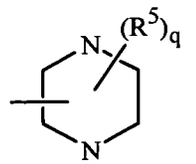
G-55

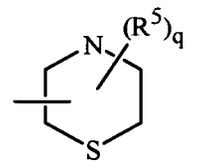


G-56



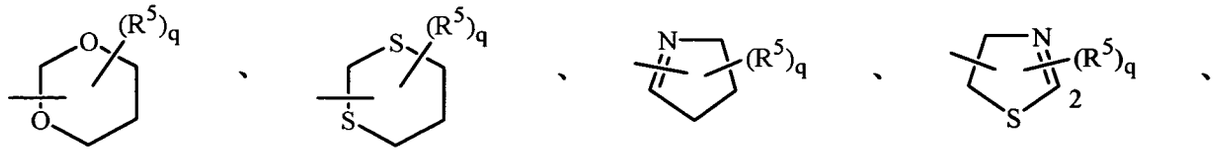




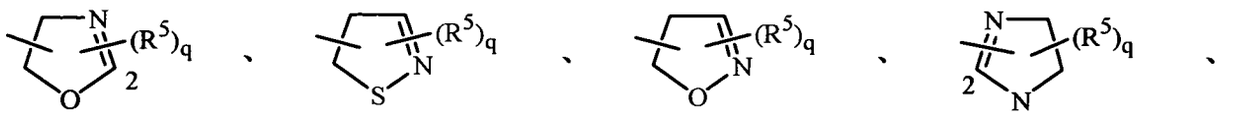


S

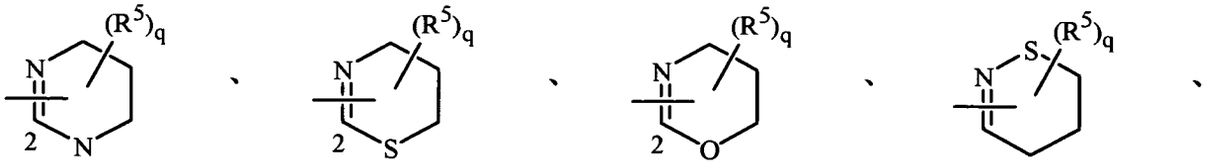
G-57 G-58 G-59 G-60



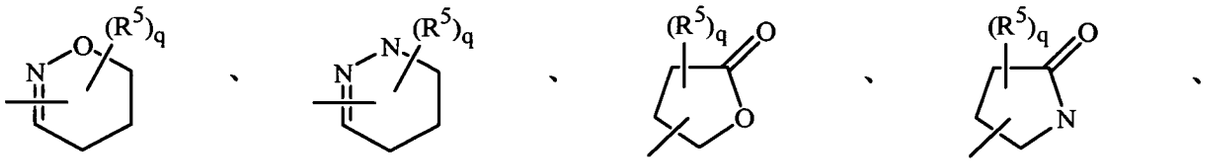
G-61 G-62 G-63 G-64



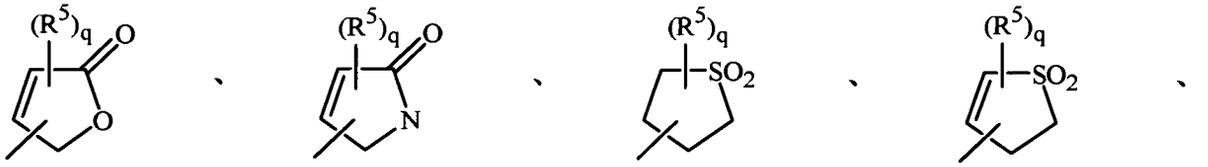
G-65 G-66 G-67 G-68



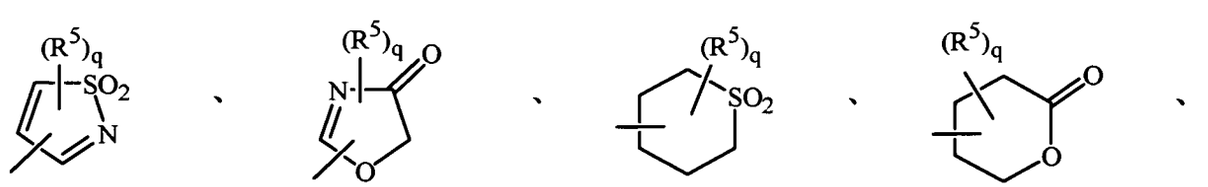
G-69 G-70 G-71 G-72



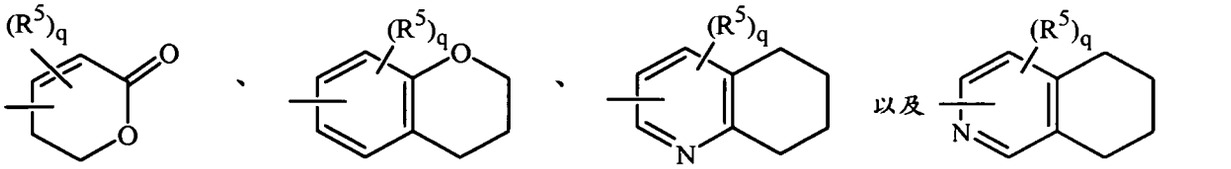
G-73 G-74 G-75 G-76



G-77 G-78 G-79 G-80



G-81 G-82 G-83 G-84



G-85 G-86 G-87 以及 G-88

所組成之群組的環，其中該浮動鍵經由所繪之環或環系中任何可得的碳原子與式 1 之 C≡C 連接；當 R^5 與

碳環員連接時，該 R^5 係選自 R^{5a}，且當 R^5 與氮環員連接時，該 R^5 係選自 R^{5b}；及 q 為一 0 至 5 之整數；以及

各 R^{5a} 係獨立為鹵素、氰基、硝基、OR^6、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

3. 如請求項 2 所述之化合物，其中

Q 為 Q-4 或 Q-24；

x 為 0、1、2 或 3；

R^2 為氫或甲基；

G 係選自於由 G-1、G-2、G-4、G-7、G-10、G-21、G-23、G-27 及 G-33 所組成之群組；

q 為 0、1、2 或 3；以及

各 R^6 係獨立為氫、C_1–C_6 烷基或 C_1–C_6 鹵烷基。

4. 如請求項 3 所述之化合物，其中

A 為 CH 或 CF；

各 R^1 係獨立為氟、氯、CH_3、CF_3、OCF_3 或 $OCHF_2$；

R^2 為氫；以及

R^3 為 C_1–C_4 烷基或 C_3–C_6 環烷基。

5. 如請求項 1 所述之化合物，其係選自於由以下所組成之群組：

4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺；

4-(3-甲基-1-丁炔-1-基)-*N*-(4-喹啉基甲基)苯磺醯胺；

5-(2-環戊基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺；

5-(2-環丙基乙炔基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺；

5-(3-甲基-1-丁炔-1-基)-*N*-(4-喹啉基甲基)-2-噻吩磺醯胺；

N-[(8-氟-4-喹啉基)甲基]-4-(3-甲基-1-丁炔-1-基)-苯磺醯胺；以及

4-(2-環丙基乙炔基)-*N*-[(8-氟-4-喹啉基)甲基]苯磺醯胺。

6. 一種組成物，包含一殺寄生蟲有效量的請求項1所述之化合物以及至少一醫藥上或獸醫上可接受載劑或稀釋劑。

7. 一種組成物，包含(a)一殺寄生蟲有效量的請求項1所述之化合物；以及(b)至少一另外的生物有效化合物或藥劑。

8. 一種治療需要此類蠕蟲感染治療的動物之方法，該方法包含對該動物口服、局部、腸外或皮下投予一殺寄生蟲有效量的請求項1所述之化合物、或一醫藥上或獸醫上可接受鹽或一包含彼等之組成物。

9. 如請求項8所述之方法，其中該投予為腸內。

10. 如請求項9所述之方法，其中該投予為口服。

11. 如請求項8所述之方法，其中該投予為腸外。

12. 如請求項8所述之方法，其中該施加為局部。

13. 如請求項 8 所述之方法，其中該蠕蟲為撚轉胃蟲 (Haemonchus contortus)。

14. 如請求項 13 所述之方法，其中該投予為口服。