





# 【發明說明書】

## 【中文發明名稱】

新穎雙環吡唑衍生物

## 【英文發明名稱】

NEW BICYCLIC PYRAZOLE DERIVATIVES

## 【技術領域】

本發明涵蓋如本文所描述及定義之通式(I)之新穎雙環吡唑衍生物，製備該等化合物之方法，適用於製備該等化合物之中間化合物，包含該等化合物之醫藥組合物及組合，及該等化合物之用途，其作為唯一藥劑或與其他活性成分組合用於製造供控制、治療及/或預防疾病，特定言之供控制、治療及/或預防動物及人類之蠕蟲感染、更特定言之胃腸及腸外線蟲感染用之醫藥組合物、含有此類化合物之調配物及用於控制、治療及/或預防動物及人類之蠕蟲感染、更特定言之胃腸及腸外線蟲感染之方法。

## 【先前技術】

對所有市售驅蠕蟲劑出現抗性似乎為獸醫學領域中日益嚴重的問題。廣泛使用驅蠕蟲劑來控制線蟲導致大量選擇高抗性蠕蟲群體。因此，對所有驅蠕蟲藥物類別具有抗性之蔓延威脅到了牛、山羊、綿羊及馬中之有效蠕蟲控制。此外，目前僅依賴於使用巨環內酯對犬絲蟲病之成功預防存在危險，因為在美利堅合眾國之一些區域，尤其在絲蟲攻擊感染高發之區域中已描述對多種巨環內酯之功效損失。最終，用來自密西西比三角洲下游之疑似功效損失病例之犬惡絲蟲(*Dirofilaria immitis*)幼蟲進行之實驗性感染研究在活體內確認存在巨環內酯抗性。

儘管人類蠕蟲對驅蠕蟲劑之抗性目前似乎罕見，但在人類蠕蟲病之

治療中亦需要考慮如上文所提及之獸醫學領域中驅蠕蟲抗性之蔓延。對絲蟲病之持久性劑量不足的治療可產生高抗性基因型且已描述對某些驅蠕蟲劑(例如吡喹酮、苯并咪唑及氯硝柳胺)有抗性。

因此，迫切需要具有新穎分子作用模式之阻抗性驅蠕蟲劑。

本發明之目的為提供可在醫學，尤其獸醫學領域中可用作驅蠕蟲劑，特定言之在相對低劑量下對廣泛範圍之蠕蟲具有令人滿意或改良之驅蠕蟲活性之化合物以用於控制、治療及/或預防動物及人類之蠕蟲感染，較佳對治療之生物體無任何不良毒性效應。

某些吡唑并嘧啶甲醯胺係關於其提高內源性配位基3-羥基丁酸酯之效能之活性，如Journal of Medicinal Chemistry,55,(7),3563-3567中所述。其他吡唑并嘧啶甲醯胺係描述為如Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters ,18,(18),4948-4951中之高親和性菸鹼酸受體GPR109A之立體異位促效劑。此外，吡唑并嘧啶甲醯胺稱為蛋白激酶調節劑(EP1918291)，作為活性成分用於治療或預防皮膚疾病(WO 2009041663)或作為NAD(P)H氧化酶抑制劑(WO 2003091256)。用於該等化合物之庫合成方法之某一方法描述於Journal of Combinatorial Chemistry,9,(3),507-512中。磺醯苯基吡唑(Sulfonylphenylpyrazole)化合物亦稱作COX-2抑制劑(WO 2001/16138)。用於鹵化銀色彩攝影材料中之影像形成方法中之其他咪唑吡唑偶合劑(imidazopyrazole coupler)為吾人所知(JP05034880A)。

然而，現有技術水平並未描述如本文所描述及定義之本發明之通式(I)之新穎雙環吡唑衍生物。

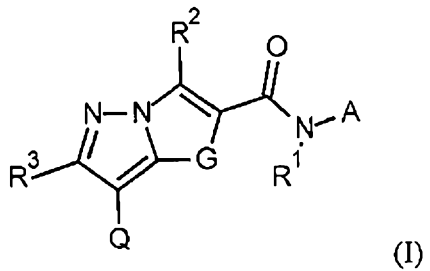
現已發現，本發明之化合物具有出人意料且有利之特性，且此構成

本發明之基礎。

特定言之，意外地發現本發明之化合物有效地與線蟲之Slo-1相互作用。此相互作用之特徵在於實現麻痹/抑制特定言之胃腸線蟲、獨立生存線蟲及絲蟲，其資料在生物學實驗部分中給出。因此，本發明之化合物可用作控制、治療及/或預防胃腸及腸外蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外線蟲感染，包括絲蟲感染之驅蠕蟲劑。

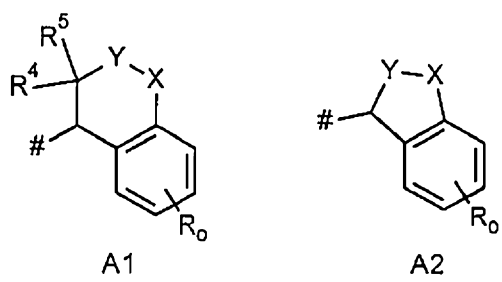
【發明內容】

根據第一態樣，本發明涵蓋通式(I)化合物：



其中：

A為A1或A2，



o為0、1、2、3或4，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>鹵代烷基，

X、Y獨立地選自由以下組成之群：CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、O、S及N-R<sup>8</sup>，其中X及Y中之至少一者為CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>，或

X、Y一起形成環成員，該環成員選自由以下組成之群：-C(O)-O-、-C(O)-NR<sup>8</sup>-、-S(O)-NR<sup>8</sup>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>8</sup>-及-SO<sub>2</sub>-O-，

G為S、O、N-R<sup>8</sup>

R<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、氰基、-CHO、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>鹵代環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、苯甲氧基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員

至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)；

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；

-OR<sup>11</sup>；

-SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子

之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

烷基-C(O)--、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及4員至10員雜環烷基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

或R<sup>4</sup>及R<sup>5</sup>連同其附接之碳原子一起形成3員至6員環，該環選自由以下組成之群：C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基及3員至6員雜環烷基，

R<sup>6</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>7</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

或R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>連同其附接之碳原子一起形成3員至6員環，該環選自由以下組成之群：C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基及3員至6員雜環烷基，

R<sup>8</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>9</sup>及R<sup>10</sup>獨立地選自由以下組成之群：

氫、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)<sub>2</sub>P(=O)-；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基、苯并-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-

OH、氰基、-COOH、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-C(O)-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-S- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-SO<sub>2</sub>- $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之-S- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基；

雜環基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-C(O)-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、羥基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-S- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-SO<sub>2</sub>- $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之-S- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-S- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-SO<sub>2</sub>- $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之-S- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基及具有1

至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

氫；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員

至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷

基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

Q選自由以下組成之群：6員或10員芳基及5員至10員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：鹵素、SF<sub>5</sub>、氰基、-CHO、硝基、側氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>羥基烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NH-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基))(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基亞胺基)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、4員至6員雜環基，其視情況經1或2個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基，-CH<sub>2</sub>-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、經4員至6員雜環基取代之甲基，該雜環基自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、-CH<sub>2</sub>-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、-CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CONH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-NHCO(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、具有1至5個鹵素原子之-NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)，

其中當Y為O、S或N-R<sup>8</sup>時，R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>中無一者為-OH，且其

中當X為O、S或N-R<sup>8</sup>時，R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>中無一者為-OH，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

### 【實施方式】

#### 定義

術語「經取代」意謂指定原子或基團上之一或多個氫原子經來自指定基團之選項置換，其限制條件為不超過現有情形下指定原子之正常原子價。容許取代基及/或變數之組合。

術語「視情況經取代」意謂取代基之數目可等於或不等於零。除非另外指明，否則視情況經取代之基團有可能經許多視情況選用的取代基取代，只要該等取代基可藉由在任何可利用之碳或氮原子上用非氫取代基置換氫原子來容納即可。通常，視情況選用之取代基存在時之數目有可能為1、2、3、4或5，特定言之1、2或3。

如本文中所使用，術語「一或多個」(例如在本發明之通式(I)化合物之取代基之定義中)意謂「1、2、3、4或5個，特定言之1、2、3或4個，更特定言之1、2或3個，甚至更特定言之1或2個」。

如本文中所使用，側氧基取代基表示經由雙鍵鍵結至碳原子或硫原子之氧原子。

術語「環取代基」意謂與芳族或非芳族環連接之取代基，其置換環上之可用氫原子。

若複合取代基由超過一個部分組成，例如(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)-，則給定部分之位置有可能在該複合取代基之任何適合之位置處，亦即C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基部分可附接至該(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)-基團之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

烷基部分之任何碳原子。此複合取代基之開頭或末尾處之連字符指示該複合取代基與分子之其餘部分之連接點。若包含碳原子及視情況存在之一或多個雜原子(諸如氮、氧或硫原子)之環例如經取代基取代，則該取代基有可能在該環之任何適合位置處鍵結，其鍵結至適合碳原子及/或適合雜原子。

如本文中所使用，各別取代基連接至分子之其餘部分的位置可在繪製之結構中藉由該取代基中之散列符號(#)或虛線描述。

術語「包含(comprising)」在用於本說明書中時包括「由……組成(consisting of)」。

若在本文內任何項目稱為「如本文所提及」，則其意謂其可在本文中之任何位置提及。

本文中提及之術語具有以下含義：

術語「鹵素原子」意謂氟、氯、溴或碘原子，特定言之氟、氯或溴原子。

術語「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基」意謂具有1、2、3、4、5或6個碳原子之直鏈或分支鏈、飽和、單價烴基。術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」意謂具有1、2、3或4個碳原子之直鏈或分支鏈、飽和、單價烴基，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基、或第三丁基或其異構體。特定言之，該基團具有1、2或3個碳原子(「C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基」)，例如甲基、乙基、正丙基或異丙基。

術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烴基烷基」意謂直鏈或分支鏈、飽和、單價烴基，其中術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」如上文所定義，且其中1或2個氫原子經烴基置換，例如烴基甲基、1-烴乙基、2-烴乙基、1,2-二烴乙基、3-烴丙基、2-烴丙

基、1-羥丙基、1-羥基丙-2-基、2-羥基丙-2-基、2,3-二羥丙基、1,3-二羥基丙-2-基、3-羥基-2-甲基-丙基、2-羥基-2-甲基-丙基、1-羥基-2-甲基-丙基。

術語「-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)」或「-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>」意謂直鏈或分支鏈的飽和單價基團，其中術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」如上文所定義，例如甲胺基、乙胺基、正丙胺基、異丙胺基、N,N-二甲胺基、N-甲基-N-乙胺基或N,N-二乙胺基。

術語「-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」、「-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」或「-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」意謂直鏈或分支鏈飽和基團，其中術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」如上文所定義，例如甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、異丙基硫基、正丁基硫基、第二丁基硫基、異丁基硫基或第三丁基硫基、甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、正丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、正丁基亞磺醯基、第二丁基亞磺醯基、異丁基亞磺醯基或第三丁基亞磺醯基、或甲基磺醯基、乙基磺醯基、正丙基磺醯基、異丙基磺醯基、正丁基磺醯基、第二丁基磺醯基、異丁基磺醯基或第三丁基磺醯基。

術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基」意謂直鏈或分支鏈的飽和單價烴基，其中術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」如上文所定義，且其中一或多個氫原子經鹵素原子相同或不同地置換。特定言之，該鹵素原子為氟原子。更特定言之，所有該等鹵素原子為氟原子(「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>氟烷基」)。該C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基為例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基或1,3-二氟丙-2-基。

術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基」意謂直鏈或分支鏈飽和單價式(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)-O-之基團，其中術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」如上文所定義，例如甲氧基、乙氧基、

正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基或第三丁氧基，或其異構體。

術語「 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基」意謂如上文所定義之直鏈或分支鏈的飽和單價 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，其中氫原子中之一或多者經鹵素原子相同或不同地置換。特定言之，該鹵素原子為氟原子。該 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基為例如氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基或五氟乙氧基。

術語「 $C_2$ - $C_4$ 烯基」意謂直鏈或分支鏈的單價烴基，其含有一個雙鍵，且其具有2、3或4個碳原子。該 $C_2$ - $C_4$ 烯基為例如乙烯基(ethenyl)(或「乙烯基(vinyl)」)、丙-2-烯-1-基(或「烯丙基」)、丙-1-烯-1-基、丁-3-烯基、丁-2-烯基、丁-1-烯基、丙-1-烯-2-基(或「異丙烯基」)、2-甲基丙-2-烯基、1-甲基丙-2-烯基、2-甲基丙-1-烯基或1-甲基丙-1-烯基。特定言之，該基團為烯丙基。

術語「 $C_2$ - $C_4$ 炔基」意謂直鏈單價烴基，其含有一個三鍵且其含有2、3或4個碳原子。該 $C_2$ - $C_4$ 炔基為例如乙炔基、丙-1-炔基、丙-2-炔基(或「2-丙炔基」)、丁-1-炔基、丁-2-炔基、丁-3-炔基或1-甲基丙-2-炔基。特定言之，該炔基為丙-1-炔基或丙-2-炔基。

術語「 $C_3$ - $C_6$ 環烷基」意謂含有3、4、5或6個碳原子之飽和單價單環烴環(「 $C_3$ - $C_6$ 環烷基」)。該 $C_3$ - $C_6$ 環烷基為例如單環烴環，例如環丙基、環丁基、環戊基或環己基。

術語「 $C_3$ - $C_6$ 鹵代環烷基」意謂飽和的單價單環烴環，其中術語「 $C_3$ - $C_6$ 環烷基」係如上文所定義，且其中氫原子中之一或多者經鹵素原子相同或不同地置換。特定言之，該鹵素原子為氟或氯原子。該 $C_3$ - $C_6$ 鹵代環烷基為例如經一或兩個氟或氯原子取代之單環烴環，例如1-氟-環丙

基、2-氟環丙基、2,2-二氟環丙基、2,3-二氟環丙基、1-氯環丙基、2-氯環丙基、2,2-二氯環丙基、2,3-二氯環丙基、2-氟-2-氯環丙基及2-氟-3-氯環丙基。

術語「-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)」或「-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)」意謂直鏈或分支鏈飽和單價基團，其中術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」及術語「C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基」各自如上文所定義，例如環丙胺基、環丁胺基、環戊胺基、環己胺基、N-甲基-N-環丙胺基、N-乙基-N-環丙胺基、N-甲基-N-環丁胺基、N-乙基-N-環丁胺基、N-甲基-N-環戊胺基、N-乙基-N-環戊胺基、N-甲基-N-環己胺基或N-乙基-N-環己胺基。

術語「苯并-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基」意謂單價雙環烴環，其中含有5或6個碳原子之飽和單價單環烴環(「C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基」)經增環為苯環。該苯并-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基為例如雙環烴環，例如茛滿(亦即2,3-二氫-1H-茛)或蔡滿(亦即1,2,3,4-四氫化蔡)基團。

術語「螺環烷基」意謂飽和的單價雙環烴基，其中兩個環共有一個共同環碳原子，且其中該雙環烴基含有5、6、7、8、9、10或11個碳原子，該螺環烷基有可能經由除螺碳原子以外之碳原子中之任一者連接至分子之其餘部分。該螺環烷基為例如螺[2.2]戊基、螺[2.3]己基、螺[2.4]庚基、螺[2.5]辛基、螺[2.6]壬基、螺[3.3]庚基、螺[3.4]辛基、螺[3.5]壬基、螺[3.6]癸基、螺[4.4]壬基、螺[4.5]癸基、螺[4.6]十一烷基或螺[5.5]十一烷基。

術語「雜環烷基」意謂總計具有4、5、6、7、8、9或10個環原子(「4至10員雜環烷基」)，特定言之4、5或6個環原子(「4至6員雜環烷基」)之單環或雙環的飽和或部分飽和雜環，其含有一或兩個來自系列N、

O及S之相同或不同環雜原子，該雜環烷基有可能經由碳原子中之任一者或氮原子(若存在)連接至分子之其餘部分。

該雜環烷基可為(但不限於)4員環，諸如氮雜環丁烷基、氧雜環丁烷基或硫雜環丁基；或5員環，諸如四氫呋喃基、1,3-二氧雜環戊烷基、硫雜環戊烷基、吡咯啉基、咪唑啉基、吡唑啉基、1,1-二氧離子基硫雜環戊烷基、1,2-噁唑啉基、1,3-噁唑啉基、1,3-噻唑啉基或1,2,4-三唑啉基；或6員環，諸如四氫哌喃基、四氫硫哌喃基、哌啉基、嗎啉基、二噻烷基、硫代嗎啉基、哌嗪基、1,3-二氧雜環己烷基、1,4-二氧雜環己烷基或1,2-氧氮雜環己烷基；或7員環，諸如氮雜環庚烷基、1,4-二氮雜環庚烷基或1,4-氧氮雜環庚烷基；或雙環7員環，諸如6-氧雜-3-氮雜雙環[3.1.1]庚；或雙環8員環，諸如5,6-二氫-4H-呋喃并[2,3-c]吡咯或8-氧雜-3-氮雜雙環[3.2.1]辛；或雙環9-員環，諸如八氫-1H-吡咯并[3,4-b]吡啶、1,3-二氫-異吲哚、2,3-二氫-吲哚或3,9-二氧雜-7-氮雜雙環[3.3.1]壬；或雙環10員環，諸如十氫喹啉或3,4-二氫異喹啉。

術語「雜螺環烷基」意謂總計具有6、7、8、9、10或11個環原子之雙環飽和雜環，其中兩個環共有一個共同環碳原子，該「雜螺環烷基」含有一或兩個來自系列N、O、S之相同或不同環雜原子；該雜螺環烷基有可能經由除螺碳原子以外之碳原子中之任一者或氮原子(若存在)連接至分子之其餘部分。

該雜螺環烷基係例如氮雜螺[2.3]己基、氮雜螺[3.3]庚基、氧雜氮雜螺[3.3]庚基、硫雜氮雜螺[3.3]庚基、氧雜螺[3.3]庚基、氧雜氮雜螺[5.3]壬基、氧雜氮雜螺[4.3]辛基、氧雜氮雜螺[2.5]辛基、氮雜螺[4,5]癸基、氧雜氮雜螺[5.5]十一烷基、二氮雜螺[3.3]庚基、硫雜氮雜螺[3.3]庚基、

硫雜氮雜螺[4.3]辛基、氮雜螺[5.5]十一烷基或諸如以下的其他同系架構中之一者：螺[3.4]-、螺[4.4]-、螺[2.4]-、螺[2.5]-、螺[2.6]-、螺[3.5]-、螺[3.6]-、螺[4.5]-及螺[4.6]-。

術語「6員或10員芳基」意謂具有6或10個碳環原子之單價的單環或雙環芳族環，例如苯基或萘基。

術語「雜芳基」意謂具有5、6、9或10個環原子(「5至10員雜芳基」)、特定言之5或6個環原子(「5至6員雜芳基」)之單價單環、雙環或三環芳族環，其含有至少一個環雜原子及視情況存在之一個、兩個或三個來自系列N、O及/或S之其他環雜原子且其經由環碳原子或視情況經由環氮原子(若原子價允許)鍵結。

該雜芳基可為5員雜芳基，諸如噻吩基、呋喃基、吡咯基、噁唑基、噻唑基、咪唑基、吡唑基、異噁唑基、異噻唑基、噁二唑基、三唑基、噻二唑基或四唑基；或6員雜芳基，諸如吡啶基、嘧啶基、嘧啶基、吡嗪基或三嗪基。

術語「雜環基」意謂選自由雜環烷基及雜芳基組成之群的雜環。特定言之，術語「4至6員雜環基」意謂選自由4至6員雜環烷基及5至6員雜芳基組成之群的雜環。

大體而言，且除非另外提及，否則雜芳基或仲雜芳基包括其所有可能異構體形式，例如：關於與分子之其餘部分之鍵聯點的互變異構體及位置異構體。因此，對於一些說明性非限制性實例，術語吡啶基包括吡啶-2-基、吡啶-3-基及吡啶-4-基；或術語噻吩基包括噻吩-2-基及噻吩-3-基。

如本文中所使用，例如在「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」、「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基」、「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>羥基烷基」、「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基」或「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基」之定義的上下文中，

術語「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>」意謂具有有限數目的1至4個碳原子，亦即1、2、3或4個碳原子的烷基。

另外，如本文中所使用，如在本文中所使用，例如在「C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基」或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>鹵代環烷基之定義的上下文中，術語「C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>」意謂具有有限數目的3至6個碳原子，亦即3、4、5或6個碳原子之環烷基。

當給定值之範圍時，該範圍涵蓋該範圍內之各值及子範圍。

舉例而言：

「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>」涵蓋C<sub>1</sub>、C<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>、C<sub>4</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>及C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>；

「C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>」涵蓋C<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>、C<sub>4</sub>、C<sub>5</sub>、C<sub>6</sub>、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>5</sub>及C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>；

「C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>」涵蓋C<sub>3</sub>、C<sub>4</sub>及C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>；

「C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>」涵蓋C<sub>3</sub>、C<sub>4</sub>、C<sub>5</sub>、C<sub>6</sub>、C<sub>7</sub>、C<sub>8</sub>、C<sub>9</sub>、C<sub>10</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>9</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>5</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>、C<sub>6</sub>-C<sub>9</sub>、C<sub>6</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>6</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub>、C<sub>7</sub>-C<sub>9</sub>、C<sub>7</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>、C<sub>8</sub>-C<sub>9</sub>及C<sub>9</sub>-C<sub>10</sub>；

「C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>」涵蓋C<sub>3</sub>、C<sub>4</sub>、C<sub>5</sub>、C<sub>6</sub>、C<sub>7</sub>、C<sub>8</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>5</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>6</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>6</sub>-C<sub>7</sub>及C<sub>7</sub>-C<sub>8</sub>；

「C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>」涵蓋C<sub>3</sub>、C<sub>4</sub>、C<sub>5</sub>、C<sub>6</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>5</sub>、及C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>；

「C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>」涵蓋C<sub>4</sub>、C<sub>5</sub>、C<sub>6</sub>、C<sub>7</sub>、C<sub>8</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>、C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>、C<sub>4</sub>-

$C_5$ 、 $C_5-C_8$ 、 $C_5-C_7$ 、 $C_5-C_6$ 、 $C_6-C_8$ 、 $C_6-C_7$ 及 $C_7-C_8$ ；

「 $C_4-C_7$ 」涵蓋 $C_4$ 、 $C_5$ 、 $C_6$ 、 $C_7$ 、 $C_4-C_7$ 、 $C_4-C_6$ 、 $C_4-C_5$ 、 $C_5-C_7$ 、 $C_5-C_6$ 及 $C_6-C_7$ ；

「 $C_4-C_6$ 」涵蓋 $C_4$ 、 $C_5$ 、 $C_6$ 、 $C_4-C_6$ 、 $C_4-C_5$ 及 $C_5-C_6$ ；

「 $C_5-C_{10}$ 」涵蓋 $C_5$ 、 $C_6$ 、 $C_7$ 、 $C_8$ 、 $C_9$ 、 $C_{10}$ 、 $C_5-C_{10}$ 、 $C_5-C_9$ 、 $C_5-C_8$ 、 $C_5-C_7$ 、 $C_5-C_6$ 、 $C_6-C_{10}$ 、 $C_6-C_9$ 、 $C_6-C_8$ 、 $C_6-C_7$ 、 $C_7-C_{10}$ 、 $C_7-C_9$ 、 $C_7-C_8$ 、 $C_8-C_{10}$ 、 $C_8-C_9$ 及 $C_9-C_{10}$ ；

「 $C_6-C_{10}$ 」涵蓋 $C_6$ 、 $C_7$ 、 $C_8$ 、 $C_9$ 、 $C_{10}$ 、 $C_6-C_{10}$ 、 $C_6-C_9$ 、 $C_6-C_8$ 、 $C_6-C_7$ 、 $C_7-C_{10}$ 、 $C_7-C_9$ 、 $C_7-C_8$ 、 $C_8-C_{10}$ 、 $C_8-C_9$ 及 $C_9-C_{10}$ 。

如本文中所使用，術語「離去基」意謂在化學反應中作為與其鍵結之電子的穩定物種之原子或原子基團。特定言之，此離去基選自包含以下之群：鹵素，特定言之氟、氯、溴或碘、(甲磺醯基)氧基、[(三氟甲基)磺醯基]氧基、[(九氟丁基)磺醯基]氧基、(苯磺醯基)氧基、[(4-甲基苯基)磺醯基]氧基、[(4-溴苯基)磺醯基]氧基、[(4-硝基苯基)磺醯基]氧基、[(2-硝基)磺醯基]氧基、[(4-異丙基苯基)磺醯基]氧基、[(2,4,6-三異丙基苯基)磺醯基]氧基、[(2,4,6-三甲基苯基)磺醯基]氧基、[(4-第三丁基苯基)磺醯基]氧基及[(4-甲氧基苯基)磺醯基]氧基。

在本發明上下文中之側氧基取代基意謂氧原子，其經由雙鍵鍵結至碳原子。

通式(I)化合物有可能以同位素變體之形式存在。因此，本發明包括通式(I)化合物之一或多種同位素變體，特定言之含氘之通式(I)化合物。

術語化合物或試劑之「同位素變體」定義為呈現非天然比例的構成此化合物之同位素中之一或多者的化合物。

術語「通式(I)化合物之同位素變體」定義為呈現非天然比例的構成此化合物之同位素中之一或多者的通式(I)化合物。

表述「非天然比例」意謂此類同位素高於其天然豐度之比例。在此上下文中，待應用之同位素之天然豐度描述於「Isotopic Compositions of the Elements 1997」, Pure Appl. Chem., 70(1), 217-235, 1998中。

此類同位素之實例包括氫、碳、氮、氧、磷、硫、氟、氯、溴及碘之穩定的放射性同位素，分別諸如 $^2\text{H}$  (氘)、 $^3\text{H}$  (氚)、 $^{11}\text{C}$ 、 $^{13}\text{C}$ 、 $^{14}\text{C}$ 、 $^{15}\text{N}$ 、 $^{17}\text{O}$ 、 $^{18}\text{O}$ 、 $^{32}\text{P}$ 、 $^{33}\text{P}$ 、 $^{33}\text{S}$ 、 $^{34}\text{S}$ 、 $^{35}\text{S}$ 、 $^{36}\text{S}$ 、 $^{18}\text{F}$ 、 $^{36}\text{Cl}$ 、 $^{82}\text{Br}$ 、 $^{123}\text{I}$ 、 $^{124}\text{I}$ 、 $^{125}\text{I}$ 、 $^{129}\text{I}$ 及 $^{131}\text{I}$ 。

關於本文中所指定病症之治療及/或預防，通式(I)化合物之同位素變體較佳含有氘(「含氘之通式(I)化合物」)。其中併入一或多個放射性同位素，諸如 $^3\text{H}$ 或 $^{14}\text{C}$ 之通式(I)化合物之同位素變異體適用於例如藥物及/或受質組織分佈研究中。為易於其之併入及可偵測性，此等同位素為尤其較佳的。可將諸如 $^{18}\text{F}$ 或 $^{11}\text{C}$ 之正電子發射同位素併入至通式(I)化合物中。通式(I)化合物之此等同位素變體適用於活體內成像應用。含氘及含 $^{13}\text{C}$ 之通式(I)化合物可在臨床前或臨床研究之情形下用於質譜分析中。

通式(I)化合物之同位素變體通常可藉由熟習此項技術者已知之方法製備，諸如本文流程及/或實例中所述之方法，藉由用一試劑之同位素變體、較佳含氘試劑取代該試劑。視所期望的氘化位點而定，在一些情況下，可將來自 $\text{D}_2\text{O}$ 之氘直接併入化合物中或併入適用於合成此類化合物之試劑中。氘氣亦為適用於將氘併入分子中之試劑。烯鍵及炔鍵之催化氘化為併入氘之快速途徑。在氘氣存在下金屬催化劑(亦即Pd、Pt及Rh)可用於將含有氫之官能基中的氫直接交換為氘。各種氘化試劑及合成構建塊可購

自各公司，諸如C/D/N Isotopes, Quebec, Canada；Cambridge Isotope Laboratories Inc., Andover, MA, USA；及CombiPhos Catalysts, Inc., Princeton, NJ, USA。

術語「含氙之通式(I)化合物」定義為通式(I)化合物，其中一或多個氫原子經一或多個氙原子置換且其中通式(I)化合物之各氙化位置處之氙豐度高於氙之天然豐度，其為約0.015%。特定言之，在含氙之通式(I)化合物中，通式(I)化合物之各氙化位置處之氙豐度高於10%、20%、30%、40%、50%、60%、70%或80%，較佳高於90%、95%、96%或97%，甚至更佳地高於98%或99%該等位置。應理解，各氙化位置處之氙豐度與其他氙化位置處之氙豐度無關。

將一或多個氙原子選擇性併入通式(I)化合物中可改變分子之物理化學性質(諸如酸性[C. L. Perrin等人, J. Am. Chem. Soc., 2007, 129, 4490]、鹼性[C. L. Perrin等人, J. Am. Chem. Soc., 2005, 127, 9641]、親脂性[B. Testa等人, Int. J. Pharm., 1984, 19(3), 271])及/或代謝概況，且可引起母化合物與代謝物之比率或所形成代謝物之量的變化。此類變化可產生某些治療優勢且從而在某些情況下可為較佳。已報導減小之代謝及代謝切換速率，其中代謝物之比率改變(A. E. Mutlib等人, Toxicol. Appl. Pharmacol., 2000, 169, 102)。暴露於親本藥物及代謝物時之此等變化可對含氙之通式(I)化合物之藥效學、耐受性及功效具有重要結果。在一些情況下，氙取代減少或消除非所要或毒性代謝物之形成且促進所要代謝物之形成(例如奈韋拉平(Nevirapine)：A. M. Sharma等人, Chem. Res. Toxicol., 2013, 26, 410；依法韋侖(Efavirenz)：A. E. Mutlib等人, Toxicol. Appl. Pharmacol., 2000, 169, 102)。在其他情況下，氙化之主要

作用為降低全身清除率。因此，化合物之生物半衰期增加。潛在臨床益處包括能夠經由降低峰值水準及增加谷值水準來維持類似的全身暴露。此可視特定化合物之藥物動力學/藥效學關係而定，減少副作用且增強功效。ML-337 (C. J. Wenthur等人, J. Med. Chem., 2013, 56, 5208)及奧當卡替(Odanacatib) (K. Kassahun等人, WO2012/112363)為此氙作用之實例。另外報導有其他情況，其中代謝速率降低導致藥物之暴露量增加而不改變全身清除率(例如羅非考昔(Rofecoxib)：F. Schneider等人, *Arzneim. Forsch./Drug. Res.*, 2006, 56, 295；特拉匹韋(Telaprevir)：F. Maltais等人, J. Med. Chem., 2009, 52, 7993)。展示此作用之氙化藥物可具有降低之給藥要求(例如，用於達成所要作用之劑量數降低或劑量降低)及/或可產生較低之代謝物負載。

通式(I)化合物可具有多個潛在的代謝攻擊位點。為優化對於物理化學性質及代謝型態之上述作用，可選擇具有某一模式之一或多個氙氫交換之含氙之通式(I)化合物。特定言之，含氙之通式(I)化合物之氙原子附接至碳原子及/或位於通式(I)化合物之彼等位置處，其為諸如細胞色素P<sub>450</sub>之代謝酶的攻擊位點。

若本文使用複數形式之措詞化合物、鹽、多晶型物、水合物、溶劑合物及其類似物，則亦意謂單個化合物、鹽、多晶型物、異構體、水合物、溶劑合物或其類似物。

「穩定化合物」或「穩定結構」意謂化合物足夠穩固以經受住自反應混合物分離至適用純度且調配為有效治療劑。

視各種所要取代基之位置及性質而定，本發明之化合物視情況含有一或多個不對稱中心。一或多個不對稱碳原子有可能以(R)或(S)組態存

在，此可在單一不對稱中心之情況下產生外消旋混合物且在多個不對稱中心之情況下產生非對映異構體混合物。在某些情況下，不對稱性亦有可能由於圍繞既定鍵(例如與指定化合物之兩個經取代芳環鄰接之中心鍵)限制性旋轉而存在。

較佳化合物為產生較多所要生物活性之化合物。本發明之化合物之經分離的純或部分純化異構體及立體異構體或外消旋或非對映異構體混合物亦包括在本發明之範疇內。此類物質之純化及分離可藉由此項技術中已知之標準技術實現。

較佳異構體為產生較多所需生物活性之異構體。本發明化合物之此等經分離的、純的或部分純化的異構體或外消旋混合物亦包括在本發明之範疇內。此類物質之純化及分離可藉由此項技術中已知之標準技術實現。

光學異構體可藉由根據習知方法解析外消旋混合物，例如藉由使用光活性酸或鹼形成非對映異構鹽，或形成共價非對映異構體來獲得。適當酸之實例為酒石酸、二乙醯基酒石酸、二甲苯醯基酒石酸及樟腦磺酸。非對映異構體之混合物可藉由此項技術中已知之方法(例如藉由層析或分步結晶)基於其物理及/或化學差異分離成其個別非對映異構體。隨後自經分離之非對映異構鹽釋放光學活性鹼或酸。分離光學異構體之不同方法涉及在進行或不進行習知衍生之情況下使用對掌性層析(例如使用對掌相之HPLC管柱)，最佳選擇習知衍生以使對映異構體之分離最大化。使用對掌性相之適合之HPLC管柱為市售的，諸如由Daicel製造之管柱，例如Chiracel OD及Chiracel OJ，例如以及許多其他管柱，其均為可常規選擇的。進行或不進行衍生之酶分離亦為適用的。本發明之光活性化合物同樣可藉由利用光活性起始物質對掌性合成來獲得。

為了將不同類型的異構體彼此區分開，參考IUPAC規則E部分(Pure Appl Chem 45, 11-30, 1976)。

本發明包括本發明化合物之所有可能立體異構體，其呈單一立體異構體形式或呈該等立體異構體(例如(R)-或(S)-異構體)以任何比率之任何混合物形式。本發明化合物之單一立體異構體，例如單一對映異構體或單一非對映異構體之分離係藉由任何適合之現有技術水平方法，諸如層析，尤其對掌性層析來實現。

此外，本發明化合物有可能以互變異構體之形式存在。舉例而言，含有在具有增大C-H酸性之雙環吡啶處產生 $\alpha$ -CH-部分之取代型的任何本發明化合物可以互變異構體，或甚至呈兩種互變異構體之任何量的混合物形式存在。

本發明包括本發明化合物的所有可能互變異構體，其呈單一互變異構體形式或該等互變異構體以任何比率之任何混合物形式。

此外，本發明化合物可以N-氧化物形式存在，其定義為本發明化合物之至少一個氮經氧化。本發明包括全部此類可能的N-氧化物。

本發明亦涵蓋本發明化合物之有用形式，諸如代謝物、水合物、溶劑合物、前藥、鹽(尤其醫藥學上可接受之鹽)及/或共沈澱物。

本發明化合物可以水合物或溶劑合物之形式存在，其中本發明化合物含有極性溶劑(尤其水、甲醇或乙醇)例如作為化合物之晶格的結構元素。極性溶劑，特定言之水之量有可能以化學計量或非化學計量比率存在。在化學計量溶劑合物(例如水合物)之情況下，半-(hemi-/semi-)、單-、倍半-、二-、三-、四-、五-等溶劑合物或水合物分別為可能的。本發明包括所有此類水合物或溶劑合物。

此外，本發明化合物有可能以游離形式(例如游離鹼或游離酸形式)或兩性離子形式存在，或以鹽形式存在。該鹽可為藥劑學中慣用或用於例如分離或純化本發明化合物之任何鹽，有機或無機加成鹽，特定言之，醫藥學上可接受之任何有機或無機加成鹽。

術語「醫藥學上可接受之鹽」係指本發明化合物之無機或有機酸加成鹽。舉例而言，參見S. M. Berge等人「Pharmaceutical Salts,」 J. Pharm. Sci. 1977, 66, 1-19。

本發明化合物之適合醫藥學上可接受之鹽可為例如在鏈或環中攜帶氮原子且例如呈足夠鹼性之本發明化合物的酸加成鹽，諸如具有無機酸或「無機酸」之酸加成鹽，該無機酸諸如氫氯酸、氫溴酸、氫碘酸、硫酸、胺磺酸、重硫酸、磷酸或硝酸，例如或具有有機酸之酸加成鹽，該有機酸諸如甲酸、乙酸、乙醯乙酸、丙酮酸、三氟乙酸、丙酸、丁酸、己酸、庚酸、十一烷酸、月桂酸、苯甲酸、水楊酸、2-(4-羥苯甲醯基)-苯甲酸、樟腦酸、肉桂酸、環戊丙酸、二葡萄糖酸、3-羥基-2-萘甲酸、菸鹼酸、帕莫酸(pamoic)、果膠酯酸、3-苯基丙酸、特戊酸(pivalic)、2-羥基乙磺酸、衣康酸、三氟甲磺酸、十二烷基硫酸、乙磺酸、苯磺酸、對甲苯磺酸、甲磺酸、2-萘磺酸、萘二磺酸、樟腦磺酸、檸檬酸、酒石酸、硬脂酸、乳酸、草酸、丙二酸、丁二酸、蘋果酸、己二酸、褐藻酸、順丁烯二酸、反丁烯二酸、D-葡萄糖酸、杏仁酸(mandelic)、抗壞血酸、葡糖庚酸、甘油磷酸、天冬胺酸、磺基水楊酸或硫氰酸。

此外，呈足夠酸性之本發明化合物的另一適合醫藥學上可接受之鹽為鹼金屬鹽，例如鈉或鉀鹽；鹼土金屬鹽，例如鈣、鎂或鋇鹽；或鋁或鋅鹽；或衍生自氮或具有1至20個碳原子的有機一級、二級或三級胺之銨

鹽，該胺諸如乙胺、二乙胺、三乙胺、乙基二異丙胺、單乙醇胺、二乙醇胺、三乙醇胺、二環己胺、二甲胺基乙醇、二乙胺基乙醇、參(羥甲基)胺基甲烷、普魯卡因(procaine)、二苯甲基胺、N-甲基嗎啉、精胺酸、離胺酸、1,2-乙二胺、N-甲基哌啶、N-甲基-還原葡萄糖胺、N,N-二甲基-還原葡萄糖胺、N-乙基-還原葡萄糖胺、1,6-己二胺、葡萄糖胺、肌胺酸、絲胺醇、2-胺基-1,3-丙二醇、3-胺基-1,2-丙二醇、4-胺基-1,2,3-丁三醇；或與具有1至20個碳原子的四級銨離子之鹽，諸如四甲銨、四乙銨、四(正丙基)銨、四(正丁基)銨、N-苯甲基-N,N,N-三甲銨、膽鹼或苯甲烴銨。

熟習此項技術者應進一步瞭解，所主張化合物之酸加成鹽有可能藉由使化合物與適當無機酸或有機酸經由多種已知方法中之任一者來反應而製備。或者，本發明之酸性化合物之鹼金屬鹽及鹼土金屬鹽藉由使本發明化合物與適當鹼經由多種已知方法反應而製備。

本發明包括本發明化合物之所有可能鹽，其為單一鹽或該等鹽以任何比率之任何混合物形式。

在本發明正文中，特定言之在實驗部分中，對於本發明之中間物及實例之合成，當以與對應鹼或酸形成之鹽形式提及化合物時，如藉由各別製備及/或純化方法獲得之該鹽形式的精確化學計量組成在大多數情況下為未知的。

除非另外說明，否則關於鹽之化學名稱或結構式之後綴，諸如「鹽酸鹽」、「三氟乙酸鹽」、「鈉鹽」或「 $x$  HCl」、「 $x$  CF<sub>3</sub>COOH」、「 $x$  Na<sup>+</sup>」意謂鹽形式，該鹽形式之化學計量未指定。

此類似地適用於已藉由所述製備及/或純化方法以(若定義)化學計量組成未知的溶劑合物(諸如水合物)形式獲得合成中間物或實例化合物或其

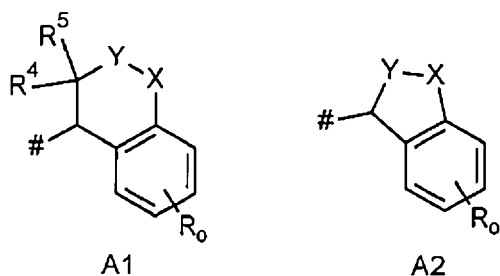
鹽的情況。

此外，本發明包括本發明化合物之所有可能結晶型或多晶型物，其為單一多晶型物或超過一種多晶型物以任何比率的混合物形式。

此外，本發明亦包括本發明化合物之前藥。術語「前藥」在此處指示如下化合物，其自身可具有生物學活性或無活性，但在其在體內之滯留時間期間轉化(例如，以代謝或水解方式)成本發明化合物。

根據第一態樣之第二實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0、1、2、3或4，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

X、Y獨立地選自由以下組成之群：CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、O、S及N-R<sup>8</sup>，其中X及Y中之至少一者為CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>，或

X、Y一起形成環成員，該環成員選自由以下組成之群：-C(O)-O-、-C(O)-NR<sup>8</sup>-、-S(O)-NR<sup>8</sup>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>8</sup>-及-SO<sub>2</sub>-O-，

G為S、O、N-R<sup>8</sup>

R<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、氰基、-CHO、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>鹵代環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、苯甲氧基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具

有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)；

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；

-OR<sup>11</sup>；

-SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧

基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、側氧基、硫羰基、 $-COOH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基- $C(O)-$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、羥基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基-、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷}$

基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及4員至10員雜環烷基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>6</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>7</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>8</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>9</sup>及R<sup>10</sup>獨立地選自由以下組成之群：

氫、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)-(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷

基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基及 $(C_1-C_4\text{烷氧基})_2P(=O)-$ ；

雜環基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、側氧基、硫羰基、 $-COOH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、羥基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基；

苯基、苯并- $C_5$ - $C_6$ 環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基；  
及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2

或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵

素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

氫；

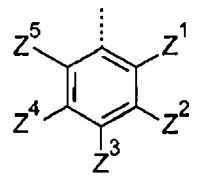
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、SF<sub>5</sub>、

氰基、-CHO、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NH-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基))(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基亞胺基)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、4員至6員雜環基，其視情況經1或2個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、-CH<sub>2</sub>-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、經4員至6員雜環基取代之甲基，該雜環基其自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、-CH<sub>2</sub>-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、-CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CONH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-NHCO(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、具有1至5個鹵素原子之-NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)或

Z<sup>1</sup>及Z<sup>2</sup>連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員飽和或部分飽和雜環、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、SF<sub>5</sub>、氰基、CHO、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

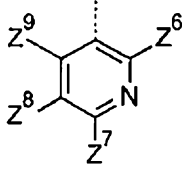
烷基)、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(SO_2-[C_1-C_4\text{烷基}])(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $(C_1-C_4\text{烷氧基亞胺基})-C_1-C_4\text{烷基}$ 、視情況經1或2個取代基取代之4員至6員雜環烷基，該等取代基選自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、 $-CH_2-O-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、經4員至6員雜環烷基取代之甲基，該雜環烷基自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、 $-CH_2-S-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-S(O)-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-S-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-S(O)-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 、 $-CONH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CONH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-NHCO(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-NHCO(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-NHCO(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 或

$Z^2$ 及 $Z^3$ 連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員飽和或部分飽和雜環、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

$Z^1$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $SF_5$ 、氰基、 $CHO$ 、硝基、 $C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、羥基、 $C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、 $C_3-C_6\text{環烷基}-C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、氰基- $C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(SO_2-[C_1-C_4\text{烷基}])(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $(C_1-C_4\text{烷氧基亞胺基})C_1-C_4\text{烷基}$ 、視情況經1或2個取代基取代之4員至6員雜環烷基，該等取代基選

自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、 $-\text{CH}_2-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、經4員至6員雜環烷基取代之甲基，該雜環烷基其自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、 $-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{NHCO}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{NHCO}(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{NHCO}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ ，或

Q為式(Q2)之吡啶環

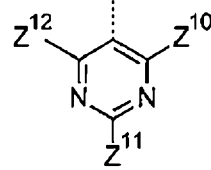


(Q2)

其中：

$Z^6$ 、 $Z^7$ 、 $Z^8$ 及 $Z^9$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ ，或

Q為式(Q3)之嘧啶環

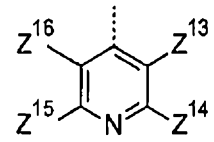


(Q3)

其中：

$Z^{10}$ 、 $Z^{11}$ 及 $Z^{12}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6 \text{ 環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})(C_3-C_6 \text{ 環烷基})$ ，或

Q為式(Q4)之吡啶環



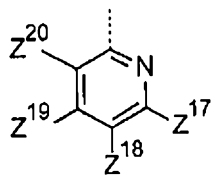
(Q4)

其中：

$Z^{13}$ 、 $Z^{14}$ 、 $Z^{15}$ 及 $Z^{16}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 羥基烷基、 $NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6 \text{ 環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})(C_3-C_6 \text{ 環烷基})$ 、 $-NH-CO-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 及單環雜環，該等單環雜環選自由以下組成之群：4員至7員雜環烷基或具有至少一個氮原子之5員雜芳基，經由該至少一個氮原子該雜芳基環連接至吡啶環，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、側氧基、硫羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-(C_1-C_4 \text{ 鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-(C_1-C_4 \text{ 鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵

素原子之-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)，或

Q是式(Q5)之吡啶環

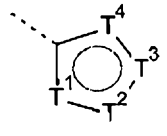


(Q5)

其中：

Z<sup>17</sup>、Z<sup>18</sup>、Z<sup>19</sup>及Z<sup>20</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)，或

Q為式(Q6)之5員芳族雜環



(Q6)

其中：

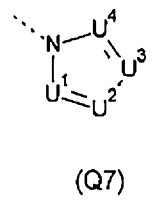
T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>獨立地選自由以下組成之群：N、O、S、C-Z<sup>21</sup>及N-Z<sup>22</sup>，其中T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>中之不超過一者為O，T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>中之不超過一者為S，T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>中之不超過一者為N-Z<sup>22</sup>，且其中

各Z<sup>21</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，及

各Z<sup>22</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

烷基，或

Q為式(Q7)之5員芳族雜環



其中：

U<sup>1</sup>-U<sup>4</sup>獨立地選自由以下組成之群：N及C-Z<sup>23</sup>，其中U<sup>1</sup>-U<sup>4</sup>中之不超過三者為N，且其中

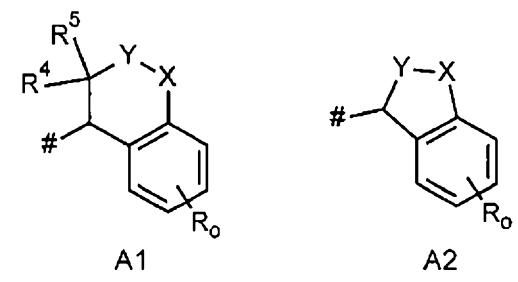
各Z<sup>23</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

其中當Y為O、S或N-R<sup>8</sup>時，R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>中無一者為-OH，且其中當X為O、S或N-R<sup>8</sup>時，R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>中無一者為-OH，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

根據第一態樣之第三實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0、1、2、3或4，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷

基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ，

X、Y獨立地選自由以下組成之群： $CR^6R^7$ 、O、S及 $N-R^8$ ，其中X及Y中之至少一者為 $CR^6R^7$ ，或

X、Y一起形成環成員，該環成員選自由以下組成之群： $-C(O)-O-$ 、 $-C(O)-NR^8-$ 、 $-S(O)-NR^8-$ 、 $-SO_2-NR^8-$ 及 $-SO_2-O-$ ，

G為S、O、 $N-R^8$

$R^1$ 選自由以下組成之群：氫、氰基、 $-CHO$ 、 $-OH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_3$ - $C_6$ 鹵代環烷基、 $C_3$ - $C_4$ 烯基、 $C_3$ - $C_4$ 炔基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、氰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $-NH-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $NH_2-C_1-C_4\text{烷基}-$ 、 $C_1-C_4\text{烷基}-NH-C_1-C_4\text{烷基}-$ 、 $(C_1-C_4\text{烷基})_2N-C_1-C_4\text{烷基}-$ 、 $C_1-C_4\text{烷基}-C(O)-$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基- $C(O)-$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C(O)-$ 、苯甲氧基- $C(O)-$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基- $C(O)-$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ；

苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、

-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)；

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；

-OR<sup>11</sup>；

-SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵

代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ；

雜環基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜

螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及4員至10員雜環烷基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>6</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>7</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>8</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>9</sup>及R<sup>10</sup>獨立地選自由以下組成之群：

氫、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)-(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)<sub>2</sub>P(=O)-；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子

之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基、苯并-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-

OH、氰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{-NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{-NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{-N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基；

雜環基 $\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、側氧基、硫羰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{-NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{-NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{-N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、羥基 $\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基及具有1

至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

氫；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員

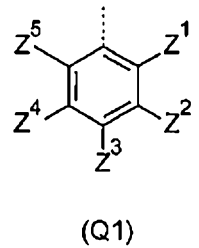
至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷

基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



其中：

Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、4員至6員雜環基，其視情況經1或2個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)，或

Z<sup>1</sup>及Z<sup>2</sup>連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員雜環烷基、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

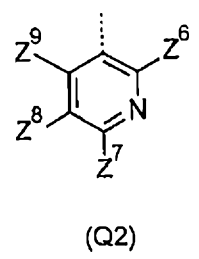
Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，或

Z<sup>2</sup>及Z<sup>3</sup>連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員飽和或部分飽和雜環、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取

代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

$Z^1$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基，或

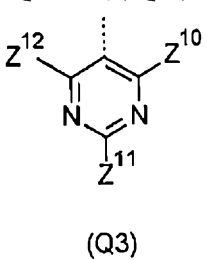
Q為式(Q2)之吡啶環



其中：

$Z^6$ 、 $Z^7$ 、 $Z^8$ 及 $Z^9$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4$ 烷基)、 $-N(C_1-C_4$ 烷基) $_2$ 、 $-NH(C_3-C_6$ 環烷基)、 $-N(C_1-C_4$ 烷基)( $C_3-C_6$ 環烷基)，或

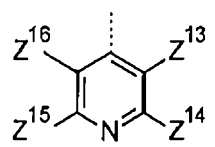
Q為式(Q3)之嘧啶環



其中：

$Z^{10}$ 、 $Z^{11}$ 及 $Z^{12}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4$ 烷基)、 $-N(C_1-C_4$ 烷基) $_2$ 、 $-NH(C_3-C_6$ 環烷基)、 $-N(C_1-C_4$ 烷基)( $C_3-C_6$ 環烷基)，或

Q為式(Q4)之吡啶環

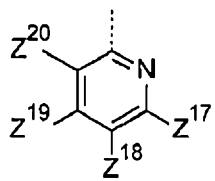


(Q4)

其中：

Z<sup>13</sup>、Z<sup>14</sup>、Z<sup>15</sup>及Z<sup>16</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>羥基烷基、NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NH-CO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及單環雜環，該等單環雜環選自由以下組成之群：4員至7員雜環烷基或具有至少一個氮原子之5員雜芳基，經由該至少一個氮原子該雜芳基環連接至吡啶環，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)，或

Q是式(Q5)之吡啶環

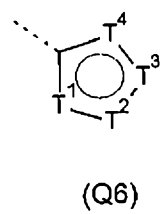


(Q5)

其中：

$Z^{17}$ 、 $Z^{18}$ 、 $Z^{19}$ 及 $Z^{20}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ ，或

Q為式(Q6)之5員芳族雜環



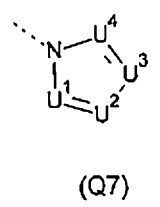
其中：

$T^1$ - $T^4$ 獨立地選自由以下組成之群：N、O、S、 $C-Z^{21}$ 及 $N-Z^{22}$ ，其中 $T^1$ - $T^4$ 中之不超過一者為O， $T^1$ - $T^4$ 中之不超過一者為S， $T^1$ - $T^4$ 中之不超過一者為 $N-Z^{22}$ ，且其中

各 $Z^{21}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，及

各 $Z^{22}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基- $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，或

Q為式(Q7)之5員芳族雜環



其中：

$U^1$ - $U^4$ 獨立地選自由以下組成之群：N及 $C-Z^{23}$ ，其中 $U^1$ - $U^4$ 中之不超過三者為N，且其中

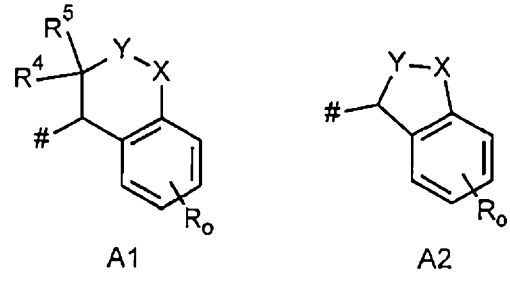
各 $Z^{23}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

其中當Y為O、S或 $N-R^8$ 時， $R^4$ 不為-OH，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

根據第一態樣之第四實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0、1或2，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、氰基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基，

X、Y獨立地選自由以下組成之群： $CR^6R^7$ 、O、S及 $N-R^8$ ，其中X及Y中之至少一者為 $CR^6R^7$ ，

G為S、O、 $N-R^8$

$R^1$ 選自由以下組成之群：氫、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $C_3$ - $C_4$ 烯基、 $C_3$ - $C_4$ 炔基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、氰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^2$ 選自由以下組成之群：

氫、鹵素、氰基、-COOH、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基-C(O)-、-C(O)- $NH_2$ 、-C(O)- $NH(C_1$ - $C_4$  烷基 )、-C(O)- $N(C_1$ - $C_4$  烷基 ) $_2$ 、-C(O)- $NH(C_3$ - $C_6$  環 烷

基)、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ ;

$-\text{NR}^9\text{R}^{10}$ ;

$-\text{OR}^{11}$ ;

$-\text{SR}^{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ ;

$\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_3-\text{C}_6$ 環烷基、 $\text{C}_2-\text{C}_4$ 烯基、 $\text{C}_3-\text{C}_6$ 環烯基、 $\text{C}_2-\text{C}_4$ 炔基或苯基- $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-\text{OH}$ 、氰基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷氧基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、 $-\text{OH}$ 、側氧基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基- $\text{C}(\text{O})-$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷氧基、羥基- $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基-、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷氧基、 $\text{C}_3-\text{C}_6$ 環烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 及4員至10員雜環烷基，

$\text{R}^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $-\text{OH}$ 、氰基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_3-$

C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>5</sup>為氫，

R<sup>6</sup>選自由以下組成之群：氫及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>7</sup>選自由以下組成之群：氫及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>8</sup>選自由以下組成之群：氫及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>9</sup>及R<sup>10</sup>獨立地選自由以下組成之群：

氫、-NH(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)-(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)<sub>2</sub>P(=O)-；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2

或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、-OH、側氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；

苯基、苯并-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、-OH、側氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基；及

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、-OH、側氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；

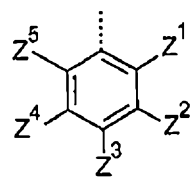
R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

氫；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、4員至6員雜環基，其視情況經1或2個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)，或

Z<sup>1</sup>及Z<sup>2</sup>連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員雜環烷基、5員雜芳

基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

$Z^3$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C(O)-$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基，或

$Z^2$ 及 $Z^3$ 連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員飽和或部分飽和雜環、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

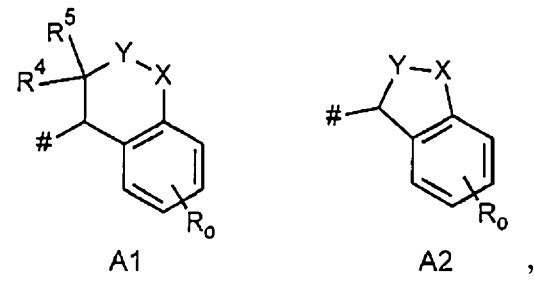
$Z^1$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基，

其中當Y為O、S或N- $R^8$ 時， $R^4$ 不為-OH，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

根據第一態樣之第五實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0或1，

R選自由以下組成之群：鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

X選自由以下組成之群： $CR^6R^7$ 、O、S及N- $R^8$ ，

Y為 $\text{CR}^6\text{R}^7$ ，

G為S、O、N- $\text{R}^8$

$\text{R}^1$ 為氫或 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基，

$\text{R}^2$ 選自由以下組成之群：

氫、鹵素，

$-\text{NR}^9\text{R}^{10}$ ；

$-\text{OR}^{11}$ ；

$-\text{SR}^{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ ；

$\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 環烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$ 烯基或 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 環烯基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}(\text{O})$ -及 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ ；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-\text{OH}$ 、側氧基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基- $\text{C}(\text{O})$ -、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 鹵代烷基、羥基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基-、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基-、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3\text{-}\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基})(\text{C}_3\text{-}\text{C}_6\text{環烷基})$ 及4員至10員雜環烷基，

$\text{R}^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $-\text{OH}$ 、氰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基- $\text{C}(\text{O})$ -、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3\text{-}\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基})(\text{C}_3\text{-}\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{烷基}$ ，

$R^4$ 選自由以下組成之群：氫、-OH及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^5$ 為氫，

$R^6$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^7$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^8$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^9$ 及 $R^{10}$ 獨立地選自由以下組成之群：

氫、-NH(-C(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基)、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

$C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-COOH、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-NH-C(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、-NH<sub>2</sub>、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-S- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-SO<sub>2</sub>- $C_1$ - $C_4$ 烷基及( $C_1$ - $C_4$ 烷氧基)<sub>2</sub>P(=O)-；

雜環基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、-OH、側氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

苯基及苯并- $C_5$ - $C_6$ 環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5

員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、側氧基、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基；及

4員至10員雜環烷基，

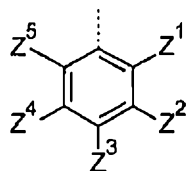
R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

氫；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：-OH及-COOH；及

6員雜芳基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個

鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及4員至6員雜環烷基，及

Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>，

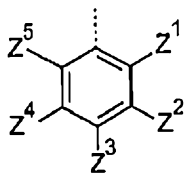
Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

本發明之另一態樣涵蓋上述通式(I)化合物，其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及R<sup>3</sup>具有如上述實施例中之任一者所定義之含義且

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

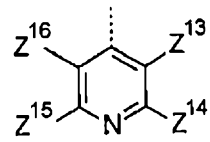
Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及4員至6員雜環烷基，及

Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>，

Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

Q為式(Q4)之吡啶環

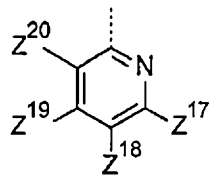


(Q4)

其中：

Z<sup>13</sup>、Z<sup>14</sup>、Z<sup>15</sup>及Z<sup>16</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>羥基烷基、NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH-CO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及單環雜環，該等單環雜環選自由以下組成之群：4員至7員雜環烷基或具有至少一個氮原子之5員雜芳基，該雜芳基環經由該氮原子連接至吡啶環，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)，或

Q是式(Q5)之吡啶環



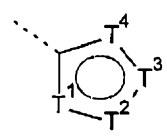
(Q5)

其中

Z<sup>17</sup>、Z<sup>18</sup>及Z<sup>19</sup>為氫，及

$Z^{20}$ 為鹵素，或

Q為式(Q6)之5員芳族雜環



(Q6)

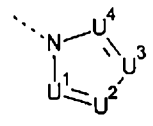
其中：

$T^1$ - $T^4$ 獨立地選自由以下組成之群： $N$ 、 $O$ 、 $S$ 、 $C-Z^{21}$ 及 $N-Z^{22}$ ，其中 $T^1$ - $T^4$ 中之不超過一者為 $O$ ， $T^1$ - $T^4$ 中之不超過一者為 $S$ ， $T^1$ - $T^4$ 中之不超過一者為 $N-Z^{22}$ ，且其中

各 $Z^{21}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，及

各 $Z^{22}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基- $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，或

Q為式(Q7)之5員芳族雜環



(Q7)

其中：

$U^1$ - $U^4$ 獨立地選自由以下組成之群： $N$ 及 $C-Z^{23}$ ，其中 $U^1$ - $U^4$ 中之不超過三者為 $N$ ，且其中

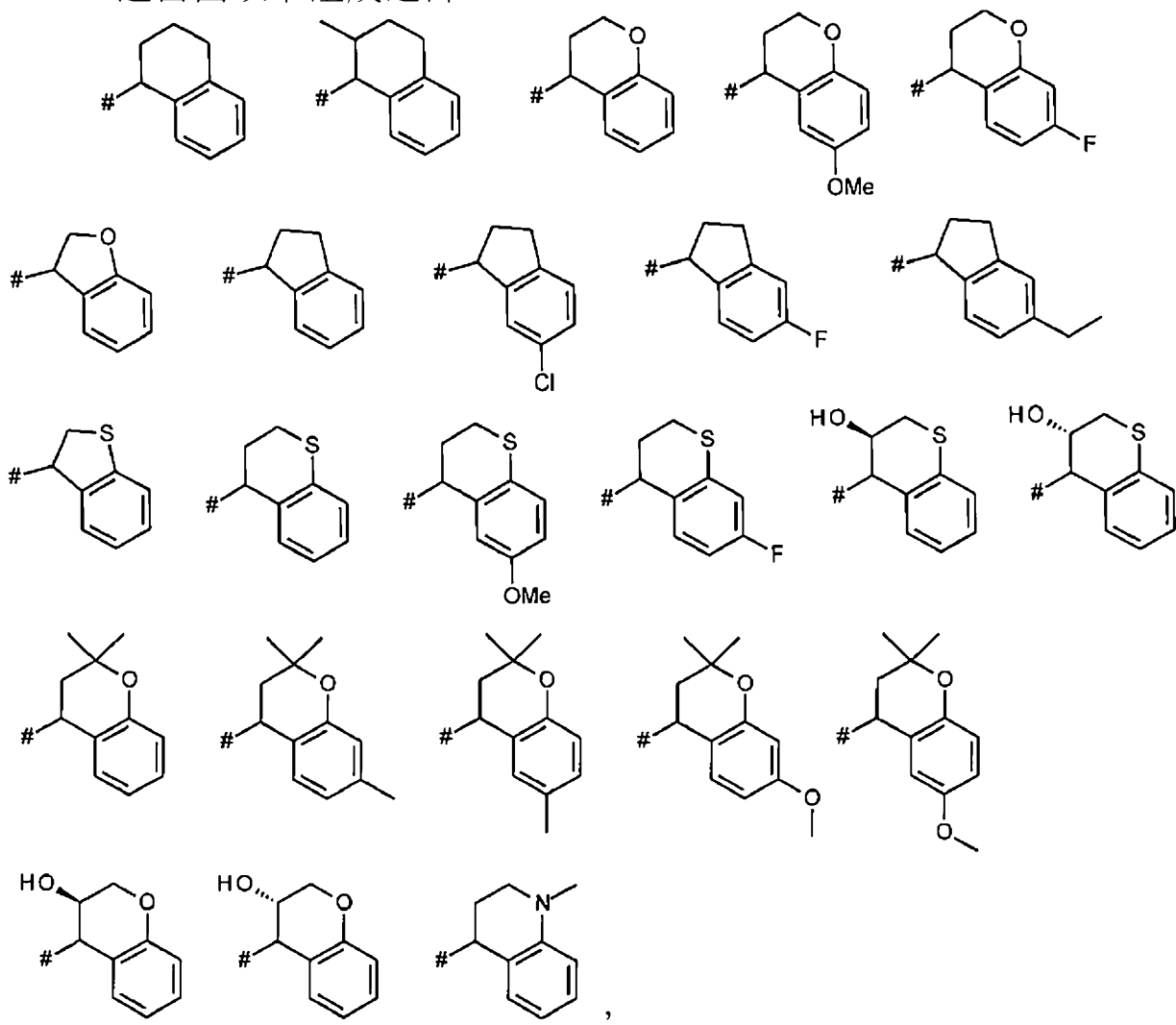
各 $Z^{23}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

及其立體異構體、互變異構體、 $N$ -氧化物、水合物、溶劑合物及

鹽，及其混合物。

根據第一態樣之第六實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

A選自由以下組成之群：



G為S、O、N-R<sup>8</sup>

R<sup>1</sup>為氫或甲基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；

-OR<sup>11</sup>；

$-\text{SR}^{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ ；

甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、環己基、丙烯基、環戊烯基、環己烯基，其中之每一者視情況經1或2個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氰基、乙氧基- $\text{C}(\text{O})$ -及 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：氮雜環丁烷、吡咯啉、吡唑啉、咪唑啉、1,2,4-三唑啉、哌啉、哌嗪、四氫吡啉、二氫-2H-哌喃、1,2-噁唑啉、1,2-噁嗪、嗎啉、硫代嗎啉、3,4-二氫異喹啉、2,3-二氫-吲哚、1,3-二氫-異吲哚、3,9-二氧雜-7-氮雜雙環[3.3.1]壬烷、6-氧雜-3-氮雜雙環[3.1.1]庚烷、8-氧雜-3-氮雜雙環[3.2.1]辛烷、咪唑、吡唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、4-氧雜-7-氮雜螺[2.5]辛烷，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代其獨立地選自由以下組成之群：氟、氯、氰基、 $-\text{OH}$ 、側氧基、 $-\text{COOH}$ 、甲氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、乙氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、第三丁氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、甲基、甲氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、三氟甲基、羥甲基-、甲氧基甲基-、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NMe}_2$ 、吡咯啉，

$\text{R}^3$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基及三氟甲基，

$\text{R}^8$ 選自由以下組成之群：氫及甲基，

$\text{R}^9$ 及 $\text{R}^{10}$ 獨立地選自由以下組成之群：

氫、 $-\text{NH}(\text{C}(\text{O})\text{甲基})$ 、甲氧基；

甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、環丙基、環丁基、苯甲基、1-苯乙基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{COOH}$ 、甲氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、乙氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、第三丁氧基- $\text{C}(\text{O})$ -、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $-\text{NH}\text{C}(\text{O})$ -

甲基、甲氧基、環丙基、 $-\text{NH}_2$ 、 $\text{NMe}_2$ 、S-甲基、 $\text{S}(\text{O})$ -甲基、 $\text{SO}_2$ -甲基及 $(\text{EtO})_2\text{P}(=\text{O})-$ ；

雜環基-甲基、雜環基-乙基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：吡咯啉、嗎啉、吡唑、1,2,4-噁二唑、吡啶，其中之每一者視情況經1個取代基取代，該取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、氯、 $-\text{OH}$ 、側氧基及甲基；

苯基；

2,3-二氫-1H-茚，及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：氧雜環丁烷、硫雜環丁烷、吡咯啉、嗎啉、四氫吡喃、吡啶及吡唑，其中之每一者視情況經1或2個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、氯、 $-\text{OH}$ 、側氧基、甲基；

$\text{R}^{11}$ 選自由以下組成之群：

甲基、乙基、異丙基、丁基、環戊基、苯甲基，其中之每一者視情況經1或2個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、 $-\text{OH}$ 、甲基、甲氧基及環戊基；及

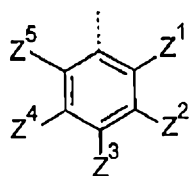
單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：吡咯啉及四氫吡喃，

$\text{R}^{12}$ 選自由以下組成之群：

甲基及乙基，其中之每一者視情況經1個取代基取代，該取代基獨立地選自由以下組成之群： $-\text{OH}$ 及 $-\text{COOH}$ ；及

吡啶，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

$Z^1$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

$Z^2$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-NH( $C_3$ - $C_6$ 環烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)( $C_3$ - $C_6$ 環烷基)、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、-S-( $C_1$ - $C_4$ 烷基)及4員至6員雜環烷基，及

$Z^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)及-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>，

$Z^4$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

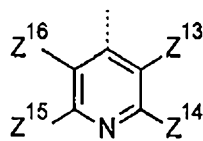
$Z^5$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

根據第一態樣之第七實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

G、A、 $R^1$ 、 $R^2$ 及 $R^3$ 具有如上述第一態樣之第六實施例所定義之含義，且其中

Q為式(Q4)之吡啶環

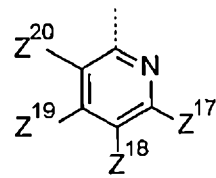


(Q4)

其中：

$Z^{13}$ 、 $Z^{14}$ 、 $Z^{15}$ 及 $Z^{16}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、異丙氧基、羥基甲基、 $NH_2$ 、-NHMe-NMe<sub>2</sub>、-NH-C(O)-Me、嗎啉基，或

Q是式(Q5)之吡啶環



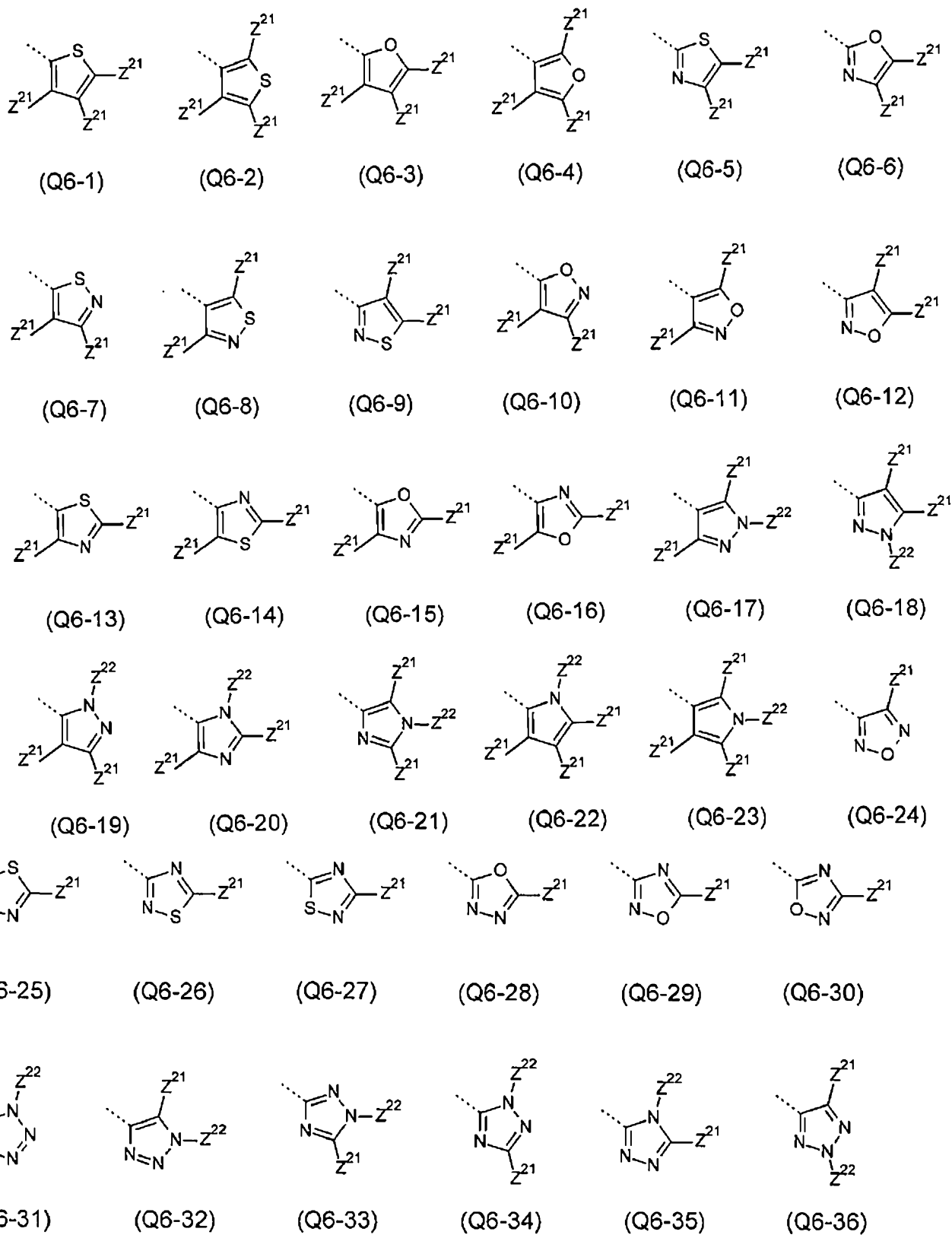
(Q5)

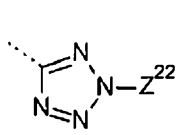
其中：

$Z^{17}$ 、 $Z^{18}$ 及 $Z^{19}$ 為氫，及

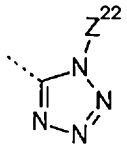
$Z^{20}$ 為氟、氯，或

Q選自由以下組成之群：





(Q6-37)



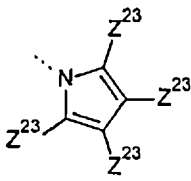
(Q6-38)

其中：

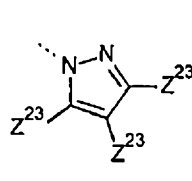
各 $Z^{21}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基及

$Z^{22}$ 為氫、甲基，或

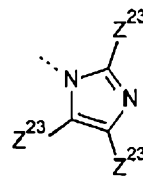
Q選自由以下組成之群：



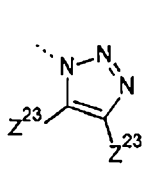
(Q7-1)



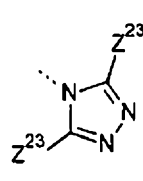
(Q7-2)



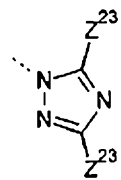
(Q7-3)



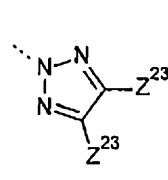
(Q7-4)



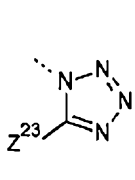
(Q7-5)



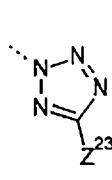
(Q7-6)



(Q7-7)



(Q7-8)

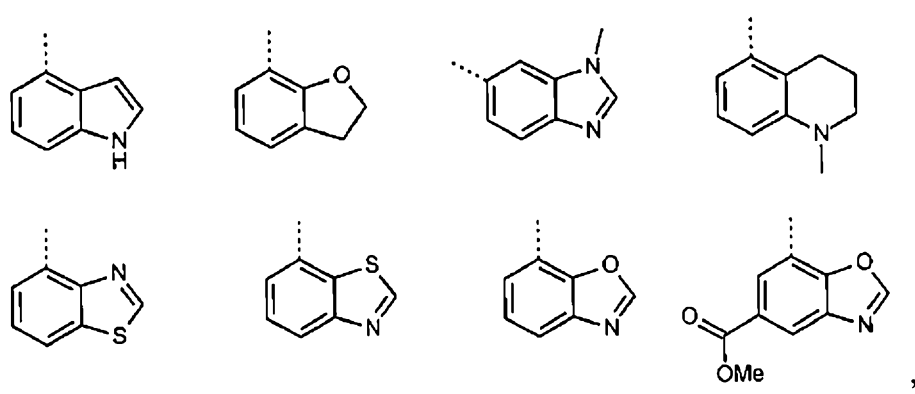


(Q7-9)

其中：

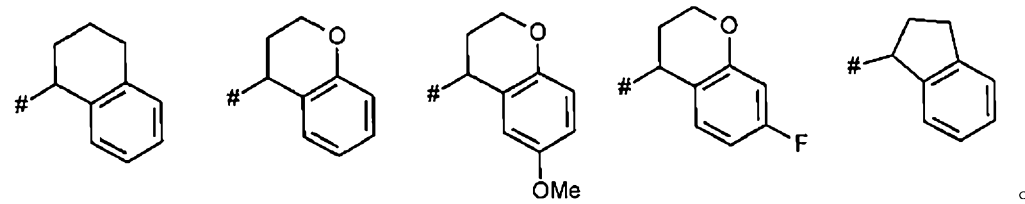
各 $Z^{23}$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基，或

Q選自由以下組成之群：

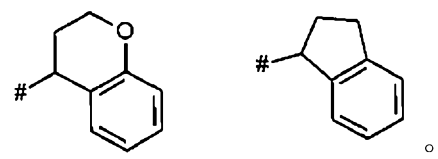


及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在上述本發明之第一態樣之第六及第七實施例的替代實施例中，A選自由以下組成之群：

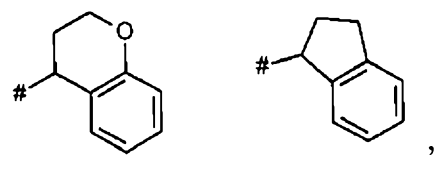


在上述本發明之第一態樣之第六及第七實施例的另一替代性實施例中，A選自由以下組成之群：



根據第一態樣之第八實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

A選自由以下組成之群：



G為S、O、NH或N-CH<sub>3</sub>

R<sup>1</sup>為氫或甲基，

$R^2$ 選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

$-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ ，

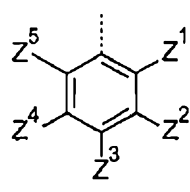
甲氧基、乙氧基，

甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基，

三氟甲基及三氟甲氧基，

$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、氯、氟、甲基、甲氧基及三氟甲基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

$Z^1$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

$Z^2$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、 $-OH$ 、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、三氟甲基、三氟甲氧基，

$Z^3$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基、甲氧基、 $-NH(CH_3)$ 及 $-N(CH_3)_2$ ，

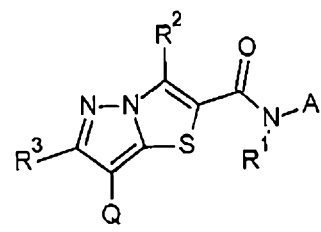
$Z^4$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

$Z^5$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

根據第一態樣之第九實施例，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中：

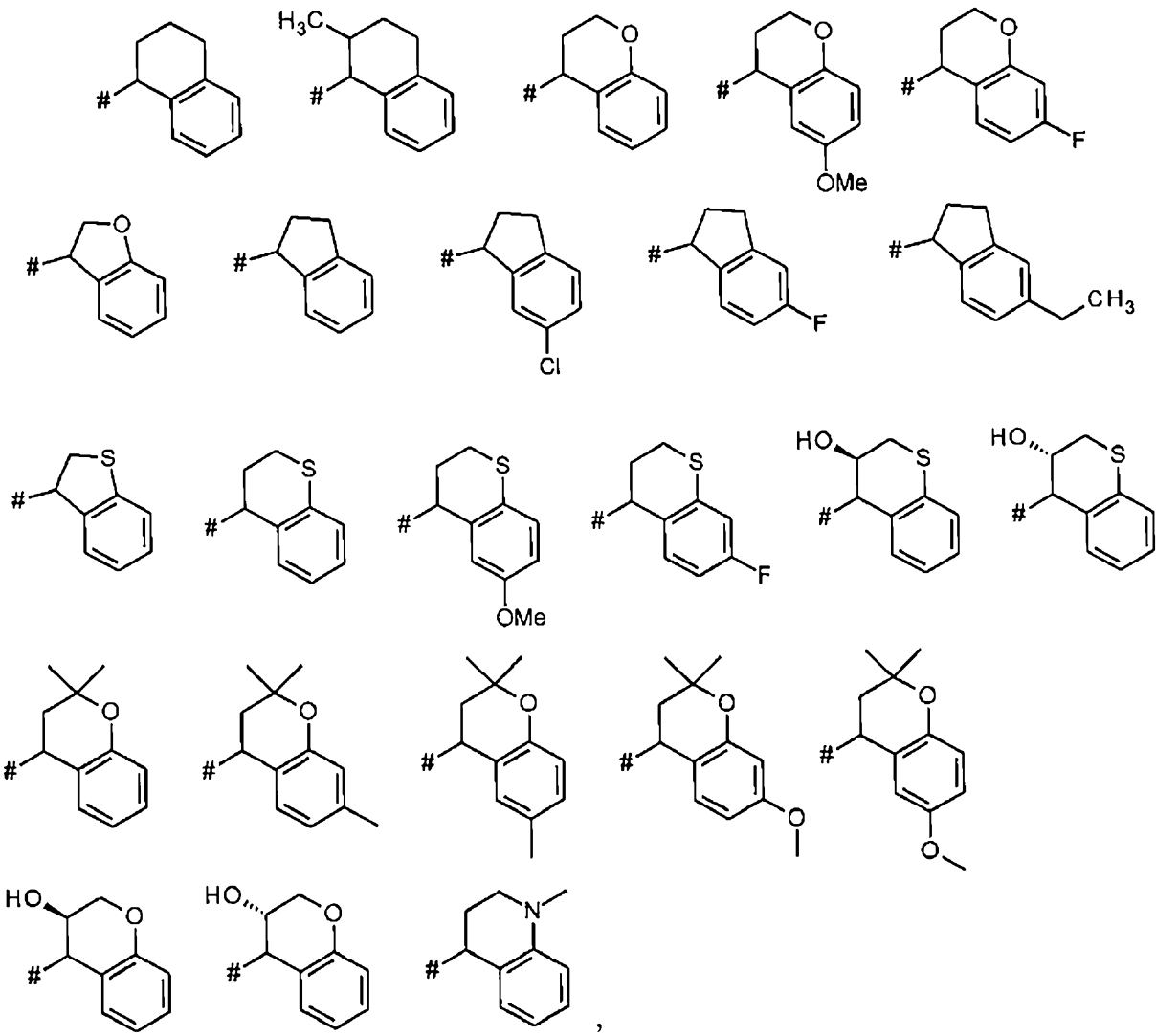
G為S，形成通式(II)化合物



(II)

其中

A選自由以下組成之群：

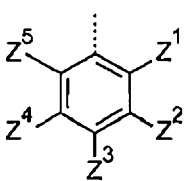


R<sup>1</sup>為氫或甲基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

甲氧基，  
甲基、乙基、丙基、異丙基，  
三氟甲基及三氟甲氧基，  
 $R^3$ 選自由以下組成之群：氫、氯、氟、甲基、甲氧基及三氟甲基，  
Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：  
 $Z^1$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

$Z^2$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-NH( $C_3$ - $C_6$ 環烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)( $C_3$ - $C_6$ 環烷基)、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、-S-( $C_1$ - $C_4$ 烷基)及4員至6員雜環烷基，及

$Z^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)及-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>，

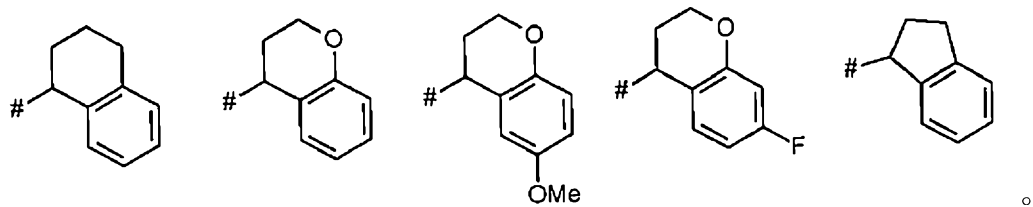
$Z^4$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

$Z^5$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

根據第一態樣之第十實施例，本發明涵蓋上述通式(II)化合物，其中：

A選自由以下組成之群：



R<sup>1</sup>為氫或甲基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

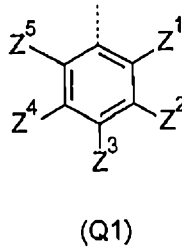
甲氧基，

甲基、乙基、丙基、異丙基，

三氟甲基及三氟甲氧基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、氯、氟、甲基、甲氧基及三氟甲基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、具有1至5個鹵素原子之-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

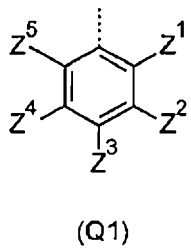
Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在上述本發明之第一態樣之第九及第十實施例的一替代性實施例中，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及4員至6員雜環烷基，及

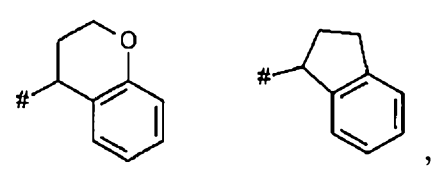
Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>，

Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基。

根據第一態樣之第十一實施例，本發明涵蓋上述通式(II)化合物，其中：

A選自由以下組成之群：

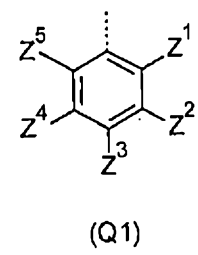


R<sup>1</sup>為氫，

R<sup>2</sup>為異丙基，

R<sup>3</sup>為甲基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



其中：

Z<sup>1</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、氟及氯，以及

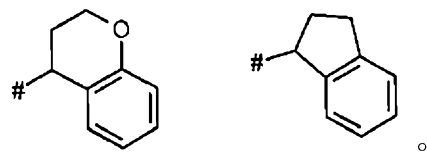
Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、三氟甲基及三氟甲氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

本發明之第一態樣之其他實施例：

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

A選自由以下組成之群：



R<sup>1</sup>為氫或甲基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

-NH<sub>2</sub>、-NH(CH<sub>3</sub>)、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，

甲氧基、乙氧基，

甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基，

三氟甲基及三氟甲氧基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、氯、氟、甲基、甲氧基及三氟甲基，

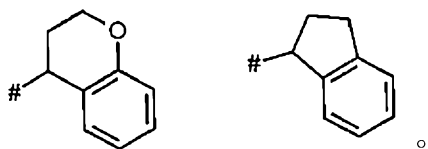
Q選自由以下組成之群：苯基、2,3,4-三氟苯基、2,3,4-三氯苯基、2,3,5-三氯苯基、2,3,5-三氟苯基、2,3,6-三氟苯基、2,3,6-三氯苯基、2,3-二氟苯基、2,3-二氯苯基、2,4,5-三氟苯基、2,4,5-三氯苯基、2,4,6-三氟苯基、2,4,6-三氯苯基、2,4,6-三氟-3-甲氧基苯基、2,4,6-三氯-3-甲氧基苯基、2,4-二氟-3-羥苯基、2,4-二氯-3-羥苯基、2,4-二氟-3-甲氧基苯基、2,4-二氯-3-甲氧基苯基、2,4-二氟-3-(二甲胺基)苯基、2,4-二氯-3-(二甲胺基)苯基、2,5-二氟-4-甲氧基苯基、2,5-二氯-4-甲氧基苯基、2,6-二氟苯基、2,6-二氯苯基、2-氟-3-氯苯基、2-氯-3-氟苯基、2-氟-3-(二甲胺基)苯基、2-氯-3-(二甲胺基)苯基、2-氯-4-氟苯基、2-氟-4-氯苯基、2-氯-5-氟苯基、2-氟-4-(二甲胺基)苯基、2-氯-4-(二甲胺基)苯基、2-氯-6-氟苯基、2-氟苯基、2-氯苯基、2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基、2-氯-3-(三氟甲氧基)苯基、2-氟-3-(三氟甲基)苯基、2-氯-3-(三氟甲基)苯基、3-(二甲胺基)苯基、3-(甲胺基)苯基、3-(三氟甲氧基)苯基、3,4,5-三氟苯基、3,4,5-三氯苯基、3,4-二氟-5-(二甲胺基)苯基、3,4-二氯-5-(二甲胺基)苯基、3,4-二氟苯基、3,4-二氯苯基、3,4-二氟-2-甲氧基苯基、3,4-二氯-2-甲氧基苯基、3,5-二氟-4-(二甲胺基)苯基、3,5-二氯-4-(二甲胺基)苯基、3,5-二氟-4-氯苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、3,5-二氟苯基、3,5-二氯苯基、3,5-二甲基苯基、3-氟-2-氯-5-甲基苯基、3-氯-2-氟-5-甲基苯基、3-氯-2-甲基苯基、3-氟-4-(二甲胺基)-5-氯苯基、3-氟-4-(二甲胺基)苯基、3-氯-4-(二甲胺基)苯基、3-氯-4-氟苯基、3-氟-4-甲基苯基、3-氯-4-甲基苯基、3-氟-5-(二甲胺基)苯基、3-氯-5-(二甲胺基)苯基、3-氟-5-(甲基磺醯基)苯基、3-氯-5-(甲基磺醯基)苯基、3-氟-5-(嗎啉-4-基)苯基、3-氯-5-(嗎啉-4-基)

苯基、3-氟-5-(三氟甲基)苯基、3-氯-5-(三氟甲基)苯基、3-氟-5-乙基苯基、3-氯-5-乙基苯基、3-氯-5-氟苯基、3-氟-5-甲氧基苯基、3-氯-5-甲氧基苯基、3-氟-5-甲基苯基、3-氟苯基、3-氯苯基、3-氟-4-甲氧基苯基、3-氯-4-甲氧基苯基、3-氟-5-甲基苯基、3-氯-5-甲基苯基、4-氟-3-(二甲胺基)苯基、4-氯-3-(二甲胺基)苯基、4-氟-3-甲氧基苯基、4-氯-3-甲氧基苯基、5-氯-2,4-二氟苯基、5-氟-2,4-二氯苯基、5-氟-2-氯-3-甲基苯基、5-氯-2-氟-3-甲基苯基、5-氟-2-氯-4-甲基苯基、5-氯-2-氟-4-甲基苯基、5-氯-2-氟苯基、5-氯-2-甲氧基苯基及5-氟-2-甲氧基苯基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

A選自由以下組成之群：



$R^1$ 為氫或甲基，

$R_2$ 為氫或異丙基，

$R^3$ 為氫或甲基，

Q選自由以下組成之群：苯基、2,3,4-三氟苯基、2,3,5-三氯苯基、2,3-二氯苯基、2,4-二氟-3-(二甲胺基)苯基、2,6-二氯苯基、2-氟-3-(二甲胺基)苯基、2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基、2-氟-3-(三氟甲基)苯基、2-氯-3-(三氟甲基)苯基、3,4-二氟苯基、3,4-二氯苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、3,5-二氯苯基，

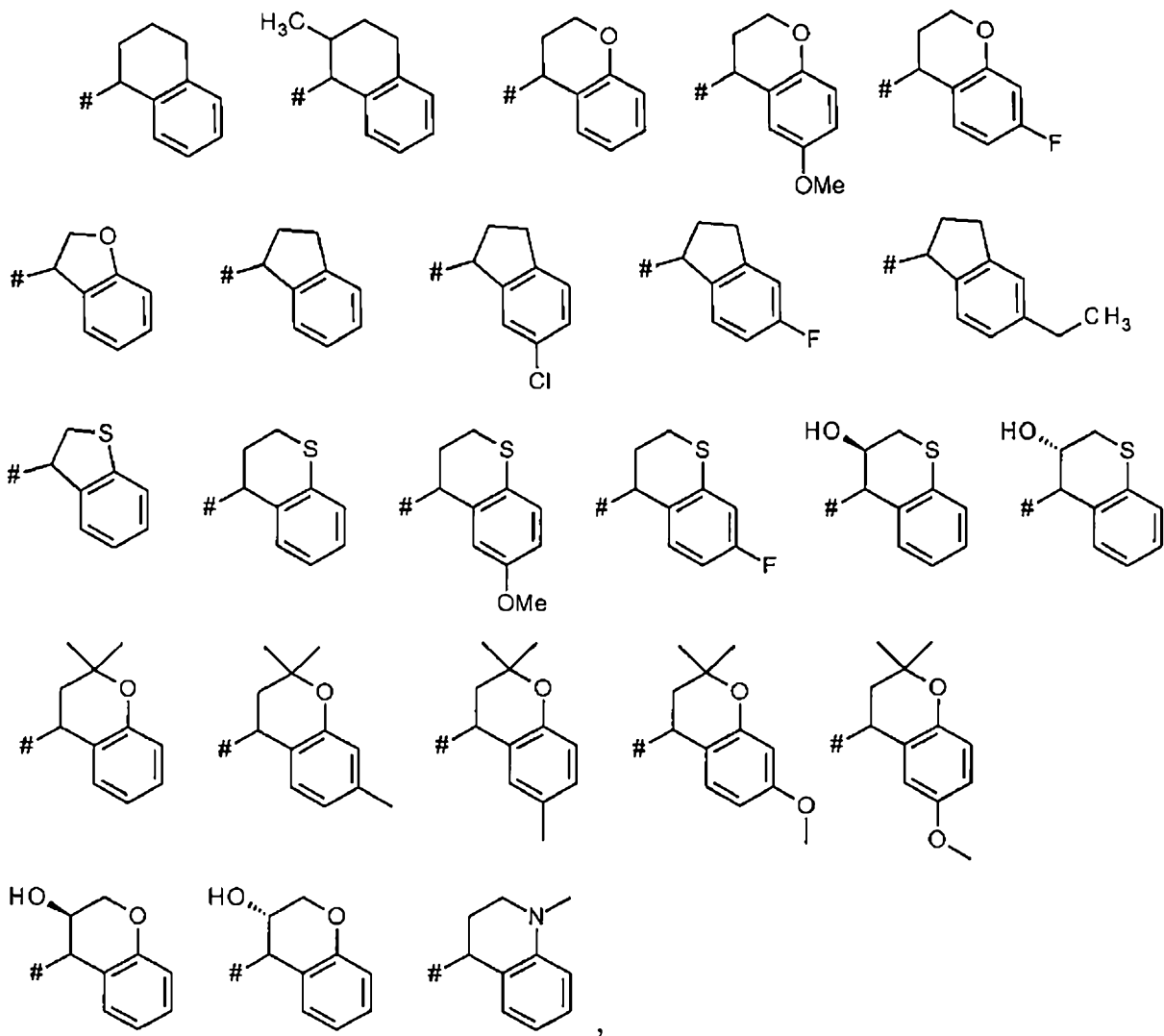
及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及

鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)化合物，其中G為S，及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶合物及鹽及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

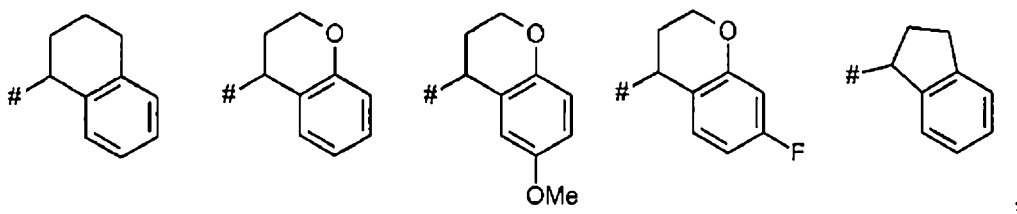
A選自由以下組成之群：



及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

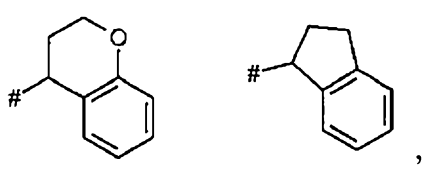
A選自由以下組成之群：



及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

A選自由以下組成之群：



及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

R<sup>1</sup>為氫或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，諸如較佳為甲基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素，

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；

-OR<sup>11</sup>；

-SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下

組成之群：鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C(O)$ -及- $C(O)$ - $NH_2$ ；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、側氧基、-COOH、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C(O)$ -、- $C(O)$ - $NH_2$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基- $C(O)$ -、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、羥基- $C_1$ - $C_4$ 烷基-、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基-、- $NH_2$ 、- $N(C_1$ - $C_4$ 烷基) $_2$ 、- $NH(C_3$ - $C_6$ 環烷基)、- $N(C_1$ - $C_4$ 烷基)( $C_3$ - $C_6$ 環烷基)及4員至10員雜環烷基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

$R^2$ 選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

- $NR^9R^{10}$ ；

- $OR^{11}$ ；

- $SR^{12}$ 、- $S(O)R^{12}$ 、- $SO_2R^{12}$ ；

甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、環己基、丙烯基、環戊烯基、環己烯基，其中之每一者視情況經1或2個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氰基、乙氧基- $C(O)$ -及- $C(O)$ - $NH_2$ ；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：氮雜環丁烷、吡咯啉、吡唑啉、咪唑啉、1,2,4-三唑啉、哌啉、哌嗪、四氫吡啉、二氫-2H-哌喃、1,2-噁唑啉、1,2-噁嗪、嗎啉、硫代嗎啉、3,4-二氫異喹啉、2,3-二氫-吲哚、1,3-二氫-異吲哚、3,9-二氧雜-7-氮雜雙環[3.3.1]壬烷、6-氧雜-3-

氮雜雙環[3.1.1]庚烷、8-氧雜-3-氮雜雙環[3.2.1]辛烷、咪唑、吡唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、4-氧雜-7-氮雜螺[2.5]辛烷，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代其獨立地選自由以下組成之群：氟、氯、氰基、-OH、側氧基、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、第三丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、甲基、甲基-C(O)-、三氟甲基、羥甲基-、甲氧基甲基-、-NH<sub>2</sub>、-NMe<sub>2</sub>、吡咯啉，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素，

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>，

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基，

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，及

具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

-NH<sub>2</sub>、-NH(CH<sub>3</sub>)、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，

甲氧基、乙氧基，

甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基，

三氟甲基及三氟甲氧基，

其中 $R^2$ 較佳選自由以下組成之群：氫及異丙基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

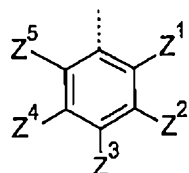
$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、氯、氟、甲基、甲氧基及三氟甲基，

其中 $R^3$ 較佳選自由以下組成之群：氫及甲基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

$Z^1$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

$Z^2$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-NH( $C_3$ - $C_6$ 環烷基)、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)( $C_3$ - $C_6$ 環烷基)、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、-S-( $C_1$ - $C_4$ 烷基)及4員至6員雜環烷基，及

$Z^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-NH( $C_1$ - $C_4$ 烷基)及-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>，

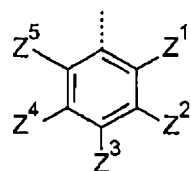
$Z^4$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

$Z^5$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

$Z^1$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

$Z^2$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、-OH、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、-NH(CH<sub>3</sub>)、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、三氟甲基、三氟甲氧基，

$Z^3$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基、甲氧基、-NH(CH<sub>3</sub>)及-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，

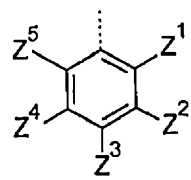
$Z^4$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

$Z^5$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、氟及氯，

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、三氟甲基及三氟甲氧基，

Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、氟及氯，

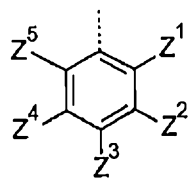
Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、氟及氯，

Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、氟及氯，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、氟及氯，以及

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、三氟甲基及三氟甲氧基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

Q選自由以下組成之群：苯基、2,3,4-三氟苯基、2,3,4-三氯苯基、2,3,5-三氯苯基、2,3,5-三氟苯基、2,3,6-三氟苯基、2,3,6-三氯苯基、2,3-二氟苯基、2,3-二氯苯基、2,4,5-三氟苯基、2,4,5-三氯苯基、2,4,6-三氟苯基、2,4,6-三氯苯基、2,4,6-三氟-3-甲氧苯基、2,4,6-三氯-3-甲氧苯基、2,4-二氟-3-羥苯基、2,4-二氯-3-羥苯基、2,4-二氟-3-甲氧苯基、2,4-二氯-3-甲氧苯基、2,4-二氟-3-(二甲胺基)苯基、2,4-二氯-3-(二甲胺基)苯基、2,5-二氟-4-甲氧苯基、2,5-二氯-4-甲氧苯基、2,6-二氟苯基、2,6-二氯苯基、2-氟-3-氯苯基、2-氯-3-氟苯基、2-氟-3-(二甲胺基)苯基、2-氯-3-(二甲胺基)苯基、2-氯-4-氟苯基、2-氟-4-氯苯基、2-氯-5-氟苯基、2-氟-4-(二甲胺基)苯基、2-氯-4-(二甲胺基)苯基、2-氯-6-氟苯基、2-氟苯基、2-氯苯基、2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基、2-氯-3-(三氟甲氧基)苯基、2-氟-3-(三氟甲基)苯基、2-氯-3-(三氟甲基)苯基、3-(二甲胺基)苯基、3-(甲胺基)苯基、3-(三氟甲氧基)苯基、3,4,5-三氟苯基、3,4,5-三氯苯基、3,4-二氟-5-(二甲胺基)苯基、3,4-二氯-5-(二甲胺基)苯基、3,4-二氟苯基、3,4-二氯苯基、3,4-二氟-2-甲氧苯基、3,4-二氯-2-甲氧苯基、3,5-二氟-4-(二甲胺基)苯基、3,5-二氯-4-(二甲胺基)苯基、3,5-二氟-4-氯苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、3,5-二氟苯基、3,5-二氯苯基、3,5-二甲基苯基、3-氟-2-氯-5-甲基苯基、3-氯-2-氟-5-甲基苯基、3-氯-2-甲基苯基、3-氟-4-(二甲胺基)-5-氯苯基、3-氟-4-(二甲胺基)苯基、3-氯-4-(二甲胺基)苯基、3-氯-4-氟苯基、3-氟-4-甲基苯基、3-氯-4-甲基苯基、3-氟-5-(二甲胺基)苯基、3-氯-5-(二甲胺基)苯基、3-氟-5-(甲基磺醯基)苯基、3-氯-5-(甲基磺醯基)苯基、3-氟-5-(嗎啉-4-基)苯基、3-氯-5-(嗎啉-4-基)苯基、3-氟-5-

(三氟甲基)苯基、3-氯-5-(三氟甲基)苯基、3-氟-5-乙基苯基、3-氯-5-乙基苯基、3-氯-5-氟苯基、3-氟-5-甲氧苯基、3-氯-5-甲氧苯基、3-氟-5-甲基苯基、3-氟苯基、3-氯苯基、3-氟-4-甲氧苯基、3-氯-4-甲氧苯基、3-氟-5-甲基苯基、3-氯-5-甲基苯基、4-氟-3-(二甲胺基)苯基、4-氯-3-(二甲胺基)苯基、4-氟-3-甲氧苯基、4-氯-3-甲氧苯基、5-氯-2,4-二氟苯基、5-氟-2,4-二氯苯基、5-氟-2-氯-3-甲基苯基、5-氯-2-氟-3-甲基苯基、5-氟-2-氯-4-甲基苯基、5-氯-2-氟-4-甲基苯基、5-氯-2-氟苯基、5-氯-2-甲氧苯基及5-氟-2-甲氧苯基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

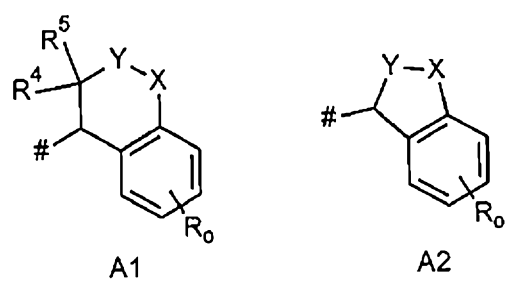
在另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

Q選自由以下組成之群：苯基、2,3,4-三氟苯基、2,3,5-三氯苯基、2,3-二氯苯基、2,4-二氟-3-(二甲胺基)苯基、2,6-二氯苯基、2-氟-3-(二甲胺基)苯基、2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基、2-氟-3-(三氟甲基)苯基、2-氯-3-(三氟甲基)苯基、3,4-二氟苯基、3,4-二氯苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、3,5-二氯苯基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在第一態樣之另一實施例中，本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0、1或2，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

G為S、O、NH或N-CH<sub>3</sub>，

X、Y獨立地選自由以下組成之群：CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>及O，其中X及Y中之至少一者為CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>，

R<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，及

R<sup>5</sup>為氫，

R<sup>6</sup>選自由以下組成之群：氫及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

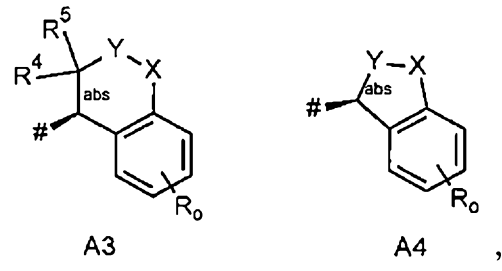
R<sup>7</sup>選自由以下組成之群：氫及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

其中當Y為O時，R<sup>4</sup>不為-OH，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在第一態樣之另一實施例中，本發明涵蓋上述式(I)化合物，其中：

A為A3或A4



及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

在第一態樣之另一特定實施例中，本發明涵蓋標題「本發明之第一態樣的其他實施例」下之上述實施例中之兩者或多於兩者的組合。

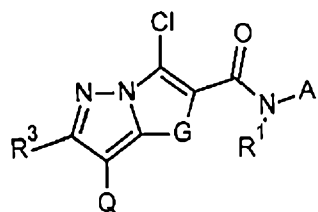
本發明涵蓋上述通式(I)或(II)化合物之本發明之任何實施例或態樣內的任何子組合。

本發明涵蓋下文本文實例部分中所揭示之通式(I)及(II)化合物。

通式(I)及(II)之本發明化合物可根據本發明之實驗部分中所示之流程1製備(通用程序)。所述之流程及程序說明本發明之通式(I)及(II)化合物之合成途徑且不意欲具有限制性。熟習此項技術者顯而易知，可以各種方式修改如流程1中所例示之轉化次序。因此，此等流程中所例示之轉化次序並不意欲為限制性的。另外，可在所例示之轉化之前及/或之後達成取代基Q、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>或R<sup>3</sup>中之任一者之相互轉化。此等修改可為，諸如保護基引入、保護基分裂、官能基還原或氧化、鹵化、金屬化、取代或熟習此項技術者所已知之其他反應。此等轉化包括引入允許取代基進一步相互轉化之官能基的轉化。適當保護基及其引入及裂解為熟習此項技術者所熟知(參見例如 T.W. Greene 及 P.G.M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第3版, Wiley 1999)。特定實例描述於隨後段落中。

在下文中，製備通式(I)化合物之若干途徑描述於流程1中。

根據第二態樣，本發明涵蓋製備如上述所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式1N之中間化合物：



1N

,

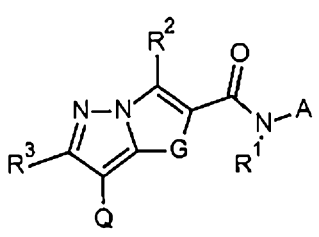
其中  $G$ 、 $A$ 、 $R^1$ 、 $R^3$  及  $Q$  如上述所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，與通式 **1F** 化合物反應：



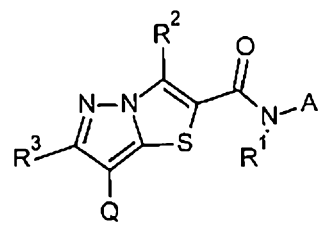
**1F**，

其中  $R^2$  選自由以下組成之群： $-NR^9R^{10}$ 、 $-OR^{11}$  及  $-SR^{12}$ ，其中  $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$  及  $R^{12}$  如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，

由此得到通式(I)化合物，或若  $G$  為通式(II)之  $S$ ：



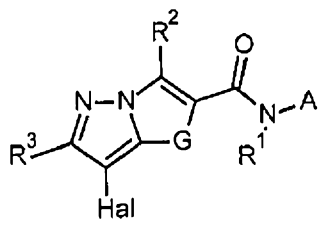
(I)



(II)

其中  $G$ 、 $A$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及  $Q$  如上文所定義。

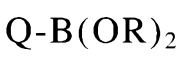
根據第二態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式 **1T** 之中間化合物：



**1T**，

其中  $G$ 、 $A$ 、 $R^1$ 、 $R^2$  及  $R^3$  如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，且其中 Hal 為鹵素，特定言之氯、溴或碘，

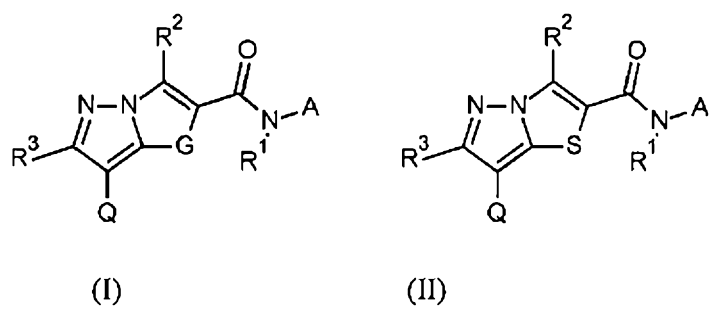
與通式 **1H** 化合物反應：



**1H**，

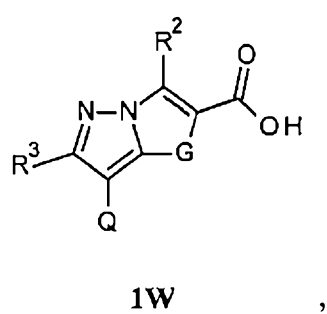
其中Q如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，且各R可個別地為H或Me，或兩個R皆為頻哪醇酯基(pinacolate)，

由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義。

根據第二態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式**1W**之中間化合物：

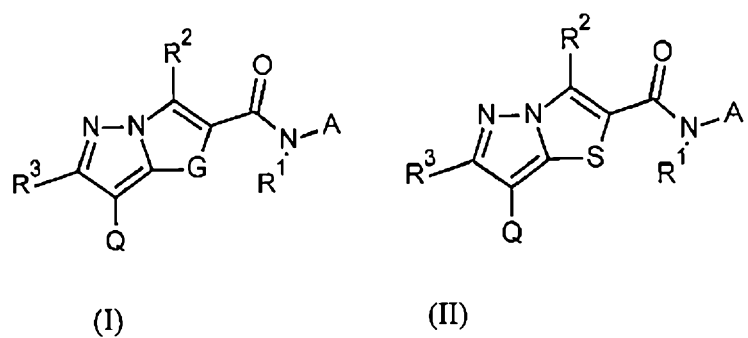


其中G、Q、R<sup>2</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，  
與通式**1M**化合物反應：



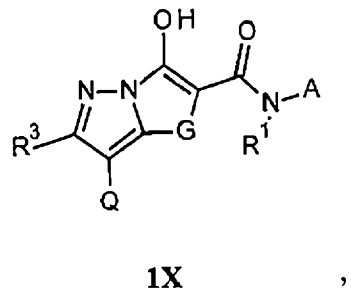
**1M**，

其中R<sup>1</sup>及A如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，  
由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義。

根據第二態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式**1X**之中間化合物：

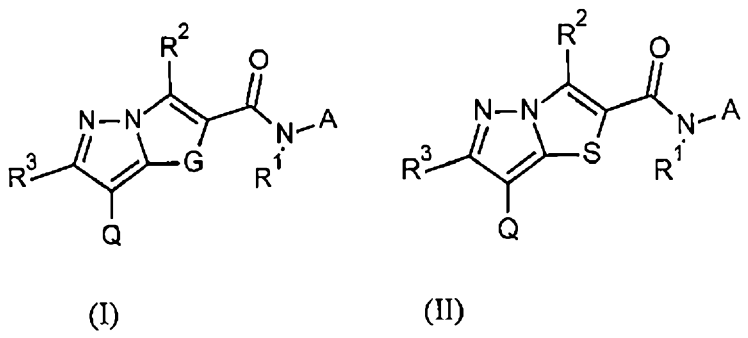


其中G、Q、R<sup>1</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，  
與通式**1Y**化合物反應：



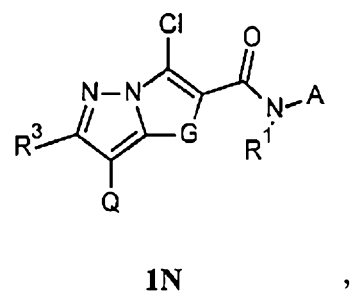
其中R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，其如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義視情況經取代，

由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義且R<sup>2</sup>為如上文所定義視情況經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基。

根據第二態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式1N之中間化合物：



其中G、Q、A、R<sup>1</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，

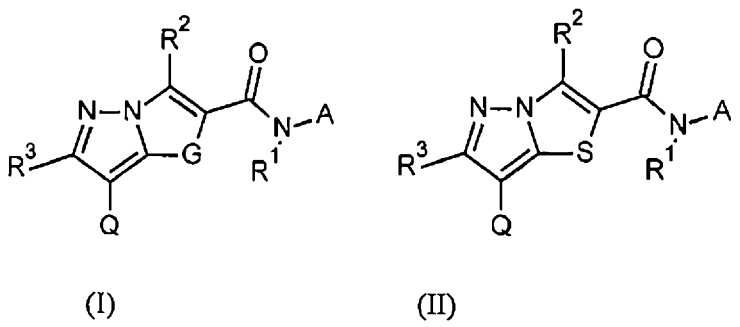
與通式2A化合物反應：



**2A** ,

其中R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義視情況經取代，Met為鎂或鋅，及X為氯、溴或碘，

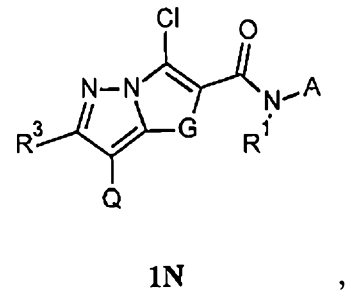
由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義且R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷

基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者如上文所定義視情況經取代。

根據第三態樣，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式**1N**之中間化合物：



其中G、Q、A、R<sup>1</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，

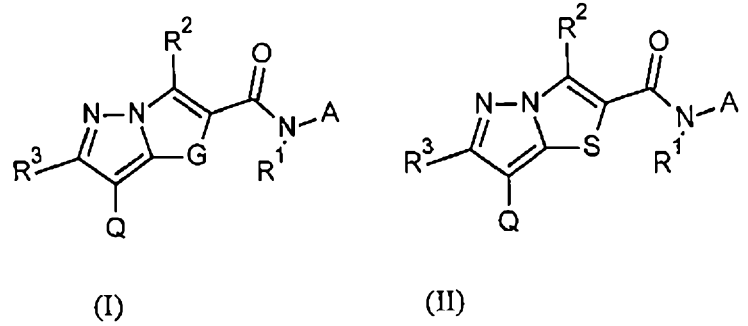
與通式**1F**化合物反應：



**1F** ,

其中R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、-OR<sup>11</sup>及-SR<sup>12</sup>，其中R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>及R<sup>12</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，

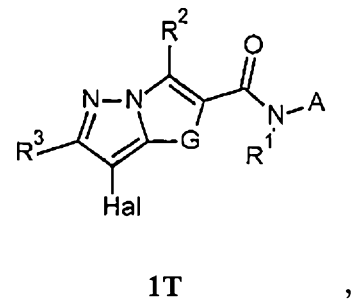
由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義，

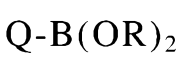
則視情況使用對應(i)溶劑及/或(ii)鹼或酸將該化合物轉化為溶劑合物、鹽及/或此類鹽之溶劑合物。

根據第三態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式**1T**之中間化合物：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，且其中Hal為鹵素，特定言之氯、溴或碘，

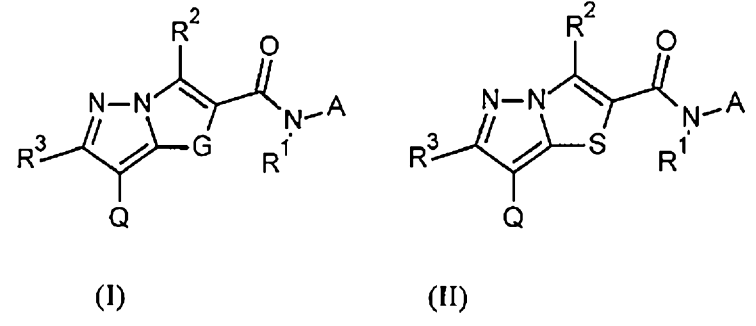
與通式**1H**化合物反應：



**1H** ,

其中Q如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，且各R可個別地為H或Me，或兩個R皆為頻哪醇酯基，

由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：

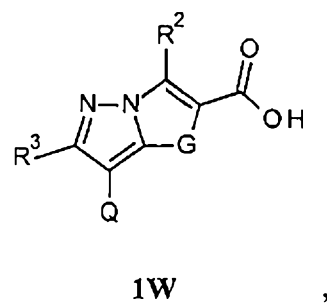


其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義，

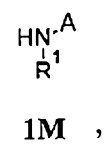
則視情況使用對應(i)溶劑及/或(ii)鹼或酸將該化合物轉化為溶劑合物、鹽及/或此類鹽之溶劑合物。

根據第三態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之

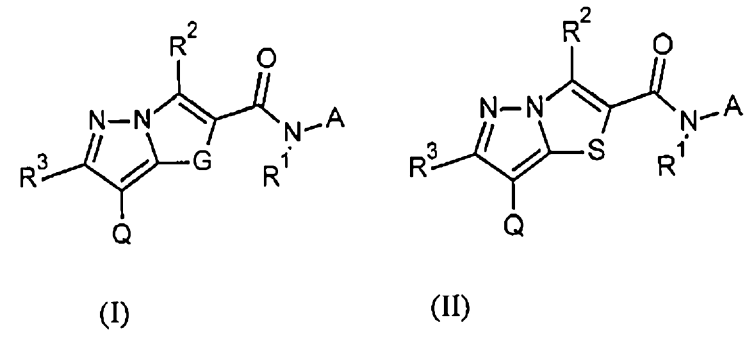
通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式**1W**之中間化合物：



其中G、Q、R<sup>2</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，  
與通式**1M**化合物反應：

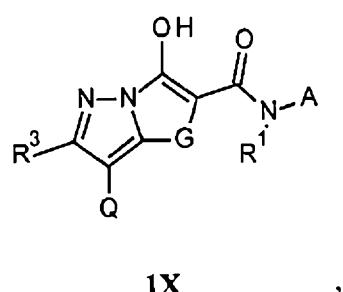


其中R<sup>1</sup>及A如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，  
由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義，  
則視情況使用對應(i)溶劑及/或(ii)鹼或酸將該化合物轉化為溶劑化合物、鹽及/或此類鹽之溶劑化合物。

根據第三態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式**1X**之中間化合物：

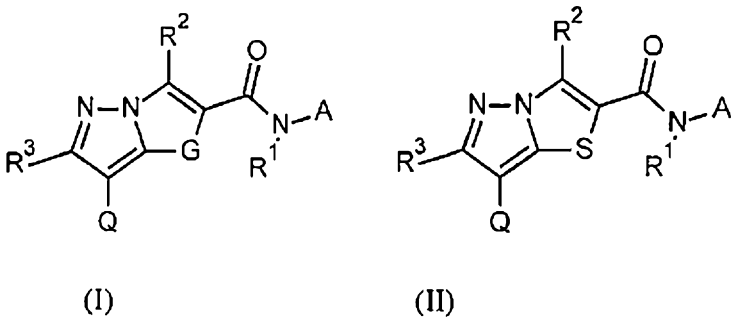


其中G、Q、A、R<sup>1</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，與通式**1Y**化合物反應：



其中R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，其如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義視情況經取代，

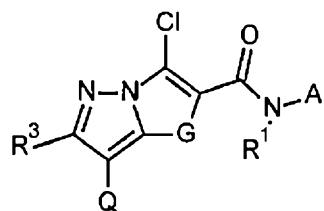
由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義且R<sup>2</sup>為視情況如上文所定義經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

則視情況使用對應(i)溶劑及/或(ii)鹼或酸將該化合物轉化為溶劑合物、鹽及/或此類鹽之溶劑合物。

根據第三態樣之一替代性實施例，本發明涵蓋製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含以下步驟：允許通式**1N**之中間化合物：



1N ,

其中G、Q、A、R<sup>1</sup>及R<sup>3</sup>如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義，

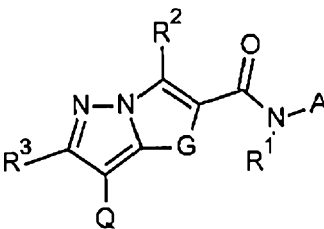
與通式2A化合物反應：



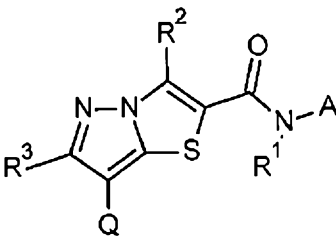
2A，

其中R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者如上文所定義之通式(I)及(II)化合物所定義視情況經取代，Met為鎂或鋅，及X為氯、溴或碘，

由此得到通式(I)化合物，或若G為通式(II)之S：



(I)



(II)

其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及Q如上文所定義且R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者如上文所定義視情況經取代，

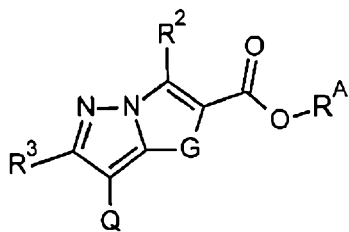
則視情況使用對應(i)溶劑及/或(ii)鹼或酸將該化合物轉化為溶劑合物、鹽及/或此類鹽之溶劑合物。

本發明涵蓋製備本發明之通式(I)及(II)化合物之方法，該等方法包含

如本文實驗部分中所描述之步驟。

根據第四態樣，本發明涵蓋適用於製備上述通式(I)及(II)化合物之中間化合物。

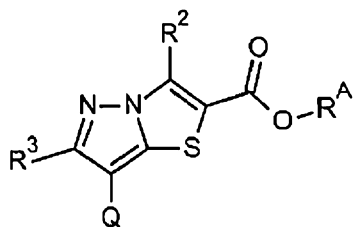
特定言之，本發明涵蓋通式(I-INT)之中間化合物：



(I-INT)

其中G如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

或當G = 通式(II-INT)之S時：



(II-INT)

其中在上述式(I-INT)及(II-INT)中

$R^2$ 選自由以下組成之群： $C_1$ - $C_6$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

Q如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，及

$R^A$ 為H或 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

特定言之，本發明亦涵蓋上述通式(II-INT)之中間化合物，其中  
Q為氫或鹵素，及

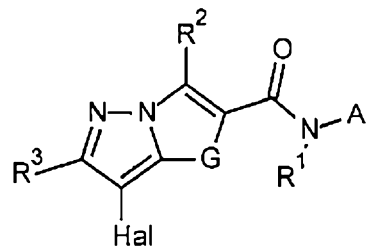
$R^2$ 選自由以下組成之群： $C_1$ - $C_6$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，及

$R^A$ 為H或 $C_1$ - $C_4$ 烷基；

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

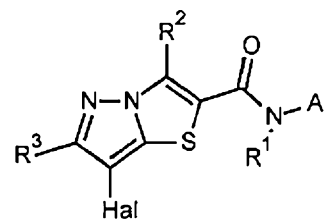
特定言之，本發明亦涵蓋通式(III-INT)之中間化合物：



(III-INT)

其中G如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

或當G = 通式(IV-INT)之S時：



(IV-INT)

其中

Hal為如上文所定義之鹵素，及

$R^2$ 選自由以下組成之群： $C_1$ - $C_6$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基或如關於上述通

式(I)及(II)化合物所定義，

$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，及

$R^1$ 及A如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義；

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

更特定言之，本發明亦涵蓋上述通式(III-INT)或(IV-INT)之中間化合物，其中

Hal為如上文所定義之鹵素，及

$R^2$ 選自由以下組成之群： $C_1$ - $C_6$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，

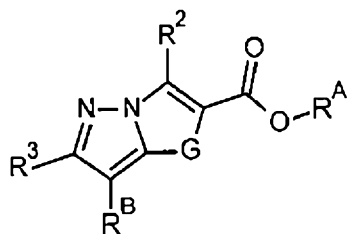
$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，及

$R^1$ 及A如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義；

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

上述中間產物(III-INT)及(IV-INT)中尤其較佳的為根據上述式(IV-INT)之彼等中間產物。

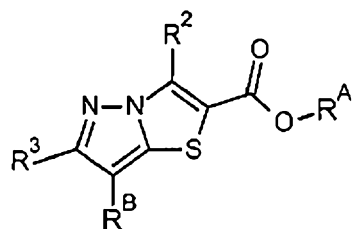
特定言之，本發明亦涵蓋通式(V-INT)之中間化合物：



(V-INT)

其中G如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

或當G = 通式(VI-INT)之S時：



(VI-INT)

其中在上述式(V-INT)及(VI-INT)中

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

R<sup>A</sup>為H或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，及

R<sup>B</sup>為H或鹵素，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

特定言之，本發明亦涵蓋上述通式(VI-INT)之中間化合物，其中

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基或如關於上述通式(I)及(II)化合物所定義，

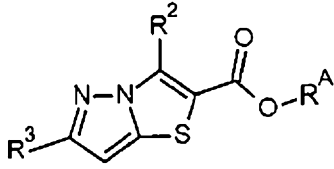
R<sup>A</sup>為H或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，及

R<sup>B</sup>為H或鹵素，

及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物。

極特定言之，本發明亦涵蓋以下中間化合物及其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，及其混合物：

式(VI-INT-1)之中間產物：



(VI-INT-1)

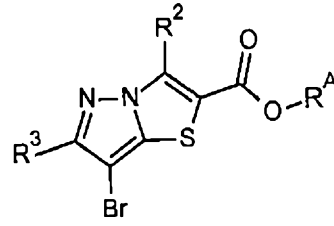
其中

R<sup>A</sup>選自由以下組成之群：甲基、乙基及第三丁基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，及

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基。

式(VI-INT-2)之中間產物：



(VI-INT-2)

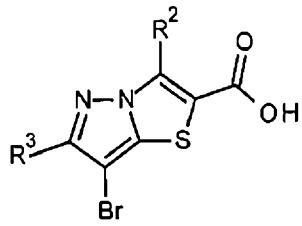
其中

R<sup>A</sup>選自由以下組成之群：甲基、乙基及第三丁基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，及

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基。

式(VI-INT-3)之中間產物：



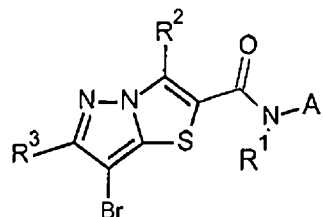
(VI-INT-3)

其中

$R^2$ 選自由以下組成之群： $C_1$ - $C_6$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，及

$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基。

式(IV-INT-1)之中間產物：



(IV-INT-1)

其中

$R^2$ 選自由以下組成之群： $C_1$ - $C_6$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基；

$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，及

A及 $R^1$ 如上文所定義。

根據第五態樣，本發明涵蓋該等中間化合物之用途，其用於製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物。

特定言之，本發明涵蓋上述通式(II-INT)、(IV-INT)及(VI-INT)，更特定言之上述通式(VI-INT-1)、(VI-INT-2)、(VI-INT-3)及(IV-INT-1)之中間化合物之用途，其用於製備如上文所定義之通式(I)及(II)化合物。

本發明涵蓋此文本之下文實例部分中所揭示之中間化合物。

本發明之通式(I)及(II)化合物可藉由熟習此項技術者已知之任何方法轉化為如本文所述之任何鹽，較佳為醫藥學上可接受之鹽。類似地，本發明之通式(I)及(II)化合物之任何鹽可藉由熟習此項技術者已知之任何方法轉換為游離化合物。

本發明之通式(I)及(II)化合物表明尚不可預測到之有價值的藥理學作用範圍。已出人意料地發現本發明之化合物與Sl $\alpha$ -1有效的相互作用，且

因此，該等化合物有可能用於治療或預防疾病，較佳人類及動物之蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染。

本發明之化合物可用以控制、治療及/或預防蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染。此方法包含向有需要之哺乳動物投與一定量之本發明化合物或其醫藥學上可接受之鹽、異構體、多晶型物、代謝物、水合物、溶劑合物或酯；其有效治療病症。

在一替代態樣中，此方法包含向有需要之鳥，亦即籠鳥，或特定言之家禽投與一定量之本發明化合物或其醫藥學上可接受之鹽、異構體、多晶型物、代謝物、水合物、溶劑合物或酯；其有效治療病症。

特定言之，在獸醫學領域中，本發明化合物適用於在溫血動物中在有利毒性下控制出現在動物育種及動物飼養，牲畜、育種、動物園、實驗室、實驗用及家畜動物中之寄生蟲，特定言之蠕蟲。其對寄生蟲，特定言之蠕蟲發育之所有或特定階段具有活性。

農業家畜包括例如哺乳動物，諸如綿羊、山羊、馬、驢、駱駝、水牛、家兔、馴鹿、小鹿，且特定言之家牛及豬；或家禽，諸如火雞、鴨、鵝，且特定言之雞；或魚或甲殼動物，例如水產養殖或視具體情況昆蟲，諸如蜜蜂。

家畜動物包括例如哺乳動物，諸如倉鼠、天竺鼠、大鼠、小鼠、南美栗鼠、雪貂或特定言之犬、貓；籠鳥；爬行動物；兩棲動物或水族箱魚。

本發明亦提供治療蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染之方法。

此等病症已在動物中充分表徵，且可藉由投與本發明之醫藥組合物

治療。

如本文中所用，術語「治療(treating/treatment)」為習知地使用，例如管理或護理個體以達到對抗、減輕、減少、緩解、改良疾病或病症(諸如線蟲感染)之病況之目的。特定言之，且尤其在動物健康狀況或獸醫學領域中，術語「治療」包括預防性、病後調節性(metaphylactic)或治療性治療。

對人類或動物具有致病性之蠕蟲包括例如棘頭蟲(acanthocephala)、線蟲、舌形蟲(pentastoma)及扁形蟲(platyhelmintha)(例如單生蟲(monogenea)、條蟲及吸蟲)。

例示性蠕蟲包括(但不限於)：

單殖蟲：例如指環蟲屬(Dactylogyrus spp.)、三代蟲屬(Gyrodactylus spp.)、小盤蟲屬(Microbothrium spp.)、多盤蟲屬(Polystoma spp.)、穴頭蟲屬(Troglocephalus spp.)

條蟲：來自假葉目綱(the order of the Pseudophyllidea)，例如：溝槽條蟲屬(Bothridium spp.)、裂頭條蟲屬(Diphyllbothrium spp.)、複殖孔條蟲屬(Diplogonoporus spp.)、食魚條蟲屬(Ichthyobothrium spp.)、舌狀條蟲屬(Ligula spp.)、頭裂條蟲屬(Schistocephalus spp.)、迭宮條蟲屬(Spirometra spp.)

來自圓葉目綱(the order of the Cyclophyllida)，例如：愛達條蟲屬(Andrya spp.)、裸頭條蟲屬(Anoplocephala spp.)、無卵黃腺屬(Avitellina spp.)、伯特條蟲屬(Bertiella spp.)、錫帶條蟲屬(Cittotaenia spp.)、戴文條蟲屬(Davainea spp.)、雙睾條蟲屬(Diorchis spp.)、倍殖孔條蟲屬(Diplopylidium spp.)、複孔條蟲屬(Dipylidium spp.)、胞蟲屬

(*Echinococcus* spp.)、棘葉條蟲屬(*Echinocotyle* spp.)、棘鱗條蟲屬(*Echinolepis* spp.)、泡尾條蟲屬(*Hydatigera* spp.)、膜殼條蟲屬(*Hymenolepis* spp.)、喬伊條蟲屬(*Joyeuxiella* spp.)、中殖孔條蟲屬(*Mesocestoides* spp.)、莫尼茨條蟲屬(*Moniezia* spp.)、副裸頭條蟲屬(*Paranoplocephala* spp.)、瑞列條蟲屬(*Railletina* spp.)、斯泰條蟲屬(*Stilesia* spp.)、帶條蟲屬(*Taenia* spp.)、曲子宮條蟲屬(*Thysaniezia* spp.)、遂體條蟲屬(*Thysanosoma* spp.)。

吸蟲：來自複殖目綱(the class of the Digenea)，例如：澳畢吸蟲屬(*Austrobilharzia* spp.)、短咽吸蟲屬(*Brachylaima* spp.)、杯殖吸蟲屬(*Calicophoron* spp.)、下彎吸蟲屬(*Catatropis* spp.)、分枝睪吸蟲屬(*Clonorchis* spp.)、肛瘤吸蟲屬(*Collyriclum* spp.)、殖盤吸蟲屬(*Cotylophoron* spp.)、環腸吸蟲屬(*Cyclocoelum* spp.)、雙腔吸蟲屬(*Dicrocoelium* spp.)、複口吸蟲屬(*Diplostomum* spp.)、棘隙吸蟲屬(*Echinochasmus* spp.)、棘緣吸蟲屬(*Echinoparyphium* spp.)、棘口吸蟲屬(*Echinostoma* spp.)、闊盤吸蟲(*Eurytrema* spp.)、片吸蟲屬(*Fasciola* spp.)、擬片形吸蟲屬(*Fasciolides* spp.)、薑片吸蟲(*Fasciolopsis* spp.)、菲策吸蟲屬(*Fischöderius* spp.)、腹袋吸蟲屬(*Gastrothylacus* spp.)、巨畢吸蟲屬(*Gigantobilharzia* spp.)、巨盤吸蟲屬(*Gigantocotyle* spp.)、異形吸蟲屬(*Heterophyes* spp.)、低頸吸蟲屬(*Hypoderaeum* spp.)、彩蚴吸蟲屬(*Leucochloridium* spp.)、後殖吸蟲屬(*Metagonimus* spp.)、次睪吸蟲屬(*Metorchis* spp.)、侏形吸蟲屬(*Nanophyetus* spp.)、背孔吸蟲屬(*Notocotylus* spp.)、後睪吸蟲屬(*Opisthorchis* spp.)、鳥畢吸蟲屬(*Ornithobilharzia* spp.)、並殖吸蟲屬(*Paragonimus* spp.)、同盤吸蟲屬

(*Paramphistomum* spp.)、斜睪吸蟲屬(*Plagiorchis* spp.)、雙穴吸蟲屬(*Posthodiplostomum* spp.)、前殖吸蟲屬(*Prosthogonimus* spp.)、裂體吸蟲屬(*Schistosoma* spp.)、毛畢吸蟲屬(*Trichobilharzia* spp.)、隱孔吸蟲屬(*Troglorema* spp.)、盲腔吸蟲屬(*Typhlocoelum* spp.)。

線蟲：來自毛形線蟲綱(the order of the Trichinellida)目，例如：毛細線蟲屬(*Capillaria* spp.)、革自線蟲屬(*Eucoleus* spp.)、菲律賓毛細線蟲屬(*Paracapillaria* spp.)、旋毛形線蟲屬(*Trichinella* spp.)、催科線蟲屬(*Trichomosoides* spp.)、鞭形線蟲屬(*Trichuris* spp.)。

來自墊刃目綱(the order of the Tylenchida)，例如：微頸線蟲屬(*Micronema* spp.)、擬類圓線蟲屬(*Parastrongyloides* spp.)、糞類圓線蟲屬(*Strongyloides* spp.)。

來自小桿亞目綱(the order of the Rhabditina)，例如：貓圓線蟲屬(*Aelurostrongylus* spp.)、裂口線蟲屬(*Amidostomum* spp.)、鉤口線蟲屬(*Ancylostoma* spp.)、血管圓線蟲屬(*Angiostrongylus* spp.)、羚羊線蟲屬(*Bronchonema* spp.)、仰口線蟲屬(*Bunostomum* spp.)、夏柏特線蟲屬(*Chabertia* spp.)、古柏線蟲屬(*Cooperia* spp.)、類古柏線蟲屬(*Cooperioides* spp.)、環體線蟲屬(*Crenosoma* spp.)、盅口線蟲屬(*Cyathostomum* spp.)、環尾線蟲屬(*Cyclococercus* spp.)、環齒口線蟲屬(*Cyclodontostomum* spp.)、杯環線蟲屬(*Cylicocyclus* spp.)、杯冠線蟲屬(*Cylicostephanus* spp.)、柱咽線蟲屬(*Cylindropharynx* spp.)、囊尾線蟲屬(*Cystocaulus* spp.)、網尾線蟲屬(*Dictyocaulus* spp.)、圓線蟲屬(*Elaphostrongylus* spp.)、類絲線蟲屬(*Filaroides* spp.)、球首線蟲屬(*Globocephalus* spp.)、細紋線蟲屬(*Graphidium* spp.)、輻首線蟲屬

(*Gyalocephalus* spp.)、血矛線蟲屬(*Haemonchus* spp.)、螺旋線蟲屬(*Heligmosomoides* spp.)、豬圓線蟲屬(*Hyostrogylus* spp.)、馬歇爾線蟲屬(*Marshallagia* spp.)、後圓線蟲屬(*Metastrongylus* spp.)、繆勒線蟲屬(*Muellerius* spp.)、鉤口線蟲屬(*Necator* spp.)、細頸線蟲屬(*Nematodirus* spp.)、新圓線蟲屬(*Neostrogylus* spp.)、日圓線蟲屬(*Nippostrongylus* spp.)、尖柱線蟲屬(*Obeliscoides* spp.)、食道齒線蟲屬(*Oesophagodontus* spp.)、結節線蟲屬(*Oesophagostomum* spp.)、盤頭線蟲屬(*Ollulanus* spp.)、鳥圓線蟲屬(*Ornithostrogylus* spp.)、奧斯勒線蟲屬(*Oslerus* spp.)、奧斯特線蟲屬(*Ostertagia* spp.)、副古柏線蟲屬(*Paracooperia* spp.)、擬環體線蟲屬(*Paracrenosoma* spp.)、擬類線蟲屬(*Parafilaroides* spp.)、擬馬鹿圓線蟲屬(*Parelaphostrogylus* spp.)、肺尾線蟲屬(*Pneumocaulus* spp.)、肺圓線蟲屬(*Pneumostrogylus* spp.)、孟口線蟲屬(*Poteriostomum* spp.)、原圓線蟲屬(*Protostrongylus* spp.)、銳尾線蟲屬(*Spicocaulus* spp.)、冠線蟲屬(*Stephanurus* spp.)、圓形線蟲屬(*Strongylus* spp.)、比翼線蟲屬(*Syngamus* spp.)、背帶線蟲屬(*Teladorsagia* spp.)、毛線線蟲屬(*Trichonema* spp.)、毛圓線蟲屬(*Trichostrongylus* spp.)、三齒線蟲屬(*Triodontophorus* spp.)、隱圓線蟲屬(*Troglostrogylus* spp.)、鉤刺線蟲屬(*Uncinaria* spp.)。

來自旋尾目綱(the order of the Spirurida)，例如：棘唇線蟲屬(*Acanthocheilonema* spp.)、異尖線蟲屬(*Anisakis* spp.)、蛔形線蟲屬(*Ascaridia* spp.)；蛔線蟲屬(*Ascaris* spp.)、似蛔線蟲屬(*Ascarops* spp.)、無刺線蟲屬(*Aspiculuris* spp.)、貝蛔線蟲屬(*Baylisascaris* spp.)、布魯線蟲屬(*Brugia* spp.)、瑟科線蟲屬(*Cercopithifilaria* spp.)、旋尾線蟲屬

(*Crassicauda* spp.)、棘唇線蟲屬(*Dipetalonema* spp.)、惡線蟲屬(*Dirofilaria* spp.)、龍線蟲屬(*Dracunculus* spp.)；德拉西線蟲屬(*Draschia* spp.)、住腸線蟲屬(*Enterobius* spp.)、絲蟲屬(*Filaria* spp.)、顎口線蟲屬(*Gnathostoma* spp.)、筒線蟲屬(*Gongylonema* spp.)、柔線蟲屬(*Habronema* spp.)、異刺線蟲屬(*Heterakis* spp.)；光絲蟲屬(*Litomosoides* spp.)、羅阿線蟲屬(*Loa* spp.)、蟠尾絲蟲屬(*Onchocerca* spp.)、蟯蟲屬(*Oxyuris* spp.)、副柔線蟲屬(*Parabronema* spp.)、類絲蟲屬(*Parafilaria* spp.)、副蛔蟲屬(*Parascaris* spp.)、栓尾線蟲屬(*Passalurus* spp.)、泡翼線蟲屬(*Physaloptera* spp.)、普氏線蟲屬(*Probstmayria* spp.)、偽絲蟲屬(*Pseudofilaria* spp.)、絲狀線蟲屬(*Setaria* spp.)、思科線蟲屬(*Skjrabinema* spp.)、旋尾線蟲屬(*Spirocerca* spp.)、冠絲蟲屬(*Stephanofilaria* spp.)、多圓線蟲屬(*Strongyluris* spp.)、管狀線蟲屬(*Syphacia* spp.)、吸吮線蟲屬(*Thelazia* spp.)、弓蛔線蟲屬(*Toxascaris* spp.)、弓首線蟲屬(*Toxocara* spp.)、吳策線蟲屬(*Wuchereria* spp.)。

棘頭動物(*Acantocephala*)：來自寡棘目綱(the order of the *Oligacanthorhynchida*)，例如：巨棘蟲屬(*Macracanthorhynchus* spp.)、棘頭蟲前罩屬(*Prosthenorchis* spp.)；來自鏈珠目(the order of the *Moniliformida*)，例如：念珠棘蟲屬(*Moniliformis* spp.)。

來自多形目綱(the order of the *Polymorphida*)，例如：細頸棘頭蟲屬(*Filicollis* spp.)；來自棘吻目(the order of the *Echinorhynchida*)，例如：棘頭蟲屬(*Acanthocephalus* spp.)、棘吻蟲屬(*Echinorhynchus* spp.)、似細吻棘頭蟲屬(*Leptorhynchoides* spp.)。

蟯蟲動物(*Pentastoma*)：來自孔頭舌蟲目綱(the order of the

Porocephalida)，例如：舌形蟲屬(Linguatula spp.)。

本發明化合物可尤其用於治療及預防，亦即防治蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染。

藉由使用本發明化合物控制動物寄生蟲，尤其蠕蟲，意欲減少或預防疾病、死亡案例及效能降低(在肉、乳汁、羊毛、獸皮、蛋、蜂蜜及其類似物之情況下)，以使得能夠更經濟且較簡單飼養動物，且達到動物之良好狀態。

如本文關於動物健康狀況領域所用之術語「控制(control/controlling)」意謂本發明化合物使感染寄生蟲之動物中各別此類寄生蟲之發病率有效降低至無害水準。更特定言之，如本文所用「控制」意謂本發明化合物有效殺死各別寄生蟲，抑制其生長或抑制其增殖。

根據另一態樣，本發明涵蓋如上文所述之通式(I)化合物或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物，其用於治療或預防疾病，特定言之蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染。

本發明化合物之醫藥活性可藉由其與Slo-1離子通道之相互作用來加以解釋。

根據另一態樣，本發明涵蓋如上文所述之通式(I)及(II)化合物、或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物之用途，其用於治療或預防疾病，特定言之蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染。

根據另一態樣，本發明涵蓋如上文所述之通式(I)及(II)化合物或其立

體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物之用途，其用於治療或預防疾病，特定言之蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染之方法中。

根據另一態樣，本發明涵蓋如上文所述之通式(I)及(II)化合物或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物之用途，其用於製備供預防或治療疾病，特定言之蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染用之醫藥組合物、較佳地藥劑。

根據另一態樣，本發明涵蓋一種治療或預防疾病，特定言之蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染之方法，該方法使用有效量之如上文所述之通式(I)及(II)化合物或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物。

根據另一態樣，本發明涵蓋如上文所述之通式(I)及(II)化合物或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物，其用作抗內寄生蟲劑。

根據另一態樣，本發明涵蓋如上文所述之通式(I)及(II)化合物或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物，其用作驅蠕蟲劑，特定言之用作殺線蟲劑、殺扁形動物劑(platyhelminthocidal agent)、殺棘頭蟲劑(acanthocephalicidal agent)或殺舌形蟲劑(pentastomicidal agent)。

根據另一態樣，，本發明涵蓋醫藥組合物，特定言之獸醫學調配

物，該等醫藥組合物包含如上文所述之通式(I)及(II)化合物或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物、鹽，特定言之醫藥學上可接受之鹽或其混合物及一或多種賦形劑，特定言之或多種醫藥學上可接受之賦形劑。可使用將此類醫藥組合物製備成適當劑型之習知程序。

根據另一態樣，本發明涵蓋一種用於製備醫藥組合物，特定言之獸醫學調配物之方法，該方法包含以下步驟：將如上文所述之通式(I)及(II)化合物，或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物、鹽，特定言之醫藥學上可接受之鹽或其混合物與一或多種賦形劑，特定言之或多種醫藥學上可接受之賦形劑混合。

根據另一態樣，本發明涵蓋一種治療或預防疾病，特定言之蠕蟲感染，特定言之胃腸及腸外蠕蟲感染，更特定言之胃腸及腸外線蟲感染之方法，該方法使用包含有效量之如上文所述之通式(I)及(II)化合物，或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物及鹽，特定言之其醫藥學上可接受之鹽或其混合物之醫藥組合物，特定言之獸醫學調配物。

本發明進一步涵蓋醫藥組合物，特定言之獸醫學調配物，其包含至少一種本發明化合物，習知地連同一或多種醫藥學上適合的賦形劑，及其用於上文所提及目的之用途。

本發明化合物有可能具有全身性及/或局部活性。出於此目的，其可以適合方式投與，諸如經由口服、非經腸、經肺、經鼻、舌下、經舌、經頰、經直腸、經陰道、經由皮膚、經皮、經結膜、經耳途徑或以植入物或血管支架形式。此類投與可以預防性、補救性預防或治療性方式進行。

就此等投藥途徑而言，本發明化合物有可能以適合之投與形式投與。

就經口投與而言，有可能將本發明化合物調配為此項技術中已知的快速及/或以經修改之方式遞送本發明化合物之劑型，諸如錠劑(非包衣或包衣錠劑，例如具有延遲溶解或不可溶之腸溶或控制釋放包衣)、經口崩解錠劑、薄膜/粉片、薄膜/凍乾製劑、膠囊(例如硬或軟明膠膠囊)、糖包衣錠劑、顆粒劑、丸劑、咀嚼錠(例如軟咀嚼錠)、散劑、乳液、懸浮液、氣霧劑或溶液。有可能將本發明化合物以結晶及/或非晶形及/或溶解形式併入該等劑型中。

非經腸投與可在避免吸收步驟之情況下(例如靜脈內、動脈內、心內、脊椎內或腰內)或在包括吸收之情況下(例如肌肉內、皮下、皮內、經皮或腹膜內)實現。適用於非經腸投藥之投藥形式尤其為呈溶液、懸浮液、乳液、凍乾製劑或無菌散劑形式之注射及輸注用製劑。

適用於其他投藥途徑之實例為用於吸入之醫藥形式[尤其粉末吸入劑、霧化器]、經鼻滴劑、經鼻溶液、經鼻噴霧劑；用於經舌、舌下或經頰投與之錠劑/膜/粉片/膠囊；栓劑；滴眼劑、眼膏、洗眼液、眼部插入物、滴耳劑、噴耳劑、耳用粉劑、沖耳劑、耳塞；陰道膠囊、水性懸浮液(洗劑、震盪混合物)、親脂性懸浮液、乳液、軟膏、乳膏、經皮治療系統(諸如貼片)、牛奶、糊劑、泡沫、塗劑(spot-ons)、敷粉、植入物或血管支架。

本發明化合物可併入所述之投藥形式中。此可以本身已知之方式藉由與醫藥學上適合之賦形劑混合而實現。醫藥學上可適合的賦形劑尤其包括

- 填充劑及載劑(例如纖維素、微晶纖維素(諸如Avicel<sup>®</sup>)、乳糖、甘露糖醇、澱粉、磷酸鈣(諸如Di-Cafos<sup>®</sup>))，

- 軟膏基質(例如石油膏、石蠟、甘油三酯、蠟、毛絨蠟、毛絨蠟醇、羊毛蠟、親水性軟膏、聚乙二醇)，
- 栓劑用基質(例如聚乙二醇、可可黃油、硬脂肪)，
- 溶劑(例如水、乙醇、異丙醇、丙三醇、丙二醇、中鏈長甘油三酯脂肪油、液體聚乙二醇、石蠟)，
- 界面活性劑、乳化劑、分散劑或潤濕劑(例如十二烷基硫酸鈉)、卵磷脂、磷脂、脂肪醇(諸如Lanette<sup>®</sup>)、脫水山梨糖醇脂肪酸酯(諸如Span<sup>®</sup>)、聚氧乙烯脫水山梨糖醇脂肪酸酯(諸如Tween<sup>®</sup>)、聚氧乙烯脂肪酸甘油酯(諸如Cremophor<sup>®</sup>)、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚、甘油脂肪酸酯、泊洛沙姆(poloxamers)(諸如Pluronic<sup>®</sup>)，
- 緩衝劑、酸及鹼(例如磷酸鹽、碳酸鹽、檸檬酸、乙酸、鹽酸、氫氧化鈉溶液、碳酸銨、胺丁三醇、三乙醇胺)，
- 等滲劑(例如葡萄糖、氯化鈉)，
- 吸附劑(例如高分散二氧化矽)，
- 增黏劑、凝膠形成劑、增稠劑及/或黏合劑(例如聚乙炔吡咯啉酮、甲基纖維素、羥丙基甲基纖維素、羥丙基纖維素、羧甲基纖維素鈉、澱粉、卡波姆(carbomers)、聚丙烯酸(諸如Carbopol<sup>®</sup>)、海藻酸鹽、明膠)，
- 崩解劑(例如經改質澱粉、羧甲基纖維素鈉、羥基乙酸澱粉鈉(諸如Explotab<sup>®</sup>)、交聯聚乙炔吡咯啉酮、交聯羧甲基纖維素鈉(諸如AcDiSol<sup>®</sup>))，
- 流量調節劑、潤滑劑、滑動劑及脫模劑(例如硬脂酸鎂、硬脂酸、滑石、高分散二氧化矽(諸如Aerosil<sup>®</sup>))，
- 包衣材料(例如糖、蟲膠)及快速或以經改良之方式溶解之用於薄膜

或擴散膜之成膜劑(例如聚乙烯吡咯啉酮(諸如Kollidon®)、聚乙烯醇、羥丙基甲基纖維素、羥丙基纖維素、乙基纖維素、鄰苯二甲酸羥丙基甲基纖維素、乙酸纖維素、鄰苯二甲酸乙酸纖維素、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯(諸如Eudragit®))，

- 膠囊材料(例如明膠、羥丙基甲基纖維素)，
- 合成聚合物(例如聚乳酸交酯、聚乙交酯、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯(諸如Eudragit®)、聚乙烯吡咯啉酮(諸如Kollidon®)、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯、聚氧乙烯、聚乙二醇及其共聚物及嵌段共聚物)，
- 塑化劑(例如聚乙二醇、丙二醇、丙三醇、三醋酸甘油酯、檸檬酸三乙醯酯、鄰苯二甲酸二丁酯)，
- 滲透增強劑
- 穩定劑(例如抗氧化劑，諸如抗壞血酸、抗壞血酸棕櫚酸酯、抗壞血酸鈉、丁基羥基苯甲醚、丁基羥基甲苯、沒食子酸丙酯(propyl gallate))，
- 防腐劑(例如對羥苯甲酸酯、山梨酸、硫柳汞、苯紫氯銨、氯己定乙酸酯、苯甲酸鈉)，
- 著色劑(例如無機顏料，諸如氧化鐵、二氧化鈦)，
- 調味劑、甜味劑、味道及/或氣味遮蔽劑。

本發明進一步係關於一種包含至少一種本發明化合物習知地連同一或多種醫藥學上適當的賦形劑之醫藥組合物，且係關於其根據本發明之用途。

根據另一態樣，本發明涵蓋包含至少一種本發明之通式(I)化合物及至少一或多種其他活性成分之醫藥組合，特定言之藥物，其尤其用於治療

及/或預防內及/或外寄生蟲感染。

在本發明中，術語「內寄生蟲」如熟習此項技術者所知加以使用，且尤其係指蠕蟲。在本發明中，術語「外部寄生蟲」如熟習此項技術者所知加以使用，且尤其係指節肢動物，特定言之昆蟲或蟎。

特定言之，本發明涵蓋一種醫藥組合，特定言之獸醫學組合，其包含：

- 一或多種第一活性成分，特定言之，如上文所定義之通式(I)化合物，及
- 一或多種其他活性成分，特定言之，一或多種殺內寄生蟲藥及/或殺外寄生蟲藥。

術語「組合」在本發明中如熟習此項技術者所知加以使用，該組合可為固定組合、非固定組合或分裝部分之套組。

在本發明中，「固定組合」如熟習此項技術者所知加以使用，且定義為其中例如第一活性成分(諸如一或多種本發明之通式(I)化合物)及另一活性成分一起存在於一個單位劑量或一個單一實體中之組合。「固定組合」之一個實例為醫藥組合物，其中第一活性成分與另一種活性成分存在於供同時投與用的混合物中，諸如調配物中。「固定組合」之另一實例為其中第一活性成分與另一活性成分存在於一個單位中而未混合之醫藥組合。

本發明中之非固定組合或「分裝部分之套組」如熟習此項技術者所已知加以使用，且定義為其中第一活性成分與另一活性成分存在於多於一個單位中之組合。非固定組合或分裝部分之套組之一個實例為其中第一活性成分與另一活性成分單獨存在之組合。非固定組合或分裝部分之套組之組分有可能單獨、依序、同時、並行或按交錯時間順序投與。

本發明化合物可以單一醫藥劑之形式或與一或多種其他醫藥學上活性之成分組合投與，其中該組合不會引起不可接受之不良作用。本發明亦涵蓋此類醫藥組合。舉例而言，本發明化合物可與已知殺外寄生蟲藥及/或殺內寄生蟲藥組合。

本文中藉由其通用名稱指定之其他或另外活性成分已為吾人所知且描述於例如Pesticide Manual (「The Pesticide Manual」,第16版, British Crop Protection Council 2012) 中，或可在網際網路(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)中搜索到。分類係基於本專利申請案申請時之當前IRAC Mode of Action Classification Scheme。

殺外寄生蟲藥及/或殺內寄生蟲藥之實例為殺蟲劑、殺蟎劑及殺線蟲劑，且特定言之包括：

(1)乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑，諸如胺基甲酸酯類，例如棉靈威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、惡蟲威(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砒威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、殺蟲丹(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、複滅蟎(formetanate)、呋線威(furathiocarb)、葉蟬散(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、速滅威(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啞蚜威(triazamate)、混滅威(trimethacarb)、XMC及滅殺威(xylylcarb)；或有機磷酸酯，例如歐殺松(acephate)、亞滅松(azamethiphos)、乙基谷速松(azinphos-ethyl)、甲基谷速松(azinphos-methyl)、硫線磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、克芬松

(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、蠅毒磷(coumaphos)、殺螟腈(cyanophos)、甲基硫代內吸磷(demeton-S-methyl)、大利松(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、伐滅磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、芬殺松(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、新煙磷(imicyafos)、異柳磷(isofenphos)、O-(甲氧基胺基硫基-磷醯基)水楊酸異丙酯、加福松(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、滅蚜磷(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧樂果(omethoate)、甲基滅多松(oxydemeton-methyl)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、巴賽松(phoxim)、甲基亞特松(pirimiphos-methyl)、布飛松(profenofos)、巴胺磷(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、吡啶硫磷(pyraclofos)、噻嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹惡磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、雙硫磷(temephos)、託福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(triclorfon)及蚜滅多(vamidothion)。

(2) GABA閘控氯離子通道阻斷劑，諸如環戊二烯-有機氯類，例如氯丹(chlordane)及安殺番(endosulfan)或苯基吡啶(非潑羅(fiproles))，例如乙蟲清(ethiprole)及費普尼(fipronil)。

(3) 鈉通道調節劑，諸如擬除蟲菊酯類，例如阿納寧(acrinathrin)、丙烯除蟲菊酯(allethrin)、d-順式反式丙烯菊酯、d-反式丙烯菊酯、畢芬寧(bifenthrin)、生物丙烯菊酯、S-環戊烯基生物丙烯菊酯異構體、苳呋菊脂(bioresmethrin)、乙氰菊脂(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、 $\beta$ -賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、 $\lambda$ -賽洛寧、 $\gamma$ -賽洛寧、賽滅寧(cypermethrin)、 $\alpha$ -賽滅寧、 $\beta$ -賽滅寧、 $\theta$ -賽滅寧、 $\xi$ -賽滅寧、賽酚寧[(1R)-反式異構體]、第滅寧(deltamethrin)、烯炔菊酯[(EZ)-(1R)-異構體]、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 $\tau$ -福化利(tau-fluvalinate)、苳蟊醚(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、甲氧苳氟菊酯(momfluorothrin)、百滅寧(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式異構體]、普亞列寧(prallethrin)、除蟲菊精(除蟲菊)、苳呋菊脂(resmethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、治滅寧(tetramethrin)、治滅寧[(1R)-異構體]、泰滅寧(tralomethrin)及拜富寧(transfluthrin)或DDT或甲氧滴滴涕(methoxychlor)。

(4) 菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)競爭性調節劑，諸如新菸鹼類似物類，例如啞蟲脒(acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、吡蟲啉(imidacloprid)、烯啞蟲胺(nitenpyram)、噻蟲啉(thiacloprid)及噻蟲嗪(thiamethoxam)或菸鹼或氟啞蟲胺脒(sulfoxaflor)或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

(5) 菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)異位調節劑，諸如賜諾殺類(spinosyn)，例如斯平托蘭(spinetoram)及賜諾殺(spinosad)。

(6) 麩胺酸閘控氯離子通道(GluCl)異位調節劑，諸如阿維菌素類

(avermectin)/米爾倍黴素類(milbemycin)，例如阿巴汀(abamectin)、因滅汀苯甲酸酯(emamectin benzoate)、林皮沒丁(lepimectin)及密滅汀(milbemectin)。

(7)青少年激素模擬物，諸如青少年激素類似物，例如烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)及美賜平(methoprene)或芬諾克(fenoxycarb)或百利普芬(pyriproxyfen)。

(9)弦音器官(Chordotonal Organs)之調節劑，諸如派滅淨(pymetrozine)或氟啶蟲醯胺(flonicamid)。

(10)蟎生長抑制劑，諸如克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)及氟蟎嗪(diflovidazin)或依殺蟎(etoxazole)。

(12)粒線體ATP合成酶之抑制劑，諸如ATP瓦解劑，諸如汰芬諾克(diafenthion)或有機錫化合物，例如三唑錫(azocyclotin)、錫蟎丹(cyhexatin)及芬布錫(fenbutatin oxide)或毆蟎多(propargite)或四氯殺蟎虱(tetradifon)。

(13)經由破壞質子梯度氧化磷酸化之去偶合劑，諸如克凡派(chlorfenapyr)、DNOC及氟蟲胺(sulfluramid)。

(14)菸鹼乙醯膽鹼受體通道阻斷劑，諸如殺蟲磺(bensultap)、培丹鹽酸鹽(cartap hydrochloride)、硫賜安(thiocylam)及殺蟲雙鈉(thiosultap-sodium)。

(15)甲殼素生物合成之抑制劑，O型，諸如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、得福隆

(teflubenzuron)及三福隆(triflumuron)。

(16)甲殼素生物合成之抑制劑，I型，例如布芬淨(buprofezin)。

(17)脫皮干擾劑(特定言之用於雙翅目，亦即雙翅目昆蟲)，諸如賽滅淨(cyromazine)。

(18)蛻皮激素受體促效劑，諸如環蟲醯肼(chromafenozide)、合芬隆(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)及得芬諾(tebufenozide)。

(19)章魚胺受體促效劑，諸如三亞蟎(amitraz)。

(20)粒線體複合物III電子傳輸抑制劑，諸如伏蟎脲(hydramethylnone)或亞醯蟎(acequinocyl)或嘧蟎酯(flucrypyrim)。

(21)粒線體複合物I電子傳輸抑制劑，諸如來自METI殺蟎劑之群，例如芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、嘧蟎醚(pyrimidifen)、比達本(pyridaben)、得芬瑞(tebufenpyrad)及脫芬瑞(tolfenpyrad)或魚藤酮(rotenone)(Derris)。

(22)電壓依賴性鈉通道阻斷劑，諸如因得克(indoxacarb)或氰氟蟲胺(metaflumizone)。

(23)乙醯CoA羧化酶之抑制劑，諸如特窗酸(tetronic acid)及特特拉姆酸(tetramic acid)衍生物，例如賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)及螺蟲乙酯(spirotetramat)。

(25)粒線體複合物II電子傳輸抑制劑，諸如 $\beta$ -開托利(beta-ketonitrile)衍生物，例如腈吡蟎酯(cyenopyrafen)及丁氟蟎酯(cyflumetofen)，及甲苯胺類，諸如吡氟蟎酯(pyflubumide)。

(28)理阿諾鹼(Ryanodine)受體調節劑，諸如二醯胺類，例如氯蟲苯甲醯胺(chlorantraniliprole)、氰強尼普羅(cyantraniliprole)及氟蟲雙醯胺

(flubendiamide) ,

其他活性成分諸如阿法吡喃 (Afidopyropen) 、 阿弗索拉納 (Afoxolaner) 、 印楝素 (Azadirachtin) 、 苯氯噻 (Benclothiaz) 、 苯蟎特 (Benzoximate) 、 畢芬載 (Bifenazate) 、 布羅蔡內酯 (Broflanilide) 、 溴蟎酯 (Bromopropylate) 、 蟎離丹 (Chinomethionat) 、 氯丙烯菊酯 (Chloroprallethrin) 、 冰晶石 (Cryolite) 、 環苯丙胺酸 (Cyclaniliprole) 、 環氧蟲啉 (Cycloxaprid) 、 氯氟氰蟲醯胺 (Cyhalodiamide) 、 雙氯甲草胺 (Dicloromezotiaz) 、 開樂散 (Dicofol) 、  $\epsilon$ - 甲氧苄氟菊酯 (epsilon-Metofluthrin) 、  $\epsilon$ - 氟氟氯菊酯 (epsilon-Momfluthrin) 、 氟嗎啉喹啉 (Flometoquin) 、 氟氮吲哚嗪 (Fluazaindolizine) 、 氟噻蟲磺 (Fluensulfone) 、 氟芬內林 (Flufenerim) 、 氟菌蟎酯 (Flufenoxystrobin) 、 丁烯氟蟲腈 (Flufiprole) 、 氟西沙星 (Fluhexafon) 、 氟吡菌醯胺 (Fluopyram) 、 弗拉拉納 (Fluralaner) 、 氟甲醯胺 (Fluxametamide) 、 呋喃蟲醯肼 (Fufenozide) 、 戊吡蟲胍 (Guadipyr) 、 七氟氯氰菊酯 (Heptafluthrin) 、 氯噻啉 (Imidaclothiz) 、 依普同 (Iprodione) 、  $\kappa$  畢芬寧 (kappa-Bifenthrin) 、  $\kappa$  七氟菊酯 (kappa-Tefluthrin) 、 洛替拉納 (Lotilaner) 、 氯氟醚菊酯 (Meperfluthrin) 、 牌蟲丁 (Paichongding) 、 啉蟲丙醚 (Pyridalyl) 、 吡氟啶啉 (Pyrifluquinazon) 、 嘧蟎胺 (Pyriminostrobin) 、 螺環必洛芬 (Spirobudiclofen) 、 四氟醚菊酯 (Tetramethylfluthrin) 、 四葉蟲 (Tetraniliprole) 、 四氯苯環丙酯 (Tetrachlorantraniliprole) 、 噻唑嗪 (Tioxazafen) 、 硫代羅吡酸鹽 (Thiofluoximate) 、 三氟苯嘧啉及碘甲烷；基於強固芽胞桿菌 (Bacillus firmus) (I-1582, BioNeem, Votivo) 之另外製劑，以及下列化合物：1-{2 氟-

4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(自WO2006/043635得知) (CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-吡啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(自WO2003/106457得知) (CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]吡啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]異菸鹼醯胺(自WO2006/003494得知) (CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羥-8-甲氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(自WO 2010052161得知) (CAS 1225292-17-0)、碳酸3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙酯(自EP2647626得知) (CAS 1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基吡啶-1-基)-5-氟嘧啶(自WO2004/099160得知) (CAS 792914-58-0)、PF1364 (自JP2010/018586得知) (CAS 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亞基]-2,2,2-三氟乙醯胺(自WO2012/029672得知) (CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-仲吡啶基]-1,1,1-三氟-丙-2-酮(自WO2013/144213得知) (CAS 1461743-15-6)、N-[3-(苯甲基胺甲醯基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲醯胺(自WO2010/051926得知) (CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基胺甲醯基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡唑-3-甲醯胺(自CN103232431得知) (CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(順-1-氧化-3-硫雜環丁基)-苯甲醯胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(反-1-氧化-3-硫雜環丁基)-苯甲醯胺及4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(順-1-氧化-3-硫雜環丁基)苯甲醯胺

(自WO 2013/050317 A1得知) (CAS-83-7)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺、(+)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺及(-)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺(自WO 2013/162715 A2、WO 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1得知) (CAS 1477923-37-7)、5-[[[(2E)-3-氯-2-丙烯-1-基]胺基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亞磺醯基]-1H-吡唑-3-腓(自CN 101337937 A得知) (CAS 1105672-77-2)、3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲胺基)硫代甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-腓(硫代苯甲醯胺(Liudaibenjiaxuanan)，自CN 103109816A得知) (CAS 1232543-85-9)；N-[4-氯-2-[(1,1-二甲基乙基)胺基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡唑-5-腓(自WO 2012/034403 A1得知) (CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-腓(自WO 2011/085575 A1得知) (CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)-嘧啶(自CN 101337940 A得知) (CAS 1108184-52-6)；(2E)-及2(Z)-2-[2-(4-氰苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]-胼甲醯胺(自CN 101715774 A得知) (CAS 1232543-85-9)；3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基-4-(1H-苯并咪唑-2-基)苯基-環丙烷甲酸酸酯(自CN 103524422 A得知) (CAS 1542271-46-4)；(4aS)-7-氯-2,5-二氫-2-[[[(甲氧羰基)[4-[(三氟甲基)硫代]苯基]胺基]羰基]-茚[1,2-e][1,3,4]氧二氮雜環己烯-4a(3H)-甲酸甲酯(自CN 102391261 A得知) (CAS 1370358-69-2)；6-去氧-3-O-乙基-2,4-二-O-甲基-、1-[N-[4-[1-

[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1H-1,2,4-三唑-3-基]苯基甲酸酯]- $\alpha$ -L-吡喃甘露糖(自US 2014/0275503 A1得知) (CAS 1181213-14-8)；8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-噻嗪-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-反)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-噻嗪-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-合成)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-噻嗪-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(自WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1得知) (CAS 934001-66-8)及N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫基]-丙醯胺(自WO 2015/058021 A1、WO 2015/058028 A1得知)(CAS 1477919-27-9)及N-[4-(胺基硫代甲基)-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲醯胺(自CN 103265527 A得知) (CAS 1452877-50-7)。

具有未知或非特異性作用模式之活性成分，例如芳氟胺(fentrifanil)、非諾克林(fenoxacrim)、環孢素(cycloprene)、乙酯殺蟎醇(chlorobenzilate)、殺蟲脒(chlordimeform)、氟蟎噻(flubenzimine)、地昔尼爾(dicyclanil)、安米氟美(amidoflumet)、甲基克殺蟎(quinomethionate)、苯蟎噻(triarathene)、氯噻苯(clothiazoben)、殺蟎好(tetrasul)、油酸鉀(potassium oleate)、石油(petroleum)、惡蟲酮(metoxadiazone)、棉紅鈴蟲性誘劑(gossyplure)、氟蟎噻(flutenzin)、溴蟎酯(bromopropylate)、冰晶石；

來自其他類別之活性成分，例如畜蟲威(butacarb)、敵蠅威(dimetilan)、地蟲威(cloethocarb)、磷蟲威(phosphocarb)、亞特松(pirimiphos)(乙基亞特松)、巴拉松(parathion)(乙基巴拉松)、蟲蟎畏

(methacrifos)、鄰柳酸異丙酯、三氯松(trichlorfon)、硫丙磷(sulprofos)、丙蟲磷(propaphos)、克線丹(sebufos)、噻硫磷(pyridathion)、發硫磷(prothoate)、除線磷(dichlofenthion)、內吸磷-S-甲基磷(demeton-S-methylsulphone)、依殺松(isazofos)、苯腈磷(cyanofenphos)、氯亞胺硫磷(dialifos)、三硫磷(carbophenothion)、特噻硫磷(autathiofos)、阿芬烯磷(aromfenvinfos)(甲基阿芬烯磷)、谷速松(azinphos)(乙基谷速松)、陶斯松(chlorpyrifos)(乙基陶斯松)、丁苯硫磷(fosmethilan)、碘硫磷(iodofenphos)、蔬果磷(dioxabenzofos)、安果(formothion)、地蟲磷(fonofos)、吡氟硫磷(flupyrzofos)、豐索磷(fensulfothion)、乙噻硫磷(etrifos)；

有機氯，例如毒殺芬(camphchlor)、靈丹(lindane)、飛布達；或苯基吡啶，例如乙醯蟲腈(acetoprole)、氟蟲腈(pyrafluprole)、派瑞樂(pyriprole)、凡尼普羅(vaniliprole)、維吉黴素(sisapronil)；或異噁唑啉(isoxazolines)，例如薩洛拉納(sarolaner)、阿福拉納(afoxolaner)、洛替拉納、弗拉拉納(fluralaner)；

擬除蟲菊酯，例如(順式-擬除蟲菊酯、反式-擬除蟲菊酯)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、三氟醚(flufenprox)、溴氟菊酯(flubrocylthrin)、苄蟊醚(fubfenprox)、五氟苯菊酯(fenfluthrin)、丙苯炔菊酯(protrifenbute)、反滅蟲菊(pyresmethrin)、RU15525、環戊烯丙菊酯(terallethrin)、順式苄呋菊脂(cis-resmethrin)、右旋七氟甲醚菊酯(heptafluthrin)、戊環苄呋菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、吡氯氰菊酯(fenpyrithrin)、順式-賽滅寧、順式百滅寧、三氟氯氰菊酯(clocythrins)、賽洛寧( $\lambda$ -賽洛寧)、二氯炔戊菊酯

(chlovaporthrin) 或 鹵 化 碳 氫 化 合 物 (halogenated carbonhydrogen compound, HCH)；

新菸鹼類似物，例如硝乙脲噻唑(nithiazine)；

雙氯甲草胺、三氟苯嘧啶；

巨環內酯，例如尼莫克汀(nemadectin)、伊維菌素(ivermectin)、拉替菌素(latidectin)、莫昔克丁(moxidectin)、司拉克丁(selamectin)、依立諾克丁(eprinomectin)、多拉克汀(doramectin)、因滅汀苯甲酸酯(emamectin benzoate)；米爾倍黴素肟(milbemycin oxime)；

烯蟲硫酯(triprene)、保幼醚(epofenonane)、苯蟲醚(diofenolan)；

生物製劑、激素或信息素，例如天然產物，例如蘇雲金素(thuringiensin)、蘋果小卷蛾性誘劑(codlemone)或印楝(neem)組分；

二硝基酚類(dinitrophenols)，例如白粉克(dinocap)、大脫蟎(dinobuton)、百蟎克(binapacryl)；

苯甲醯基脲，例如啞蜚脲(flauazuron)、氟幼脲(penfluron)；

脘衍生物，例如滅蟎脘(chlormebuform)、賽米唑(cymiazole)、得米地曲(demiditraz)；

蜂巢蜂殺蟎劑(Bee hive varroa acaricides)，例如有機酸，例如甲酸、乙酸。

用於動物健康狀況之尤其受關注之殺蟲劑及殺蟎劑之非限制性實例為且特定言之包括[亦即Mehlhorn等人，Encyclpaedic Reference of Parasitology 第4版(ISBN 978-3-662-43978-4)]：

節肢動物配位基閘控氯化物通道處之效應劑：氯丹(chlordane)、飛布達(heptachlor)、硫丹(endoculfan)、狄氏劑(Dieldrin)、溴烯殺

(bromocyclen)、八氯莰烯(toxaphene)、靈丹、費普尼、派瑞樂、維吉黴素、阿弗索拉納、弗拉拉納、薩洛拉納、洛替拉納、氟甲醯胺、布羅蔡內酯、阿巴汀、多拉克汀、依立諾克丁、伊維菌素、米爾倍黴素、莫昔克丁、司拉克丁；

節肢動物章魚胺激導性受體之調節劑：三亞蟎(amitraz)、BTS27271、賽米唑(cymiazole)、得米地曲(demiditraz)；

節肢動物電壓閘控鈉通道處之效應劑：DDT、甲氧滴滴涕、氰氟蟲胺、因得克、瓜菊酯I (cinerin I)、瓜菊酯II、茉莉菊酯I (jasmolin I)、茉莉菊酯II、必列寧I、必列寧II、丙烯除蟲菊酯、 $\alpha$ 賽滅寧(alphacypermethrin)、生物丙烯菊酯、保得(betacyfluthrin)、賽扶寧、賽洛寧、賽滅寧、第滅寧、依芬寧、芬化利、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯菊酯、苧蟎醚、百滅寧、苯醚菊酯、苧呋菊脂、 $\tau$ -福化利、治滅寧；

節肢動物菸鹼膽鹼激導性突觸(乙醯膽鹼酯酶、乙醯膽鹼受體)之效應劑：溴蟎酯(bromoprypylate)、惡蟲威、加保利、納乃得、蜚虱威(promacyl)、安丹、亞滅松、克芬松、陶斯松、蠅毒磷、畜蜚磷(cythioate)、大利松、二氯松(diclorvos)、雙特松、大滅松、愛殺松、伐滅磷、撲滅松、芬殺松、庚烯磷、馬拉松、二溴磷、益滅松、巴賽松、捷利康(phthalofos)、巴胺磷、雙硫磷、樂本松、三氯松、吡蟲啉、烯啶蟲胺、呋蟲胺、賜諾殺、斯平托蘭；

節肢動物發育過程之效應劑：賽滅淨、地昔尼爾、二福隆、啞蜚脲、祿芬隆、三福隆、芬諾克、烯蟲乙酯、美賜平、百利普芬、芬諾克、烯蟲乙酯、S-美賜平、百利普芬。

作為在本發明中之另一或其他活性成分的來自殺內寄生蟲藥之群的

例示性活性成分包括(但不限於)驅蠕蟲活性化合物及抗原蟲活性化合物。

驅蠕蟲活性化合物包括(但不限於)以下:殺線蟲、殺吸蟲及/或殺緣蟲活性化合物:

來自巨環內酯類,例如:依立諾克汀、阿巴汀、尼莫克汀、莫昔克汀、多拉克汀、司拉克汀、林皮沒丁、拉替菌素、密滅汀、伊維菌素、因滅汀、米爾倍黴素;

來自苯并咪唑及樸苯并咪唑(probenzimidazole)類,例如:奧苯達唑(oxibendazole)、甲苯達唑(mebendazole)、三氯苯咪唑(triclabendazole)、多保淨(thiophanate)、帕苯達唑(parbendazole)、奧芬達唑(oxfendazole)、尼妥必敏(netobimin)、芬苯達唑(fenbendazole)、非班太爾(febantel)、噻苯達唑(thiabendazole)、環苯達唑(cyclobendazole)、坎苯達唑(cambendazole)、阿苯達唑-亞砒(albendazole-sulphoxide)、阿苯達唑(albendazole)、氟苯達唑(flubendazole);

來自縮肽、較佳環狀縮肽類,特定言之24員環狀縮肽,例如:艾默德斯(emodepside)、PF1022A;

來自四氫嘧啶類,例如:莫侖太(morantel)、噻嘧啶(pyrantel)、奧克太爾(oxantel);

來自咪唑并噻唑類,例如:丁咪唑(butamisol)、左旋咪唑(levamisole)、四咪唑(tetramisol);

來自胺基苯脒類,例如:阿米登太(amidantel)、去醯化阿米登太(dAMD)、三苯雙脒(tribendimidine);

來自胺基乙腈類,例如:莫尼特爾(monepantel);

來自帕拉米德類，例如：帕拉米德(paraherquamide)、德曲安特(derquantel)；

來自柳醯苯胺類，例如：三溴沙侖(tribromsalan)、溴沙尼特(bromoxanide)、溴替尼特(brotianide)、氯碘沙尼(clioxanide)、氯氰碘柳胺(closantel)、氯硝柳胺(niclosamide)、羥氯紫胺(oxyclozanide)、碘醚柳胺(rafoxanide)；

來自經取代之苯酚類，例如：硝羥碘苳腈(nitroxynil)、硫雙二氯酚(bithionol)、二碘硝酚(disophenol)、六氯酚(hexachlorophene)、聯硝氯酚(niclofolan)、聯硝氯酯(meniclopholan)；

來自有機磷酸酯類，例如：三氯松、萘肽磷(naphthalofos)、二氯松/DDVP、育畜磷(crufomate)、蠅毒磷、哈洛克酮(haloxon)；

來自哌嗪酮/喹啉類，例如：吡嗪酮(praziquantel)、依西太爾(epsiprantel)；

來自哌嗪類，例如：哌嗪、安泰樂(hydroxyzine)；

來自四環素類，例如：四環素(tetracyclin)、金黴素(chlorotetracycline)、脫氧土黴素(doxycyclin)、土黴素(oxytetracyclin)、羅列環素(rolitetracyclin)；

來自其他不同類別，例如：丁萘脒(bunamidine)、硝噻噻唑(niridazole)、溴二羥苯醯苯胺(resorantel)、奧弗亭(omphalotin)、奧替普拉(oltipraz)、硝異硫氰二苯醚(nitroscanate)、氮氧尼(nitroxynile)、奧沙尼喹(oxamniquine)、米拉桑(mirasan)、鹽酸盧甘宋(miracil)、胺甲硫蔥酮(lucanthone)、羥胺硫蔥酮(hycanthone)、三氯苯丙醯嗪(hetolin)、吐根素(emetine)、二乙碳醯嗪(diethylcarbamazine)、二氯酚(dichlorophen)、

地芬尼泰(diamfenetide)、氯硝西洋(clonazepam)、酚乙銨(bephenium)、  
硝硫氰胺(amoscanate)、氯舒隆(clorsulon)。

在本發明中，抗原蟲活性成分包括(但不限於)以下活性成分：

來自三嗪類，例如：地克珠利(diclazuril)、泊那珠利(ponazuril)、來  
曲珠利(letrazuril)、托曲珠利(toltrazuril)；

來自聚醚離子載體類，例如：莫能菌素(monensin)、鹽黴素  
(salinomycin)、馬杜黴素(maduramicin)、那拉黴素(narasin)；

來自巨環內酯類，例如：米爾倍黴素(milbemycin)、紅黴素  
(erythromycin)；

來自喹諾酮類，例如：恩氟沙星(enrofloxacin)、普多沙星  
(pradofloxacin)；

來自奎寧類，例如：氯奎(chloroquine)；

來自嘧啶類，例如：乙胺嘧啶；

來自磺醯胺類，例如：磺胺喹噁啉(sulfaquinoxaline)、甲氧苄啶  
(trimethoprim)、磺胺氯吡嗪(sulfaclozin)；

來自硫胺類，例如：安普羅利(amprolium)；

來自林可醯胺類，例如：克林達黴素(clindamycin)；

來自對稱二苯脲類，例如：咪多卡(imidocarb)；

來自硝基呋喃類，例如：硝呋莫司(nifurtimox)；

來自喹啉酮生物鹼類，例如：鹵夫酮(halofuginon)；

來自其他不同類，例如：羥胺硝喹(oxamniquin)、巴龍黴素  
(paromomycin)；

來自微生物之疫苗或抗原類，例如：羅氏犬巴貝斯蟲(Babesia canis

rossi)、柔嫩艾美耳球蟲(*Eimeria tenella*)、早熟艾美耳球蟲(*Eimeria praecox*)、毒害艾美球蟲(*Eimeria necatrix*)、和緩艾美耳球蟲(*Eimeria mitis*)、巨型艾美爾球蟲(*Eimeria maxima*)、布氏艾美球蟲(*Eimeria brunetti*)、堆形艾美耳球蟲(*Eimeria acervulina*)、韋氏巴貝斯蟲(*Babesia canis vogeli*)、嬰兒利什曼原蟲(*Leishmania infantum*)、犬巴倍蟲屬(*Babesia canis canis*)、網尾線蟲屬(*Dictyocaulus viviparus*)。

在本發明中，所有指定之其他或另外活性成分在其官能基能夠實現此目的時可視情況與適合鹼或酸形成鹽。

基於已知用於評估適用於治療蠕蟲感染之化合物的標準實驗室技術，藉由用於測定對動物之以上所鑑別之病狀之治療的標準毒性測試及標準藥理學分析，且藉由將此等結果與用於治療此等病狀之已知活性成分或藥物之結果進行比較，可容易地決定用於治療各種所要適應症之本發明化合物的有效劑量。治療此等病狀中之一者所投與之活性成分之量可根據諸如以下考慮因素而廣泛變化：所用特定化合物及劑量單位、投與模式、治療週期、所治療個體之年齡及性別，及所治療病狀之性質及程度。

待投與之活性成分總量的範圍一般為每日每公斤體重約0.001毫克至約200毫克且較佳為每日每公斤體重約0.01毫克至約20毫克。臨床上有效之給藥時程之範圍將為一天給藥一至三次至每四週給藥一次。另外，「藥物假期」(其中在一定時間段內不向個體給與藥物)有可能有益於藥理學效應與耐受性之間的整體平衡。另外，有可能具有長效治療，其中該個體接受治療一次持續超過四週。單位劑量有可能含有約0.5 mg至約1500 mg活性成分，且可每日投與一或多次或一日投與少於一次。藉由注射(包括靜脈內、肌肉內、皮下及非經腸注射)及使用輸注技術投與之每日平均劑量

較佳為每公斤總體重0.01至200毫克。平均每日經直腸給藥方案較佳為每公斤總體重0.01至200毫克。平均每日經陰道給藥方案較佳將為每公斤總體重0.01至200毫克。平均每日局部給藥方案較佳為0.1至200 mg，每天投與次數介於一次至四次之間。經皮濃度較佳為維持0.01至200 mg/kg之每日劑量所需之濃度。平均每日吸入給藥方案較佳為每公斤總體重0.01至100毫克。

當然，各個體之特定初始及連續給藥方案將根據以下因素而變：如主治診斷醫師所確定之病狀性質及嚴重程度、所用特定化合物之活性、個體之年齡及一般病狀、投藥時間、投藥途徑、藥物之排泄速率、藥物組合及其類似因素。所要治療方式及本發明化合物或其醫藥學上可接受之鹽或酯或組合物之劑量次數可由熟習此項技術者使用習知治療試驗來確定。

實驗部分

縮寫：

|      |          |
|------|----------|
| aq.  | 水性       |
| DMF  | 二甲基甲醯胺   |
| DMSO | 二甲基亞砷    |
| MTBE | 甲基-第三丁基醚 |
| THF  | 四氫呋喃     |

本申請案中所描述之本發明之各種態樣藉由不意欲以任何方式限制本發明之以下實例來說明。

本文所描述之實例測試實驗用以說明本發明且本發明不限於所給出之實例。

實驗部分-概要部分

在實驗部分中未描述合成之所有試劑為市售的，或為已知化合物，或可藉由熟習此項技術者已知之方法由已知化合物形成。

根據本發明方法製造之化合物及中間物可能需要純化。有機化合物之純化為熟習此項技術者所熟知且可存在若干種純化該化合物之方法。在一些情況下，可不必純化。在一些情況下，化合物可藉由結晶來純化。在一些情況下，可使用適合溶劑攪拌去雜質。在一些情況下，化合物可藉由層析，尤其急驟管柱層析使用例如預填充矽膠筒(例如Biotage SNAP筒 KP-Sil<sup>®</sup>或KP-NH<sup>®</sup>)以及Biotage自動純化器系統(SP4<sup>®</sup>或Isolera Four<sup>®</sup>)及溶離劑(諸如己烷/乙酸乙酯或二氯甲烷/甲醇之梯度)來純化。在一些情況下，化合物可藉由製備型HPLC，使用例如配備有二極體陣列偵測器及/或聯機電噴霧電離質譜儀之Waters自動純化器，與適合之預填充逆相管柱及可含有添加劑(諸如三氟乙酸、甲酸或氨水)的諸如水及乙腈之梯度之溶離劑組合來純化。

在一些情況下，如上文所描述之純化方法可提供具有充分鹼性或酸性官能基、呈鹽形式的本發明之彼等化合物，諸如在本發明化合物為充分鹼性之情況下，例如呈三氟乙酸鹽或甲酸鹽形式；或在本發明化合物為充分酸性之情況下，例如呈銨鹽形式。此類型之鹽可藉由熟習此項技術者所已知之多種方法分別轉化為其游離鹼或游離酸形式，或在後續生物分析中作為鹽來使用。應理解，如分離且如本文描述之本發明化合物之特定形式(例如鹽、游離鹼等)未必為該化合物可應用於生物分析以便定量特定生物活性之唯一形式。

## 分析型及層析方法

### 分析型及製備性液相層析

藉助於如下所述之不同設備來執行分析型(UP)LC-MS。除非指定負模式(ESI-)，否則報導正模式電噴霧電離的質量(m/z)。

### 方法L0：

儀器類型：Waters UPLC系統；管柱：Zorbax Eclipse Plus C18, 50 mm × 2.1 mm, 1.8 μm；溶離劑A：乙腈 + 1 ml 甲酸/L、溶離劑B：密理博 (millipore) 水 + 0.9 ml 甲酸/L；梯度：0.0 min 10% A → 1.7 min 95% A → 2.40 min 95% A → 2.41 min 10% A → 2.5 min 10% A；烘箱：55°C；流速：0.85 ml/min；UV-偵測：210 nm。Waters SQD2 MS偵測器：100-1000 Amu, ES-離子化, 陽性。

### <sup>1</sup>H-NMR資料

<sup>1</sup>H-NMR資料係由以下確定：裝備有流動池(60 μl 體積)之Bruker Avance 400，或裝備有1.7 mm低溫CPTCI探針頭之Bruker AVIII 400，或裝備有5 mm探針頭之Bruker AVIII 400 (400.13 MHz)，或裝備有5 mm低溫TCI探針頭之Bruker AVII 600 (600.13 MHz)，或裝備有5 mm低溫CPMNP探針頭之Bruker AVIII 600 (601.6 MHz)，或裝備有5 mm寬頻頭或5 mm Prodigy™探針頭之Bruker AVIII 500 (500.13 MHz)，其中四甲基矽烷作為參考(0.0)且溶劑為CD<sub>3</sub>CN、CDCl<sub>3</sub>或D<sub>6</sub>-DMSO。替代性<sup>1</sup>H-及<sup>13</sup>C-NMR儀器類型：Bruker DMX300 (<sup>1</sup>H-NMR：300 MHz；<sup>13</sup>C NMR：75 MHz)、Bruker Avance III 400 (<sup>1</sup>H-NMR：400 MHz；<sup>13</sup>C NMR：100 MHz)或Bruker 400 Ultrashield (<sup>1</sup>H-NMR：400 MHz；<sup>13</sup>C NMR：100 MHz)。

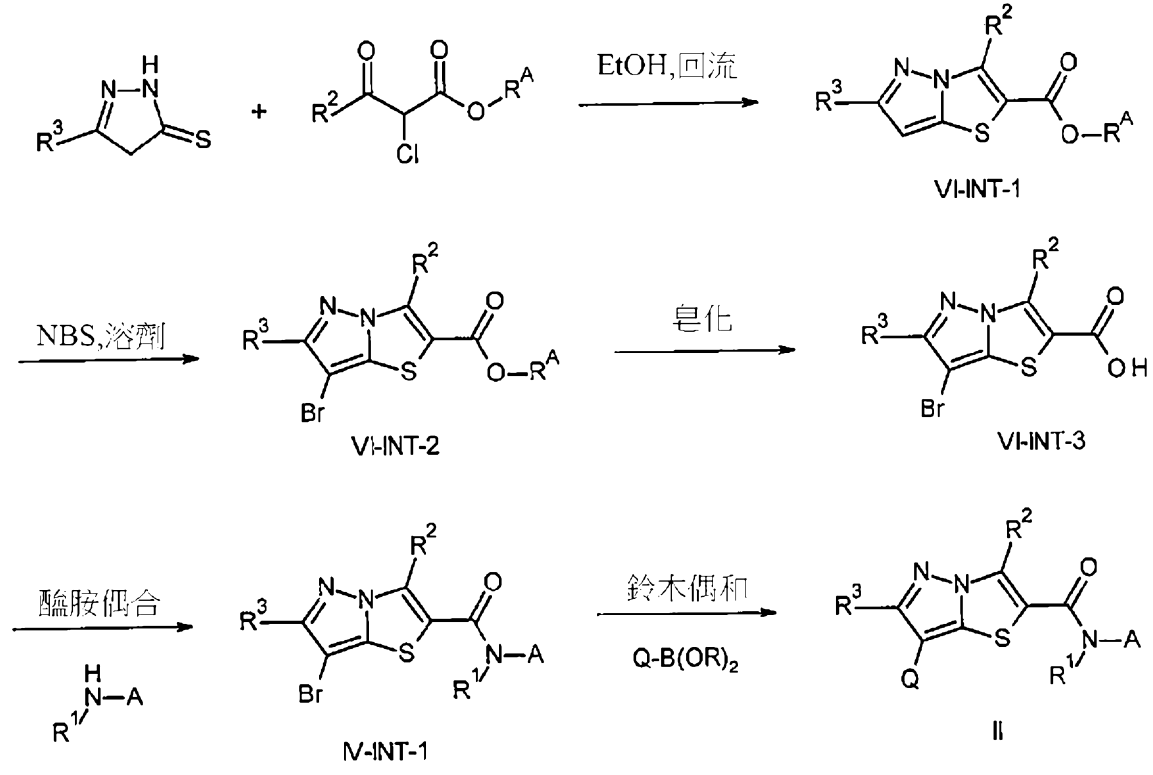
化學位移(δ)以百萬分率[ppm]提供；使用以下縮寫：s=單峰，d=雙重峰，t=三重峰，q=四重峰，m=多重峰，br.=寬峰；偶合常數以赫茲

[Hz]顯示。

實驗部分-通用程序

式(I)及(II)化合物之合成可根據或類似於下列流程1進行。

流程1



其中取代基具有如關於上述中間化合物，諸如特定言之關於上述中間化合物(VI-INT)及(IV-INT)，極特定言之關於上述中間化合物(VI-INT-1)、(VI-INT-2)、(VI-INT-3)及(IV-INT-1)所定義之含義。

某些經取代吡唑硫酮可易於較佳在沸騰情況下藉由2-氯酮酯(其中 $R^A$ 較佳選自甲基、乙基或第三丁基)，溶解於醇(類似乙醇)中來轉化成如US 20040132708中之類似系統所描述之吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸鹽**VI-INT-1**，接著較佳在環境溫度下利用含N-溴代丁二醯亞胺之惰性溶劑，類似於二氯甲烷或四氯甲烷來溴化從而獲得酯類**VI-INT-2**。此類中間產物酯類在水解條件下反應以產生如 Journal of Organic Chemistry, 2004, 69(21), 7058-7065 中之類似合成所描述之吡唑并[5,1-

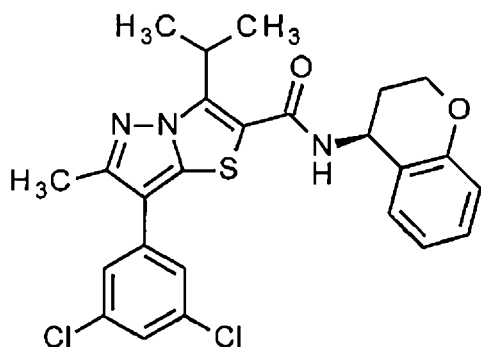
b)[1,3]噻唑-2-甲酸**VI-INT-3**。吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸**VI-INT-3**可藉由醯胺偶合條件，例如經由由**VI-INT-3**（其在鹼性條件下與胺 $R^1$ -NH-A組合）形成之甲酸氯化物，例如吡啶、三乙胺或N,N-二異丙基乙胺或經由由與胺 $R^1$ -NH-A及脫水反應劑組合之甲酸**VI-INT-3**形成醯胺，例如N-(3-二甲胺基異丙基)-N'-乙基碳化二亞胺-氫氯化物(EDC)轉化為對應醯胺**IV-INT-1**。類似合成描述於例如WO 2001016138中。

吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸醯胺**IV-INT-1**可經由如WO 2015154630中之類似反應所描述之與硼酸或硼酸酯 $Q-B(OR)_2$  ( $R=H$ ； $R=$ 甲基或 $R,R=$ 頻哪醇酯)鈴木交叉偶合反應而轉化為經芳基或雜芳基取代之最終化合物**II**。

## 實驗部分-實例

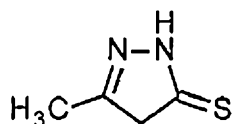
### 實例1

7-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡喃-4-基]-3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺



### 步驟1

5-甲基-2,4-二氫-3H-吡唑-3-硫酮

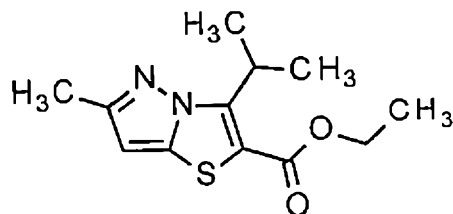


使3-甲基-1H-吡唑-5-醇(20 g, 200 mmol)溶解於甲苯(500 mL)中，接

著添加勞森氏反應劑(Lawesson's reagent) (42 g,100 mmol)。使所得混合物回流9小時且在室溫下靜置隔夜。混合物經濃縮且不經進一步純化即用於下一步驟。

## 步驟2

### 3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸乙酯

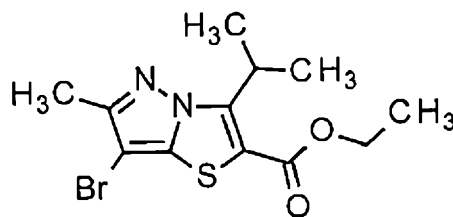


使 2- 氯 -4- 甲 基 -3- 側 氧 基 戊 酸 乙 酯 (120 g,600 mmol) (自 Bioorganic&Medicinal Chemistry Letters,2012,22(20),6338-6342得知)及含5-甲基-2,4-二氫-3H-吡唑-3-硫酮(23 g,200 mmol (理論上期望))之乙醇(600 mL)之混合物回流8 h且接著在真空中濃縮。殘基經水處理，且用乙酸乙酯萃取所得混合物。合併之有機溶劑經硫酸鈉乾燥，且在真空中濃縮。剩餘油係經由矽膠管柱(95:5己烷/乙酸乙酯)純化從而獲得呈無色固體狀之標題化合物。

產量：3.7 g (14.7 mmol；理論值之7.33%)

## 步驟3

### 7-溴-3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸乙酯



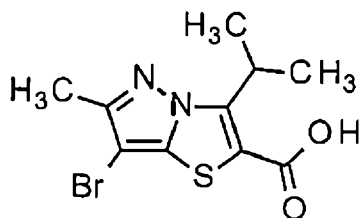
向3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸乙酯(3.7 g,14.7 mmol)於無水四氯化碳(100 mL)中之溶液中添加N-溴代丁二醯亞胺(2.9 g,16 mmol)。將所得混合物在室溫下攪拌4小時。接著，用二氯甲烷稀釋

並用水，接著鹽水洗滌。將經分離之有機層用硫酸鈉乾燥。產物不經進一步純化即用於下一步驟中。

產量：4.8 g (14.5 mmol；理論值之98.6%)

#### 步驟4

##### 7-溴-3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸



向7-溴-3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸乙酯(4.8 g, 14.5 mmol)於EtOH (100 mL)、水(100 mL)及THF (50 mL)中之溶液中添加LiOH (1 g, 41.67 mmol)。在室溫下攪拌所得溶液隔夜。將混合物濃縮直至剩餘水溶液，利用二氯甲烷洗滌三次且用濃HCl酸化。過濾經沈澱之產物，用水洗滌且乾燥。

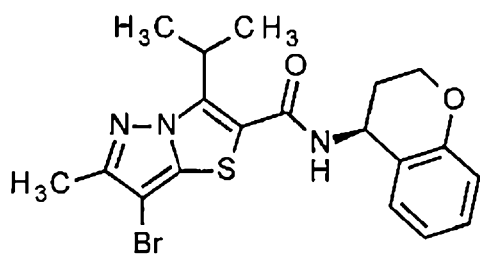
產量：3 g (純度85 %; 8.41 mmol；理論值之58.0 %)

LC-MS (方法L0)： $R_t = 1.39$  min；MS (ESIpos)： $m/z = 302.9$ ； $304.9$   $[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  (399,95) MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  [ppm]: 14.00 (bs, 1H, COOH), 4.37 (hept, 1H), 2.33 (s, 1H), 1.44 (d, 6H)。

#### 步驟5

##### 7-溴-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺



向燒瓶中饋入含7-溴-3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲酸(3.0 g, 85% 純度, 8.41 mmol)、(4S)-吡啶-4-胺氫氯化物(1.87 g, 10.09 mmol)、N,N-二異丙基乙胺(2.17 g, 16.82 mmol)、4-(N,N-二甲胺基)吡啶(513.8 mg, 4.21 mmol)、1-羥基-1H-苯并三唑(568.3 mg, 4.21 mmol)及1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳化二亞胺氫氯化物(1.61 g, 8.41 mmol)之125 mL二氯甲烷。在環境溫度下攪拌反應混合物隔夜，接著與水混合，分離二氯甲烷相，經由硫酸鈉/矽膠濾筒乾燥且在減壓下移除溶劑。所得殘餘物藉由矽膠管柱層析(溶離劑環己烷/乙酸乙酯梯度)純化從而獲得標題化合物。

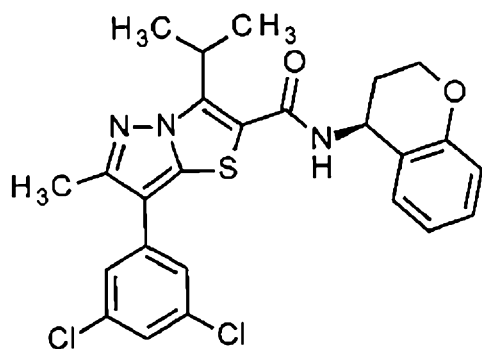
產量：2.0 g (4.6 mmol，理論值之54.7 %)

LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.70$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 434.0$ ; 435.9  $[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  (399,95) MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  [ppm]: 8.91 (d, 1H, NH), 7.20 - 7.15 (m, 2H), 6.92 - 6.89 (dd, 1H), 6.81 (d, 1H), 5.24 - 5.19 (m, 1H), 4.30 - 4.20 (m, 2H), 4.09 - 4.02 (hept, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.16 - 2.05 (m, 2H), 1.47 (d, 6H).

## 步驟6

7-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-3-異丙基-6-甲基-吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺



向微波管中饋入3 mL二噁烷、7-溴-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-3-異丙基-6-甲基吡啶并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺(150 mg,0.34 mmol)、3,5-二氯苯基硼酸(54.9 mg,0.28 mmol)、水性2M碳酸鈉溶液(1.44 mL)及(1,1'-雙(二苯膦基)-二茂鐵-鈾-二氯甲烷複合物(21 mg,0.02 mmol)。反應混合物經氫脫氣5 min且在微波裝置(Biotage)中在100℃下經處理40 min。經由矽膠/硫酸鈉濾筒將粗製混合物過濾並洗滌。濾過物之溶劑在減壓下經蒸發；剩餘原料使用環己烷/乙酸乙酯梯度藉由急驟管柱層析來純化從而獲得呈灰白色固體之標題化合物。

產量：92.6 mg(0.185mmol，關於硼酸理論值之66.1%)。

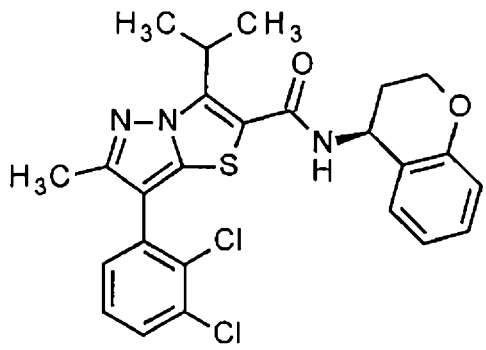
LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.93$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 500.0$ ; 501.9  $[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  (399,95) MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  [ppm]: 8.92 (d, 1H, NH), 7.53 (s, 1H), 7.46 (s, 2H), 7.21 - 7.15 (m, 2H), 6.91 (t, 1H), 6.81 (d, 1H), 5.26 - 5.21 (q, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 3H), 2.56 (s, 3H), 2.12 - 2.06 (m, 2H), 1.51 (d, 6H)。

類似地製備以下**實例2-15**：

## 實例2

**7-(2,3-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡啶并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**



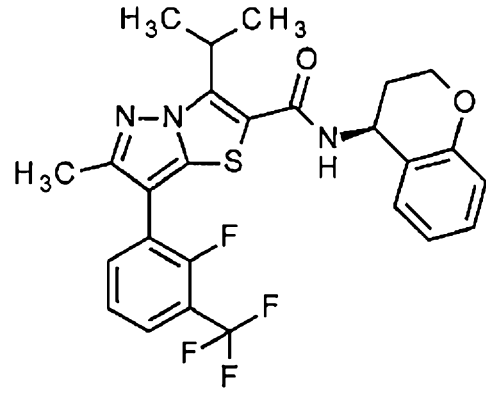
LC-MS( 方 法 L0) :  $R_t=1.77$  min ;

MS(ESIpos): $m/z=500.0;502.0[M+H]^+$  。

$^1\text{H-NMR}$  參看NMR峰清單表1 。

實例3

7-[2-氟-3-(三氟甲基)苯基]-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡啶并[5,1-b][1,3]噻啶-2-甲醯胺

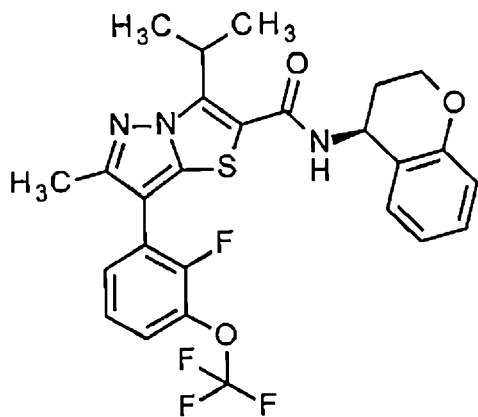


LC-MS ( 方法 L0):  $R_t = 1.82$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 518.1$   $[M+H]^+$  。

$^1\text{H-NMR}$  參見NMR峰清單表1 。

實例4

N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-7-[2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基]-3-異丙基-6-甲基吡啶并[5,1-b][1,3]噻啶-2-甲醯胺

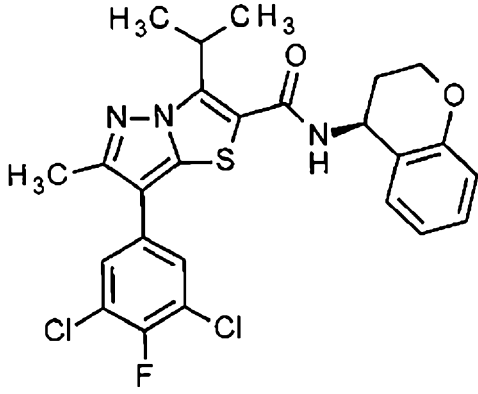


LC-MS (方法 L0):  $R_t = 1.79$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 534.0$   $[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  參見 NMR 峰清單表 1。

**實例 5**

**7-(3,5-二氯-4-氟苯基)-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-3-異丙基-6-甲基吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**

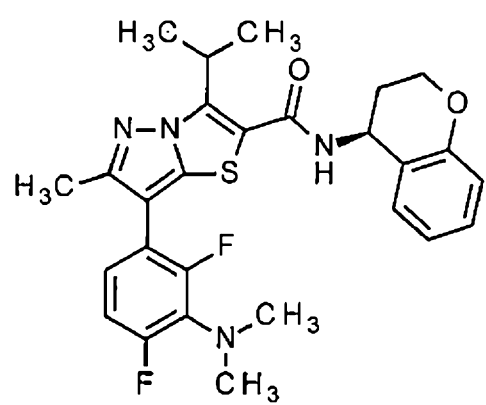


LC-MS (方法 L0):  $R_t = 1.80$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 518.2$   $[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  參見 NMR 峰清單表 1。

**實例 6**

**N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-7-[3-(二甲胺基)-2,4-二氟苯基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**

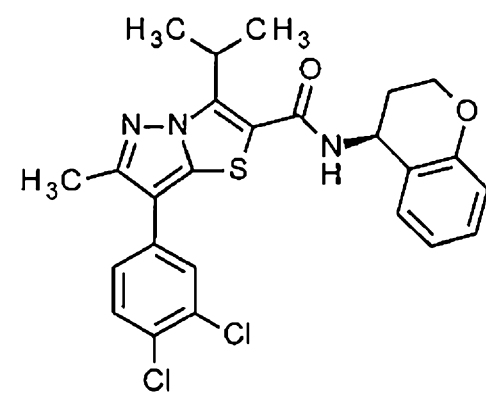


LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.83 \text{ min}$ ; MS (ESIpos):  $m/z = 511.2$   
[M+H]<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H-NMR 參見NMR峰清單表1。

**實例7**

**7-(3,4-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**

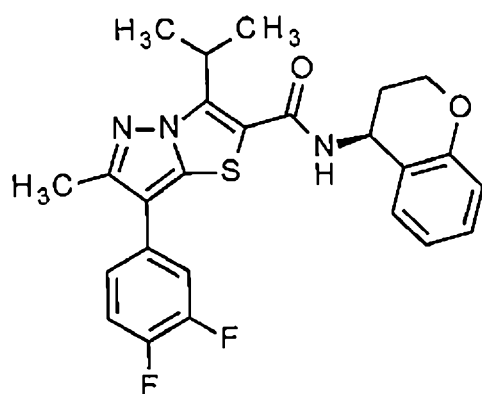


LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.89 \text{ min}$ ; MS (ESIpos):  $m/z = 500.0; 501.9$   
[M+H]<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H-NMR 參見NMR峰清單表1。

**實例8**

**7-(3,4-二氟苯基)-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**



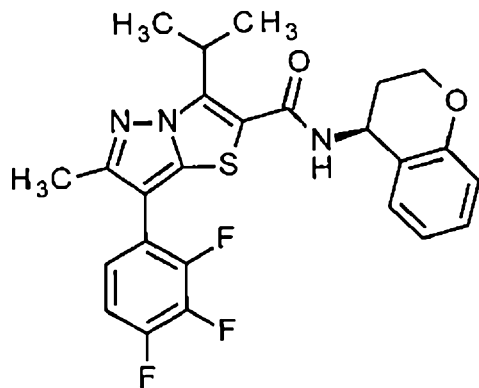
LC-MS (方法 L0):  $R_t = 1.63 \text{ min}$ ; MS (ESIpos):  $m/z = 468.3$

$[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  參見 NMR 峰清單表 1。

**實例 9**

**N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)-7-(2,3,4-三氟  
苯基)吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**



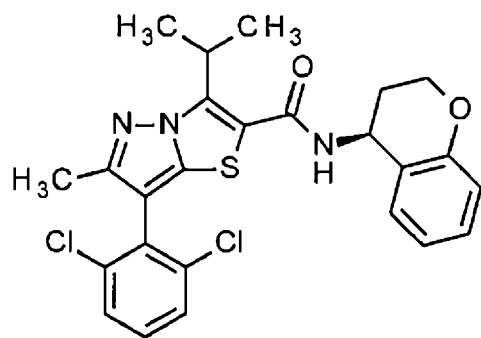
LC-MS (方法 L0):  $R_t = 1.63 \text{ min}$ ; MS (ESIpos):  $m/z = 486.3$

$[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  參見 NMR 峰清單表 1。

**實例 10**

**7-(2,6-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-  
基)吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**

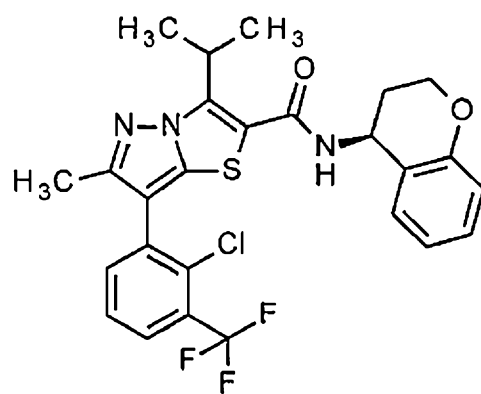


LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.71$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 500.0; 501.9$   
[M+H]<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H-NMR 參見NMR峰清單表1。

**實例11**

7-[2-氯-3-(三氟甲基)苯基]-N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡啶并[5,1-b][1,3]噻啶-2-甲醯胺

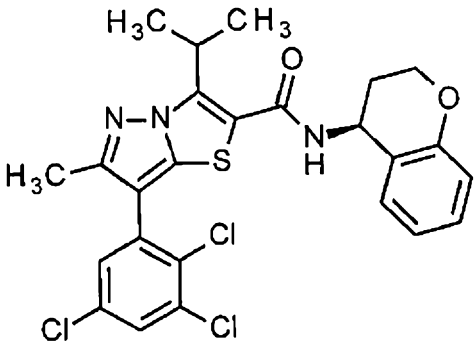


LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.67$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 534.3$   
[M+H]<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H-NMR 參見NMR峰清單表1。

**實例12**

N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)-7-(2,3,5-三氯苯基)吡啶并[5,1-b][1,3]噻啶-2-甲醯胺



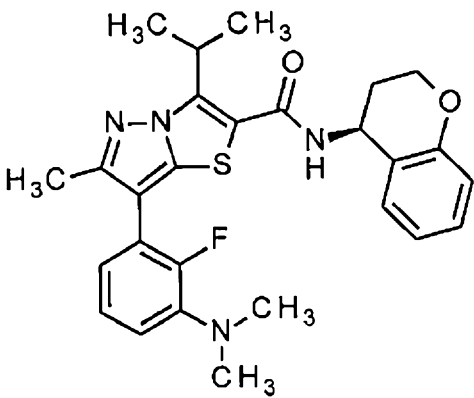
LC-MS (方法 L0):  $R_t = 1.79 \text{ min}$ ; MS (ESIpos):  $m/z = 536.2$

$[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  參見 NMR 峰清單表 1。

**實例 13**

**N-[(4S)-3,4-二氫-2H-吡嗪-4-基]-7-[3-(二甲胺基)-2-氟苯基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**



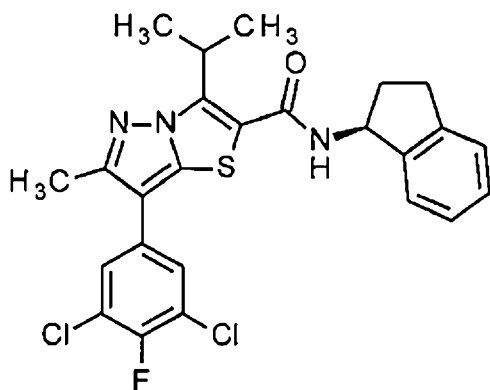
LC-MS (方法 L0):  $R_t = 1.62 \text{ min}$ ; MS (ESIpos):  $m/z = 493.3$

$[M+H]^+$ 。

$^1\text{H-NMR}$  參見 NMR 峰清單表 1。

**實例 14**

**7-(3,5-二氯-4-氟苯基)-N-[(1S)-2,3-二氫-1H-茚-1-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**

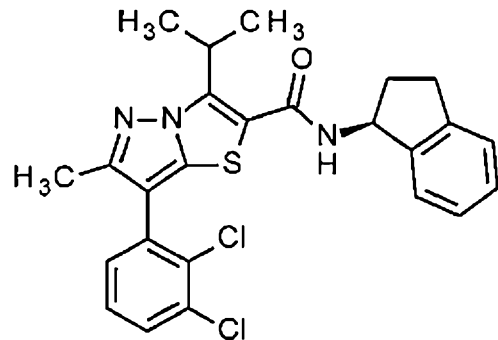


LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.96$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 502.1; 504.1$   
[M+H]<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H-NMR 參見NMR峰清單表1。

**實例15**

**7-(2,3-二氯苯基)-N-[(1S)-2,3-二氫-1H-茚-1-基]-6-甲基-3-(丙-2-基)  
吡唑并[5,1-b][1,3]噻唑-2-甲醯胺**



LC-MS (方法L0):  $R_t = 1.89$  min; MS (ESIpos):  $m/z = 484.1; 486.1$   
[M+H]<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H-NMR 參見NMR峰清單表1。

**NMR峰清單**

所選實例之<sup>1</sup>H-NMR資料以<sup>1</sup>H-NMR峰清單之形式書寫。對於各信號峰，列舉以ppm為單位之 $\delta$ 值及在圓括號中之信號強度。在 $\delta$ 值-信號強度對之間係作為分隔符之分號。

因此，實例之峰清單具有以下形式：

$\delta_1$  (強度<sub>1</sub>) ;  $\delta_2$  (強度<sub>2</sub>) ; ..... ;  $\delta_i$  (強度<sub>i</sub>) ; ..... ;  $\delta_n$  (強度<sub>n</sub>)

在列印之NMR光譜實例中，尖銳信號之強度與信號高度(以cm為單位)相關且顯示信號強度之實際關係。自寬信號，可顯示信號之若干峰值或中間值及其相比於光譜中之最密集信號之相對強度。

為針對<sup>1</sup>H光譜校準化學位移，吾等使用四甲基矽烷及/或所用溶劑之化學位移，在DMSO中量測之光譜之情況下尤其如此。因此，在NMR峰清單中，四甲基矽烷峰可能但不一定出現。

<sup>1</sup>H-NMR峰清單類似於傳統<sup>1</sup>H-NMR列印，且因此通常含有列於傳統NMR解釋中之所有峰。

另外，其可如傳統<sup>1</sup>H-NMR列印一樣顯示溶劑信號、目標化合物之立體異構體(其亦為本發明之目的)及/或雜質之峰值。

為在溶劑及/或水之 $\delta$ 範圍(delta-range)中顯示化合物信號，溶劑之常見峰(例如DMSO於DMSO-D<sub>6</sub>中之峰)及水之峰顯示於吾人之<sup>1</sup>H-NMR峰清單中且通常具有平均之高強度。

目標化合物之立體異構體之峰及/或雜質之峰通常具有平均比目標化合物(例如具有大於90%之純度)之峰低的強度。

此類立體異構體及/或雜質對於特定製備方法而言可為典型的。因此其峰可經由「副產物指紋」幫助辨認吾人之製備方法之再現。

用已知方法(MestreC、ACD模擬，以及用憑經驗評估之期望值)計算目標化合物之峰值的專家可視情況使用另外的強度過濾器按需要分離目標化合物之峰。此分離將類似於傳統的<sup>1</sup>H-NMR解譯處之相關峰挑選。

具有峰清單之NMR資料描述的其他詳情見於研究揭示資料庫編號564025之公開案「Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications」中。

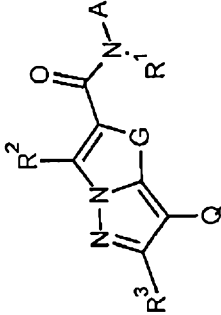
表1：NMR峰清單

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 實例1： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.924(2.5);8.904(2.5);8.312(0.7);7.529(2.6);7.525(5.2);7.520(3.5);7.460(10.6);7.456(10.1);7.210(2.3);7.191(3.8);7.171(2.3);7.153(1.4);6.926(1.7);6.907(2.8);6.888(1.3);6.810(3.1);6.791(2.8);5.258(0.6);5.242(1.5);5.223(1.5);5.207(0.6);4.316(0.4);4.308(0.6);4.299(0.5);4.289(1.4);4.280(1.2);4.272(1.3);4.261(1.2);4.252(1.3);4.240(2.1);4.223(2.8);4.205(1.8);4.187(0.5);3.320(470.7);2.670(1.6);2.555(19.6);2.505(204.0);2.501(276.3);2.498(221.3);2.328(1.6);2.115(1.5);2.107(1.4);2.097(1.6);2.088(1.3);2.070(0.8);2.053(0.4);1.506(16.0);1.489(16.0);0.000(13.9)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| 實例2： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.864(2.0);8.843(2.1);8.313(0.4);8.141(0.5);7.689(2.2);7.669(2.5);7.535(1.8);7.516(3.0);7.463(2.2);7.443(3.0);7.423(1.2);7.195(2.2);7.176(3.2);7.161(2.2);7.141(1.3);6.912(1.5);6.894(2.5);6.875(1.2);6.799(2.8);6.779(2.5);5.240(0.6);5.223(1.4);5.206(1.3);5.190(0.6);4.292(0.5);4.273(1.3);4.263(1.2);4.255(1.3);4.246(1.6);4.237(1.3);4.226(1.2);4.216(1.3);4.198(0.5);4.174(0.4);4.156(1.1);4.138(1.4);4.121(1.1);4.102(0.4);3.318(160.2);2.670(1.4);2.540(1.4);2.501(227.1);2.337(16.0);2.115(1.1);2.110(1.0);2.092(1.0);2.073(3.7);2.048(0.7);1.520(10.6);1.505(10.6);1.502(10.4);0.000(1.4)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| 實例3： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.916(2.0);8.896(2.0);7.958(1.0);7.940(1.9);7.922(1.0);7.779(0.9);7.760(1.9);7.743(1.1);7.538(1.4);7.519(2.4);7.499(1.1);7.201(2.0);7.182(3.2);7.166(2.1);7.147(1.3);6.919(1.5);6.900(2.5);6.882(1.2);6.805(2.7);6.785(2.5);5.754(4.1);5.248(0.6);5.231(1.3);5.214(1.3);5.197(0.6);4.309(0.4);4.300(0.6);4.281(1.3);4.272(1.0);4.264(1.2);4.254(1.0);4.246(1.0);4.237(1.2);4.228(1.4);4.219(1.5);4.210(1.5);4.192(1.9);4.174(1.1);4.157(0.4);3.319(51.9);2.892(0.8);2.733(0.7);2.672(0.4);2.507(44.2);2.503(57.1);2.499(44.2);2.460(16.0);2.329(0.4);2.145(0.4);2.133(0.7);2.116(1.1);2.108(1.4);2.091(1.3);2.080(1.1);2.074(0.8);2.063(0.7);2.055(0.5);1.517(11.4);1.502(11.1);1.500(11.1);0.007(2.8);0.000(42.3);-0.001(41.9)                                                                                                                                                                                              |
| 實例4： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.904(2.1);8.883(2.1);7.663(0.9);7.659(1.1);7.643(2.0);7.627(1.2);7.623(1.2);7.565(0.8);7.545(1.6);7.526(1.0);7.438(1.5);7.435(1.6);7.415(2.4);7.398(1.0);7.395(1.0);7.202(2.0);7.183(3.1);7.167(2.0);7.148(1.3);7.144(1.1);6.922(1.4);6.919(1.6);6.903(2.4);6.900(2.6);6.884(1.1);6.882(1.2);6.806(2.7);6.804(2.7);6.786(2.5);6.784(2.4);5.248(0.5);5.231(1.2);5.214(1.2);5.197(0.5);4.307(0.4);4.299(0.6);4.290(0.4);4.280(1.3);4.270(1.1);4.262(1.2);4.253(1.1);4.248(1.1);4.239(1.1);4.230(1.0);4.220(1.4);4.212(0.5);4.201(0.9);4.193(0.5);4.184(1.2);4.166(1.6);4.149(1.2);4.131(0.4);3.317(36.2);2.671(0.4);2.524(1.1);2.511(23.9);2.507(49.5);2.502(66.4);2.498(48.9);2.493(24.2);2.452(16.0);2.329(0.4);2.146(0.4);2.135(0.7);2.126(0.8);2.118(1.0);2.104(1.1);2.095(1.1);2.086(1.0);2.074(3.5);2.060(0.7);2.052(0.5);2.043(0.3);1.518(10.6);1.514(11.0);1.500(10.7);1.496(10.7);0.008(2.0);0.000(59.3);-0.008(2.4) |
| 實例5： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.910(2.0);8.890(2.0);8.311(0.4);7.612(7.2);7.596(7.1);7.204(2.3);7.186(3.2);7.171(2.3);7.152(1.4);6.923(1.6);6.906(2.7);6.888(1.2);6.810(3.0);6.790(2.7);5.256(0.6);5.239(1.4);5.222(1.4);5.206(0.6);4.316(0.4);4.307(0.6);4.299(0.5);4.288(1.4);4.279(1.2);4.271(1.2);4.261(1.1);4.250(1.3);4.242(1.4);4.231(2.1);4.224(1.8);4.213(2.0);4.205(1.0);4.195(1.5);4.177(0.5);3.334(255.5);3.326(148.8);2.676(0.7);2.672(0.9);2.667(0.7);2.542(67.6);2.530(22.4);2.507(114.1);2.502(149.8);2.498(110.9);2.368(0.4);2.329(0.9);2.325(0.7);2.148(0.4);2.137(0.8);2.120(1.2);2.112(1.5);2.104(1.3);2.095(1.5);2.086(1.2);2.078(0.8);2.068(0.7);2.060(0.5);2.051(0.3);1.504(16.0);1.487(15.9);0.008(0.5);0.000(15.2);-0.008(0.6)                                                                                                                                                                                                    |

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 實例6： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.858(0.4);8.837(0.4);7.196(0.5);7.179(0.6);7.164(0.4);6.900(0.4);6.803(0.5);6.783(0.5);3.320(18.1);2.845(3.9);2.511(5.2);2.506(10.7);2.502(14.8);2.498(10.9);2.493(5.2);2.395(2.7);1.511(1.7);1.507(1.7);1.494(1.8);1.398(16.0);1.168(0.7);0.008(0.4);0.000(11.1);-0.008(0.4)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| 實例7： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.919(2.8);8.899(2.8);7.741(5.9);7.720(7.0);7.658(6.3);7.479(3.5);7.463(3.2);7.458(3.2);7.210(2.6);7.191(4.2);7.172(2.6);7.153(1.7);7.150(1.5);6.927(1.9);6.925(2.1);6.908(3.2);6.906(3.4);6.890(1.5);6.887(1.6);6.811(3.5);6.809(3.5);6.791(3.3);6.789(3.2);5.256(0.7);5.239(1.6);5.221(1.6);5.205(0.7);4.316(0.5);4.308(0.7);4.298(0.5);4.289(1.7);4.272(1.5);4.262(1.2);4.254(1.2);4.245(1.4);4.236(1.3);4.226(1.8);4.219(1.1);4.207(1.0);4.201(1.9);4.184(2.1);4.166(1.6);4.148(0.6);3.318(69.9);2.676(0.4);2.671(0.5);2.666(0.4);2.548(27.2);2.524(1.4);2.519(2.0);2.511(3.0);2.506(63.1);2.502(84.9);2.497(62.7);2.493(31.2);2.333(0.4);2.329(0.5);2.324(0.4);2.167(0.4);2.161(0.4);2.153(0.5);2.141(0.9);2.134(0.9);2.125(1.3);2.114(1.5);2.103(1.3);2.096(1.3);2.086(1.4);2.074(1.4);2.069(0.9);2.061(0.6);2.052(0.4);2.043(0.3);1.508(15.6);1.506(16.0);1.491(15.6);1.489(15.8);0.146(0.4);0.008(2.9);0.000(85.5);-0.008(3.6);-0.150(0.4)                                                                                                                 |
| 實例8： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.880(0.8);8.861(1.6);8.844(1.0);8.289(0.7);8.284(0.9);7.553(0.7);7.526(1.3);7.504(1.4);7.500(1.3);7.491(1.2);7.485(1.1);7.477(1.0);7.472(1.0);7.467(1.0);7.442(0.4);7.296(1.4);7.208(2.6);7.189(3.5);7.164(2.0);7.145(1.2);6.916(1.2);6.899(2.1);6.881(1.0);6.879(0.9);6.804(2.6);6.784(2.3);5.256(0.7);5.239(1.6);5.221(1.6);5.204(0.7);4.319(0.5);4.310(0.7);4.302(0.6);4.291(1.6);4.283(1.4);4.274(1.4);4.265(1.2);4.252(1.1);4.244(1.3);4.233(1.3);4.225(1.7);4.206(1.1);4.198(0.8);4.188(1.1);4.171(1.5);4.153(1.1);4.135(0.5);3.324(90.8);3.320(70.2);3.314(88.7);2.714(0.4);2.678(0.5);2.674(0.8);2.669(0.6);2.544(108.6);2.530(27.4);2.523(5.1);2.514(46.4);2.509(96.0);2.505(128.3);2.500(94.2);2.496(46.8);2.370(0.5);2.336(0.6);2.332(0.8);2.327(0.6);2.168(0.4);2.161(0.4);2.154(0.5);2.142(0.9);2.133(1.0);2.126(1.4);2.117(1.6);2.112(1.5);2.099(1.4);2.089(1.3);2.082(1.0);2.072(0.8);1.510(1.6);1.494(15.4);1.492(15.8);0.000(21.4)                                                                                                               |
| 實例9： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.899(1.9);8.879(1.9);8.311(2.2);7.444(1.9);7.423(3.0);7.410(2.7);7.389(0.4);7.200(2.0);7.182(3.0);7.167(2.1);7.147(1.3);7.144(1.1);6.917(1.5);6.901(2.4);6.880(1.1);6.805(2.7);6.784(2.4);5.241(0.6);5.222(1.2);5.206(1.2);5.189(0.6);4.295(0.6);4.286(0.5);4.278(1.3);4.268(1.2);4.260(1.2);4.250(1.3);4.238(1.2);4.228(1.1);4.219(1.3);4.200(0.6);4.192(0.4);4.166(0.4);4.149(1.0);4.131(1.5);4.114(1.1);4.096(0.5);3.413(0.7);3.330(1612.8);3.324(894.4);3.226(0.6);3.194(0.4);2.711(1.0);2.675(3.6);2.671(5.0);2.666(3.7);2.662(1.8);2.541(291.1);2.524(13.9);2.511(314.6);2.506(649.9);2.502(863.2);2.497(628.5);2.493(308.6);2.416(16.0);2.367(1.4);2.337(2.0);2.333(4.0);2.328(5.4);2.324(4.6);2.292(0.5);2.266(0.4);2.254(0.3);2.153(0.6);2.148(0.6);2.126(1.0);2.118(1.1);2.113(1.0);2.098(1.0);2.091(0.9);2.080(1.1);2.072(1.2);2.054(0.8);2.045(0.6);2.037(0.5);2.027(0.4);1.512(10.3);1.507(10.8);1.494(1.0);1.489(10.4);1.466(0.6);1.447(0.5);1.442(0.5);1.297(0.5);1.259(0.8);1.235(1.1);0.146(0.4);0.008(3.4);0.000(104.8);-0.008(4.2);-0.150(0.5) |
| 實例10： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.876(1.9);8.855(1.9);7.953(1.6);7.634(4.8);7.614(6.3);7.499(2.3);7.479(2.9);7.459(1.4);7.194(1.9);7.174(3.0);7.154(2.0);7.135(1.2);6.903(1.4);6.885(2.4);6.866(1.1);6.792(2.6);6.771(2.4);5.754(7.6);5.229(0.5);5.212(1.2);5.194(1.2);5.177(0.5);4.282(0.4);4.262(1.2);4.253(1.1);4.244(1.4);4.238(1.6);4.221(1.1);4.212(1.2);4.192(0.4);4.127(0.4);4.109(1.0);4.091(1.4);4.074(1.1);4.056(0.5);3.321(70.2);2.891(8.6);2.732(8.1);2.671(0.4);2.541(1.4);2.502(63.8);2.376(0.4);2.329(0.4);2.205(16.0);2.154(0.3);2.141(0.4);2.129(0.6);2.113(0.8);2.106(0.8);2.089(0.4);2.080(0.5);2.070(0.6);2.062(0.9);2.053(0.9);2.045(0.8);2.035(0.6);2.027(0.5);2.018(0.4);1.989(0.5);1.530(8.2);1.522(8.9);1.512(8.6);1.505(8.4);1.252(0.3);1.234(0.7);1.175(0.4);0.000(61.9)                                                                                                                                                                                                                                                                                              |

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 實例11： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=20.012(0.4);8.871(1.4);8.850(1.5);8.310(1.7);7.907(1.5);7.887(1.9);7.862(1.8);7.658(1.1);7.638(2.0);7.618(1.0);7.282(0.6);7.258(0.6);7.189(1.6);7.170(2.0);7.159(1.7);7.140(1.1);6.907(1.2);6.888(1.9);6.869(1.0);6.796(2.0);6.778(1.9);5.223(1.0);5.206(0.9);4.269(0.9);4.252(0.9);4.242(1.0);4.232(0.9);4.221(0.9);4.212(1.3);4.194(1.1);4.177(1.1);4.159(0.8);3.344(1031.4);3.339(645.0);3.329(682.0);3.327(664.2);2.711(1.6);2.676(2.9);2.671(3.9);2.667(2.9);2.542(392.0);2.525(10.6);2.520(15.5);2.511(217.9);2.507(456.1);2.502(611.0);2.498(444.7);2.493(218.2);2.368(1.4);2.345(16.0);2.334(3.0);2.329(3.8);2.324(2.9);2.185(0.4);2.086(0.8);2.072(0.9);2.063(0.8);1.653(0.7);1.528(7.9);1.524(8.3);1.510(8.1);1.506(8.2);1.298(0.4);1.259(0.6);1.236(0.9);1.046(0.4);1.030(0.4);0.008(0.9);0.000(25.0);-0.008(0.9)                     |
| 實例12： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=20.012(0.4);8.889(1.4);8.869(1.5);8.310(1.1);7.887(3.4);7.881(3.8);7.664(3.9);7.657(3.9);7.193(1.6);7.174(1.9);7.163(1.7);7.144(1.1);6.912(1.2);6.893(2.0);6.874(1.0);6.802(2.1);6.781(1.9);5.221(1.0);5.204(0.9);4.273(1.0);4.264(0.9);4.255(0.9);4.244(1.1);4.235(0.9);4.225(0.8);4.216(1.0);4.196(0.4);4.153(0.8);4.136(1.0);4.118(0.8);3.348(1346.3);3.341(476.6);3.337(406.5);3.329(362.4);2.712(1.2);2.676(2.3);2.672(3.2);2.667(2.4);2.542(309.5);2.525(8.6);2.520(12.8);2.512(173.5);2.507(364.2);2.498(353.7);2.494(171.5);2.368(1.1);2.348(16.0);2.334(2.3);2.329(3.0);2.325(2.2);2.116(0.7);2.092(0.7);2.073(0.7);2.064(0.8);1.517(7.7);1.512(8.0);1.499(7.8);1.494(7.6);1.298(0.3);1.259(0.4);1.235(0.6);0.000(21.4)                                                                                                                 |
| 實例13： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.852(0.9);8.831(0.9);7.199(0.9);7.179(1.4);7.164(1.1);7.147(1.5);7.128(0.9);7.045(0.5);7.042(0.6);7.026(0.9);7.010(0.4);7.006(0.4);6.983(0.5);6.979(0.5);6.962(0.8);6.941(0.4);6.938(0.4);6.920(0.6);6.918(0.7);6.902(1.1);6.899(1.1);6.883(0.5);6.880(0.5);6.802(1.2);6.800(1.2);6.782(1.1);6.779(1.1);5.228(0.5);5.211(0.5);4.281(0.6);4.272(0.4);4.264(0.5);4.255(0.4);4.245(0.4);4.236(0.5);4.226(0.4);4.218(0.6);4.165(0.5);4.148(0.7);4.130(0.5);3.341(99.0);3.333(113.1);2.797(16.0);2.712(0.4);2.672(0.4);2.542(100.3);2.525(1.3);2.520(1.8);2.512(24.4);2.507(50.7);2.503(67.6);2.498(49.4);2.494(24.4);2.411(6.9);2.368(0.4);2.329(0.4);2.117(0.4);2.106(0.5);2.096(0.4);2.088(0.5);2.078(0.5);1.516(4.7);1.511(4.8);1.498(4.8);1.494(4.7);0.000(3.6)                                                                                 |
| 實例14： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.813(2.1);8.793(2.1);7.952(0.4);7.616(7.8);7.601(7.8);7.282(1.3);7.267(3.2);7.252(2.9);7.246(3.2);7.239(3.7);7.232(3.4);7.225(3.7);7.216(1.6);6.927(0.6);5.753(5.3);5.532(0.6);5.511(1.6);5.490(1.6);5.470(0.6);4.248(0.4);4.231(1.0);4.213(1.4);4.196(1.0);4.178(0.4);3.318(204.7);3.028(0.5);3.021(0.5);3.007(0.6);2.998(0.6);2.989(0.9);2.982(0.9);2.967(0.9);2.960(0.8);2.891(2.9);2.866(1.4);2.847(1.0);2.826(0.8);2.806(0.4);2.732(2.3);2.670(1.2);2.540(4.0);2.530(18.7);2.505(152.0);2.501(202.6);2.497(158.7);2.472(1.4);2.463(1.2);2.452(1.0);2.441(1.0);2.432(0.8);2.420(0.4);2.412(0.4);2.328(1.2);2.324(1.0);2.049(0.4);2.027(1.1);2.017(0.5);2.006(1.1);1.996(1.0);1.988(0.5);1.975(1.0);1.954(0.4);1.508(16.0);1.490(15.9);1.252(1.2);1.235(1.5);1.169(0.9);1.152(0.8);0.900(0.7);0.883(0.7);0.146(0.9);0.000(182.8);-0.150(1.0) |
| 實例15： <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>δ=8.766(1.2);8.746(1.3);8.313(0.6);7.691(1.5);7.687(1.7);7.671(1.8);7.667(1.9);7.538(1.2);7.534(1.4);7.519(2.2);7.515(1.9);7.465(2.1);7.445(2.8);7.426(1.2);7.273(0.7);7.257(1.6);7.243(1.1);7.239(1.1);7.231(3.5);7.222(2.0);7.216(2.4);7.208(0.7);7.201(0.5);5.510(0.3);5.491(1.0);5.470(1.0);5.450(0.3);4.160(0.6);4.142(0.9);4.124(0.7);3.317(71.4);3.004(0.3);2.990(0.4);2.982(0.4);2.972(0.5);2.965(0.6);2.950(0.6);2.942(0.5);2.880(0.4);2.858(0.8);2.838(0.6);2.818(0.5);2.675(0.5);2.670(0.6);2.666(0.5);2.524(1.8);2.510(35.6);2.506(74.4);2.501(103.8);2.497(79.5);2.492(39.8);2.469(0.7);2.461(0.6);2.449(0.6);2.438(0.6);2.430(0.5);2.337(13.1);1.996(0.7);1.975(0.7);1.965(0.7);1.944(0.6);1.525(9.8);1.508(9.8);1.398(16.0);0.000(9.0);-0.008(0.3)                                                                                  |

表2：實例



(I)

| No. | G | R1 | R2  | R3 | Q                  | A                     |
|-----|---|----|-----|----|--------------------|-----------------------|
| 1   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 3,5-二氯苯基           | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 2   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2,3-二氯苯基           | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 3   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2-氟-3-(三氟甲基)苯基     | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 4   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基    | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 5   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 3,5-二氯-4-氟苯基       | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 6   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2,4-二氟-3-(二甲胺基)-苯基 | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 7   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 3,4-二氯苯基           | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 8   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 3,4-二氟苯基           | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 9   | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2,3,4-三氟苯基         | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 10  | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2,6-二氯苯基           | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 11  | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2-氯-3-(三氟甲基)苯基     | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 12  | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2,3,5-三氯苯基         | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 13  | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2-氟-3-(二甲胺基)-苯基    | (4S)-3,4-二氫-2H-吡啶-4-基 |
| 14  | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 3,5-二氯-4-氟苯基       | (1S)-2,3-二氫-1H-茚-1-基  |
| 15  | S | H  | 異丙基 | 甲基 | 2,3-二氯苯基           | (1S)-2,3-二氫-1H-茚-1-基  |

## 實驗部分-生物分析

在所選生物分析中測試實例一或多次。當測試超過一次時，資料係以平均值形式或以中位值形式報導，其中

- 平均值(亦稱為算術平均值)表示所獲得值之總和除以所測試次數，且
- 中值表示當以升序或降序排列時該組值的中間數。若資料集中之值的數目為奇數，則中值為中間值。若資料集中之值的數目為偶數，則中位值為兩個中間值之算術平均值。

合成實例一或多次。當合成超過一次時，來自生物分析之資料表示利用獲自一或多個合成批次之測試的資料集計算的平均值或中位值。

本發明化合物之活體外活性可在以下分析中展現：

### 活體外分析1：秀麗隱桿線蟲(*C. elegans*) Slo-1a-對重組秀麗隱桿線蟲細胞株之作用

產生穩定秀麗隱桿線蟲CHO細胞株

CHO細胞株獲自ATCC，編碼ATCC CRL-9096。對於用質體DNA轉染以表現秀麗隱桿線蟲Slo-1a (寄存編號AAL28102)，將CHO細胞傳代至40%匯合，隨後將轉染溶液添加至細胞培養物中。轉染溶液包括300  $\mu$ L OptiMEM (Life Technologies, Nr.: 31985)、2  $\mu$ L (= 6  $\mu$ g)含有秀麗隱桿線蟲Slo 1a基因之質體DNA及9  $\mu$ L FugeneHD (Promega, Nr.: E2311)，且添加至細胞中，之後在37°C、5% CO<sub>2</sub>下培育48小時。將轉染培養基更換為含有額外G418 (2 mg/ml，Invitrogen, Nr.: 10131)之選擇培養基，且將細胞接種至384孔盤(300個細胞/孔)中。在幾週之後，用電壓敏感性染料(薄膜電位分析套組(Membrane Potential Assay Kit), Molecular Devices

Nr.: R8034)測試剩餘存活細胞之K<sup>+</sup>通道表現。陽性細胞純系藉由有限稀釋技術純化。為此，將電壓敏感性染料分析中具有最高且最強烈信號之純系進一步次選殖(培育)於384孔盤(0.7個細胞/孔)中，以獲得純系純度。由此產生表現秀麗隱桿線蟲Slo-1a之最終穩定的CHO細胞株。

#### 細胞培養條件

細胞在37℃及5% CO<sub>2</sub>下於具有Gutamax I (Invitrogen, Nr.: 32571)、補充有10% (v/v)熱滅活胎牛血清(Invitrogen, Nr.: 10500)、G418 (1 mg/ml, Invitrogen, Nr.: 10131)之MEM $\alpha$ 中培養。使用阿庫酶(Accutase) (Sigma, Nr.: A6964)分離細胞。

#### 薄膜電位量測值

在384孔微量滴定盤(MTP, Greiner, Nr.: 781092)上進行實驗室化合物測試。將8000個細胞/孔塗覆於384孔MTP上且在37℃及5% CO<sub>2</sub>下培養20至24小時。在移除細胞培養基之後，用台式液(tyrode)(150 mM NaCl、0.3 mM KCl、2 mM CaCl<sub>2</sub>、1 mM MgCl<sub>2</sub>、0.8 mM NaH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>、5 mM葡萄糖、28 mM Hepes, pH 7.4)洗滌細胞一次，且接著在室溫下負載用台式液稀釋之薄膜電位分析套組之電壓敏感性染料1小時。

在開始使用FLIPR Tetra (Molecular Devices，激發510-545 nm，發射565-625 nm)螢光量測之後，添加測試化合物，之後添加KCl台式液(最終分析濃度：70 mM KCl、2 mM CaCl<sub>2</sub>、1 mM MgCl<sub>2</sub>、0.8 mM NaH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>、5 mM葡萄糖、28 mM Hepes, pH 7.4，包括電壓敏感性染料)。在7分鐘之後完成量測。

#### 統計資料

使用ActivityBase XLfit軟體(IDBS)評價資料以進行曲線擬合及計算

半最大有效濃度( $EC_{50}$ )，且以負十進制對數( $pE_{50}$ )報導。

對於以下實例，已發現 $pE_{50} > 7.5-8.5$ ：1、7、8、9、14。

對於以下實例：已發現 $pE_{50} > 8.5$ ：2、3、4、5、6、10、11、12、13、15。

### 活體外分析2：巴西日圓線蟲(*Nippostrongylus brasiliensis*，NIPOBR)

成年巴西日圓線蟲用含有100 U/ml青黴素、0.1 mg/ml鏈黴素及2.5  $\mu\text{g/ml}$ 兩性黴素B之鹽水緩衝液洗滌。將測試化合物溶解於DMSO中且使蠕蟲以最終濃度10  $\mu\text{g/ml}$  (10 ppm)，各別地1  $\mu\text{g/ml}$  (1 ppm)在培養基中培育。使用培養基之等分試樣與陰性對照相比，確定乙醯膽鹼酯酶活性。以讀數量測乙醯膽鹼酯酶之驅蠕蟲活性之原理描述於Rapson等人(1986)及Rapson等人(1987)中。

對於以下實例，在10  $\mu\text{g/ml}$ 下，活性(相較於陰性對照之AChE之減少)高於80%：1、2、3、4、5、6、7、14。

對於以下實例，在1  $\mu\text{g/ml}$ 下，活性(相較於陰性對照之AChE減少)高於80%：1、5、6、13、14。

### 活體外分析3：犬惡絲蟲微絲蟲(DIROIM L1)

將 $\geq 250$ 個自血液新純化之犬惡絲蟲微絲蟲添加至DMSO中之含有營養培養基及測試化合物之微量滴定盤之孔中。在濃度響應分析中測試化合物重複兩次。使用暴露於DMSO且無測試化合物之幼蟲作為陰性對照。在與化合物一起培育72小時之後評估幼蟲。當與陰性對照相比運動性降低時，確定功效。基於寬濃度範圍之評估，計算濃度響應曲線以及 $EC_{50}$ 值。

對於以下實例： $EC_{50} < 0.1$  ppm：1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15。

**活體外分析4：犬惡絲蟲(DIROIM L4)**

將10個自其載體(中間宿主)新分離之犬惡絲蟲第三階段幼蟲添加至DMSO中之含有營養培養基及測試化合物之微量滴定盤之孔中。在濃度響應分析中測試化合物重複兩次。使用暴露於DMSO且無測試化合物之幼蟲作為陰性對照。在與化合物一起培育72小時之後評估幼蟲。在此等72小時培育內，陰性對照中之大多數幼蟲蛻皮成第四階段幼蟲。當與陰性對照相比運動性降低時，確定功效。基於寬濃度範圍之評估，計算濃度響應曲線以及EC<sub>50</sub>值。

對於以下實例，EC<sub>50</sub> < 0.1 ppm：2、3、5、6、8、14、15。

**活體外分析5：棉鼠絲蟲(Litomosoides sigmodontis)(LTMOSI L3)**

將10個自己感染嚙齒動物之肋膜腔新分離之棉鼠絲蟲第三階段幼蟲添加至DMSO中之含有營養培養基及測試化合物之微量滴定盤之孔中。在濃度響應分析中測試化合物重複兩次。使用暴露於DMSO且無測試化合物之幼蟲作為陰性對照。在與化合物一起培育72小時之後評估幼蟲。當與陰性對照相比運動性降低時，確定功效。基於寬濃度範圍之評估，計算濃度響應曲線以及EC<sub>50</sub>值。

對於以下實例，EC<sub>50</sub> < 0.1 ppm：2、3、6、15。

**活體外分析6：短古柏線蟲(Cooperia curticei) (COOPCU L3)**

溶劑：二甲亞碸

為產生適合的活性化合物製劑，將10 mg活性化合物溶解於0.5 ml溶劑中，且用「林格氏溶液(Ringer's solution)」稀釋濃縮物至所需濃度。

將大致40個線蟲幼蟲(短古柏線蟲)轉移至含有化合物溶液之試管中。

在5天之後，記錄幼蟲死亡百分比。100%功效意謂所有幼蟲均被殺

死；0%功效意謂無幼蟲被殺死。

在例如此測試中，以下來自製備實例之化合物在20 ppm之施用量下展示100%之良好活性：11、12。

在例如此測試中，以下來自製備實例之化合物在20 ppm之施用量下展示90%之良好活性：2、3、5、6、9、13。

在例如此測試中，以下來自製備實例之化合物在20 ppm之施用量下展示80%之良好活性：4。

### **活體外分析7：撚轉血矛線蟲(Haemonchus contortus)(HAEMCO L3)**

溶劑：二甲亞碸

為產生適合的活性化合物製劑，將10 mg活性化合物溶解於0.5 ml溶劑中，且用「林格氏溶液(Ringer's solution)」稀釋濃縮物至所需濃度。

將大致40個紅色胃蠕蟲之幼蟲(撚轉血矛線蟲)轉移至含有化合物溶液之試管中。

在5天之後，記錄幼蟲死亡百分比。100%功效意謂所有幼蟲均被殺死，0%功效意謂無幼蟲被殺死。

在例如此測試中，以下來自製備實例之化合物在20 ppm之施用量下展示90%之良好活性：1、3、11。

在例如此測試中，以下來自製備實例之化合物在20 ppm之施用量下展示80%之良好活性：4、12。

### **調配實例**

例示性調配物由含活性物質之10%卡必醇、10%十六醇聚氧乙烯醚EL及80%等張鹽水溶液組成。首先，將活性物質溶解於卡必醇中。在卡必醇中溶解之後，添加十六醇聚氧乙烯醚及等張鹽水溶液。在以下活體內分析中使用此等調配物作為測試調配物。

本發明之調配物之實例為以下調配物實例F1。其中，將活性物質溶解於卡必醇中以形成儲備溶液A。接著，獲取0.100 mL此儲備溶液A且添加0.100 mL十六醇聚氧乙烯醚EL及0.800 mL等張鹽水溶液。所得液體調配物(調配物實例F1)之體積為1 mL。

**儲備溶液A：**

- 4.0 mg本發明之實例化合物
- 0.100 mL卡必醇

**調配實例F1：**

- 0.100 mL儲備溶液A，
- 0.100 mL十六醇聚氧乙烯醚EL，及
- 0.800 mL等張鹽水溶液。

**活體內分析**

撚轉血矛線蟲/蛇形毛圓線蟲/沙鼠

以實驗方式感染血矛線蟲及/或毛圓線蟲之沙鼠在較晚顯露前期期間處理一次。測試化合物經調配呈溶液或懸浮液狀且經口或腹膜內應用。對於兩種應用使用同一測試調配物。施用體積最大通常達20 ml/kg。舉例而言，將體重40 g之沙鼠用0.200 mL調配物實例F1之調配物處理。此對應於每公斤體重用20毫克處理。

當驗屍之後與經感染及經安慰劑處理之對照組中之蠕蟲計數相比，胃及小腸中之蠕蟲計數分別降低時，確定每群組之功效。

測試以下實例且在既定處理下其活性≥70%或更高：

|              |              |
|--------------|--------------|
| 治療           | 撚轉血矛線蟲       |
| ≤10 mg/kg腹膜內 | Expl N° 1; 4 |



201841925

## 【發明摘要】

## 【中文發明名稱】

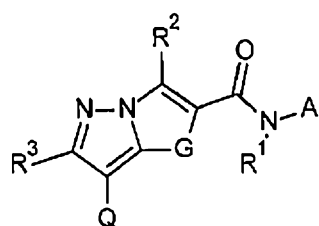
新穎雙環吡唑衍生物

## 【英文發明名稱】

NEW BICYCLIC PYRAZOLE DERIVATIVES

## 【中文】

本發明涵蓋通式(I)之雙環吡唑化合物：

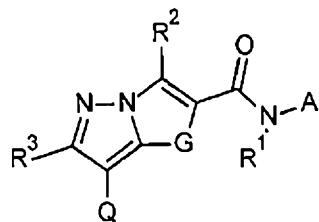


(I) ,

其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如本文所定義，製備該等化合物之方法，適用於製備該等化合物之中間化合物，包含該等化合物之醫藥組合物及組合，及該等化合物作為唯一藥劑或與其他活性成分組合用於製造供治療、控制及/或預防疾病、特定言之蠕蟲感染用之醫藥組合物的用途。

## 【英文】

The present invention covers bicyclic pyrazole compounds of general formula (I) :



(I) ,

in which G, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, and Q are as defined herein, methods of

preparing said compounds, intermediate compounds useful for preparing said compounds, pharmaceutical compositions and combinations comprising said compounds and the use of said compounds for manufacturing pharmaceutical compositions for the treatment, control and/or prevention of diseases, in particular of helminth infections, as a sole agent or in combination with other active ingredients.

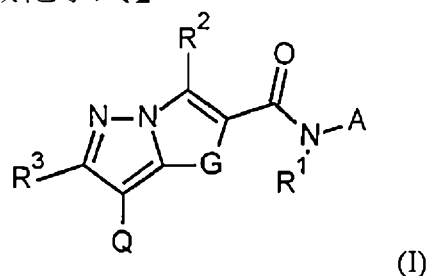
【指定代表圖】

無

【代表圖之符號簡單說明】

無

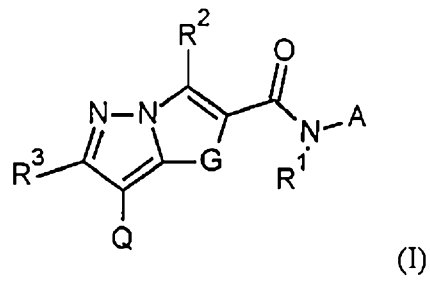
【特徵化學式】



【發明申請專利範圍】

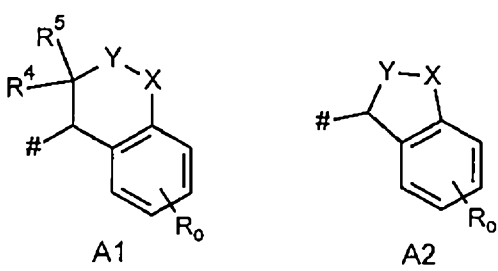
【第1項】

一種通式(I)化合物：



其中：

A為A1或A2，



o為0、1、2、3或4，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

X、Y獨立地選自由以下組成之群：CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、O、S及N-R<sup>8</sup>，其中X及Y中之至少一者為CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>，或

X、Y一起形成環成員，該環成員選自由以下組成之群：-C(O)-O-、-C(O)-NR<sup>8</sup>-、-S(O)-NR<sup>8</sup>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>8</sup>-及-SO<sub>2</sub>-O-，

G為S、O、N-R<sup>8</sup>

R<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、氰基、-CHO、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>鹵代環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、苯甲氧基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷

基、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S(O)-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基，

$\text{R}^2$ 選自由以下組成之群：

氫、鹵素、氰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基 $-\text{C(O)-}$ 、 $-\text{C(O)-NH}_2$ 、 $-\text{C(O)-NH(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)}$ 、 $-\text{C(O)-N(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)}_2$ 、 $-\text{C(O)-NH(C}_3\text{-C}_6\text{環烷基)}$ 、 $-\text{C(O)-N(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)(C}_3\text{-C}_6\text{環烷基)}$ ；

$-\text{NR}^9\text{R}^{10}$ ；

$-\text{OR}^{11}$ ；

$-\text{SR}^{12}$ 、 $-\text{S(O)R}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ ；

$\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基或苯基 $-\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基 $-\text{C(O)-}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基 $-\text{C(O)-}$ 、 $-\text{C(O)-NH}_2$ 、 $-\text{C(O)-NH(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)}$ 、 $-\text{C(O)-N(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)}_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)}$ 、 $-\text{N(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)}_2$ 、 $-\text{NH(C}_3\text{-C}_6\text{環烷基)}$ 、 $-\text{N(C}_1\text{-C}_4\text{烷基)(C}_3\text{-C}_6\text{環烷基)}$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{S(O)-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S(O)-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4$ 鹵代烷基；

雜環基 $-\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：

鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、

-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及4員至10員雜環烷基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

或R<sup>4</sup>及R<sup>5</sup>連同其附接之碳原子一起形成3員至6員環，該環選自由以下組成之群：C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基及3員至6員雜環烷基，

R<sup>6</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>7</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

或R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>連同其附接之碳原子一起形成3員至6員環，該環選自由以下組成之群：C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基及3員至6員雜環烷基，

R<sup>8</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>9</sup>及R<sup>10</sup>獨立地選自由以下組成之群：

氫、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)<sub>2</sub>、-NH(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基-C(O)-；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)<sub>2</sub>、-NH-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)(-C(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵代烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基)<sub>2</sub>P(=O)-；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、具有1至5個鹵素原子之-

S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基、苯并-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5

個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3-C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、側氧基、硫羰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、羥基 $-C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3-C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基，

$R^{12}$ 選自由以下組成之群：

氫；

$C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 環烷基、苯基 $-C_1-C_4$ 烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、

具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3-C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4$ 烷基)、 $-N(C_1-C_4$ 烷基) $_2$ 、 $-S-C_1-C_4$ 烷基、 $-S(O)-C_1-C_4$ 烷基、 $-SO_2-C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基；

雜環基- $C_1-C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、側氧基、硫羰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4$ 烷基)、 $-C(O)-N(C_1-C_4$ 烷基) $_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、羥基- $C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3-C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4$ 烷基)、 $-N(C_1-C_4$ 烷基) $_2$ 、 $-S-C_1-C_4$ 烷基、 $-S(O)-C_1-C_4$ 烷基、 $-SO_2-C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3-C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4$ 烷基)、 $-N(C_1-C_4$ 烷基) $_2$ 、 $-S-C_1-C_4$ 烷基、 $-S(O)-C_1-C_4$ 烷基、 $-SO_2-C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原

子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

Q選自由以下組成之群：6員或10員芳基及5員至10員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：鹵素、SF<sub>5</sub>、氰基、-CHO、硝基、側氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>羥基烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NH-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基))(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基亞胺基)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；4員至6員雜環基，其視情況經1或2個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基，-CH<sub>2</sub>-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷

基)、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、經4員至6員雜環基取代之甲基，該雜環基自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、 $-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{NHCO}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ 、 $-\text{NHCO}(\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{NHCO}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基})$ ，

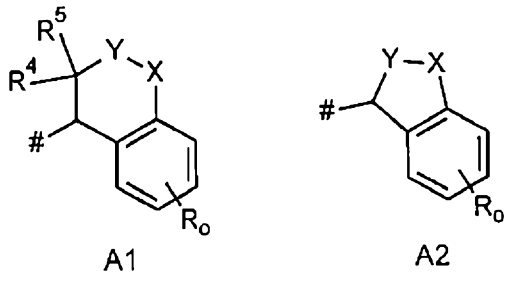
其中當Y為O、S或N- $\text{R}^8$ 時， $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^6$ 及 $\text{R}^7$ 中無一者為-OH，且其中當X為O、S或N- $\text{R}^8$ 時， $\text{R}^6$ 及 $\text{R}^7$ 中無一者為-OH，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

【第2項】

如請求項1之化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0、1、2、3或4，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、硝基、-OH、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4$ 鹵代烷氧基、 $\text{C}_3-\text{C}_6$ 環烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、-

$N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ，

X、Y獨立地選自由以下組成之群： $CR^6R^7$ 、O、S及 $N-R^8$ ，其中X及Y中之至少一者為 $CR^6R^7$ ，或

X、Y一起形成環成員，該環成員選自由以下組成之群： $-C(O)-O-$ 、 $-C(O)-NR^8-$ 、 $-S(O)-NR^8-$ 、 $-SO_2-NR^8-$ 及 $-SO_2-O-$ ，

G為S、O、 $N-R^8$

$R^1$ 選自由以下組成之群：氫、氰基、 $-CHO$ 、 $-OH$ 、 $C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、 $C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $C_3-C_6\text{環烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_3-C_6\text{鹵代環烷基}$ 、 $C_3-C_4\text{烯基}$ 、 $C_3-C_4\text{炔基}$ 、 $C_1-C_4\text{烷氧基}-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $C_3-C_6\text{環烷基}-C_1-C_3\text{烷基}$ 、氰基- $C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-NH-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $NH_2-C_1-C_4\text{烷基}-$ 、 $C_1-C_4\text{烷基}-NH-C_1-C_4\text{烷基}-$ 、 $(C_1-C_4\text{烷基})_2N-C_1-C_4\text{烷基}-$ 、 $C_1-C_4\text{烷基}-C(O)-$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷基}-C(O)-$ 、 $C_1-C_4\text{烷氧基}-C(O)-$ 、 $苯甲氧基}-C(O)-$ 、 $C_1-C_4\text{烷氧基}-C_1-C_4\text{烷基}-C(O)-$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ ；

苯基- $C_1-C_4\text{烷基}$ ，視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、 $C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4\text{鹵}$

代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)；

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；

-OR<sup>11</sup>；

-SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-NO<sub>2</sub>、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ ；

雜環基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ ，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、氰基、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ ；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ ；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、

雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及4員至10員雜環烷基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>6</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

R<sup>7</sup>選自由以下組成之群：氫、-OH、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

$R^8$ 選自由以下組成之群：氫、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

$R^9$ 及 $R^{10}$ 獨立地選自由以下組成之群：

氫、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $-NH(-C(O)-C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $-NH-C(O)-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})-(-C(O)-C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4 \text{ 烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基及 $(C_1-C_4 \text{ 烷氧基})_2P(=O)-$ ；

雜環基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-OH$ 、側氧基、硫羰基、 $-COOH$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、羥基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4$

烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

苯基、苯并-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

$-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ ；

$\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基}$ 、苯基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ ，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-\text{OH}$ 、氰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ - $\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ ；

雜環基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ ，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、側氧基、硫羰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ - $\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ 、羥基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ ；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自

由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

氫；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-

$\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基氧基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ ；

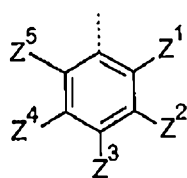
雜環基- $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ ，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、側氧基、硫羰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基氧基}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基氧基}$ 、羥基- $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基氧基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 及具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ ；

苯基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{鹵代烷基氧基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{環烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4\text{烷基}$ ；

基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、SF<sub>5</sub>、氰基、-CHO、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-

$\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{NH-SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{SO}_2-[\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}])(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基亞胺基})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、4員至6員雜環基，其視情況經1或2個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、 $-\text{CH}_2\text{-O}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、經4員至6員雜環基取代之甲基，該雜環基其自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、 $-\text{CH}_2\text{-S}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-S}(\text{O})-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{S}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、 $-\text{NHCO}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{NHCO}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-\text{NHCO}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基})$ 或

$\text{Z}^1$ 及 $\text{Z}^2$ 連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員飽和或部分飽和雜環、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

$\text{Z}^3$ 、 $\text{Z}^4$ 及 $\text{Z}^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $\text{SF}_5$ 、氰基、 $\text{CHO}$ 、硝基、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷基}$ 、羥基、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基}$ - $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ 、氰基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷氧基}-\text{C}(\text{O})-$ 、具有1至5個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{環烷基})$ 、-

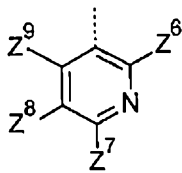
$N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(SO_2-[C_1-C_4\text{烷基}])(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $(C_1-C_4\text{烷氧基亞胺基})-C_1-C_4\text{烷基}$ 、視情況經1或2個取代基取代之4員至6員雜環烷基，該等取代基選自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、 $-CH_2-O-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、經4員至6員雜環烷基取代之甲基，該雜環烷基自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、 $-CH_2-S-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-S(O)-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CH_2-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-S-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-S(O)-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 、 $-CONH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-CONH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-NHCO(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-NHCO(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-NHCO(C_1-C_4\text{鹵代烷基})$ 或

$Z^2$ 及 $Z^3$ 連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員飽和或部分飽和雜環、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

$Z^1$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $SF_5$ 、氰基、 $CHO$ 、硝基、 $C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷基}$ 、羥基、 $C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、 $C_3-C_6\text{環烷基}-C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、氰基- $C_1-C_4\text{烷氧基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4\text{鹵代烷氧基}$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(SO_2-[C_1-C_4\text{烷基}])(C_1-C_4\text{烷基})$ 、

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基亞胺基)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、視情況經1或2個取代基取代之4員至6員雜環烷基，該等取代基選自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、-CH<sub>2</sub>-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、經4員至6員雜環烷基取代之甲基，該雜環烷基其自身視情況經1或2個取代基取代，該1或2個取代基選自由以下組成之群：氟、甲基或氰基、-CH<sub>2</sub>-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CH<sub>2</sub>-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、-CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-CONH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-NHCO(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、具有1至5個鹵素原子之-NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)，或

Q為式(Q2)之吡啶環

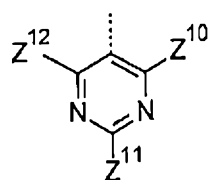


(Q2)

其中：

Z<sup>6</sup>、Z<sup>7</sup>、Z<sup>8</sup>及Z<sup>9</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)，或

Q為式(Q3)之嘧啶環

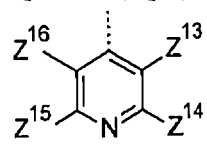


(Q3)

其中：

Z<sup>10</sup>、Z<sup>11</sup>及Z<sup>12</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)，或

Q為式(Q4)之吡啶環



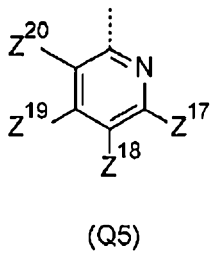
(Q4)

其中：

Z<sup>13</sup>、Z<sup>14</sup>、Z<sup>15</sup>及Z<sup>16</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>羥基烷基、NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-NH-CO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及單環雜環，該等單環雜環選自由以下組成之群：4員至7員雜環烷基或具有至少一個氮原子之5員雜芳基，經由該至少一個氮原子該雜芳基環連接至吡啶環，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、硝基、-OH、側氧基、硫羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧

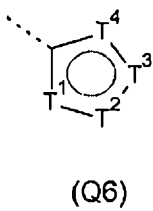
基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)、具有1至5個鹵素原子之-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基)，或

Q是式(Q5)之吡啶環



其中：  
Z<sup>17</sup>、Z<sup>18</sup>、Z<sup>19</sup>及Z<sup>20</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)，或

Q為式(Q6)之5員芳族雜環



其中：  
T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>獨立地選自由以下組成之群：N、O、S、C-Z<sup>21</sup>及N-Z<sup>22</sup>，其中T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>中之不超過一者為O，T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>中之不超過一者為S，T<sup>1</sup>-T<sup>4</sup>中之不超過一者為N-Z<sup>22</sup>，且其中

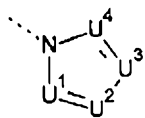
各Z<sup>21</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷

第 27 頁(發明申請專利範圍)

基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，及

各Z<sup>22</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，或

Q為式(Q7)之5員芳族雜環



(Q7)

其中：

U<sup>1</sup>-U<sup>4</sup>獨立地選自由以下組成之群：N及C-Z<sup>23</sup>，其中U<sup>1</sup>-U<sup>4</sup>中之不超過三者為N，且其中

各Z<sup>23</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

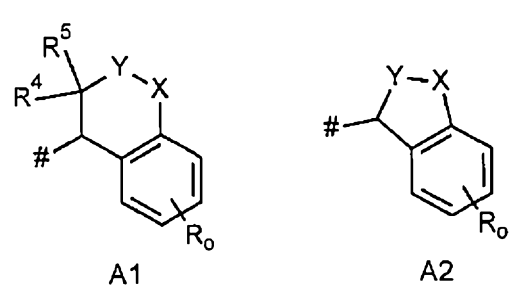
其中當Y為O、S或N-R<sup>8</sup>時，R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>中無一者為-OH，且其中當X為O、S或N-R<sup>8</sup>時，R<sup>6</sup>及R<sup>7</sup>中無一者為-OH，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

【第3項】

如請求項1或2之化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0、1或2，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、氰基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，

X、Y獨立地選自由以下組成之群：CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、O、S及N-R<sup>8</sup>，其中X及Y中之至少一者為CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>，

G為S、O、N-R<sup>8</sup>

R<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素、氰基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-C(O)-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)；

- NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；
- OR<sup>11</sup>；
- SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-C(O)-

$N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、 $-OH$ 、側氧基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基- $C(O)-$ 、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、羥基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基-、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3-C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 及4員至10員雜環烷基，

$R^3$ 選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $-OH$ 、氰基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_1-C_4$ 烷基- $C(O)-$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})(C_3-C_6\text{環烷基})$ 、 $-S-C_1-C_4$ 烷基、 $-S(O)-C_1-C_4$ 烷基、 $-SO_2-C_1-C_4$ 烷基，

$R^4$ 選自由以下組成之群：氫、 $-OH$ 、 $C_1-C_4$ 烷基及 $C_1-C_4$ 烷氧基，

$R^5$ 為氫，

$R^6$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^7$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^8$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^9$ 及 $R^{10}$ 獨立地選自由以下組成之群：

氫、 $-NH(-C(O)-C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $C_1-C_4$ 烷氧基；

$C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 環烷基、苯基- $C_1-C_4$ 烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-NH-C(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})-(-C(O)-C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_3-C_6$ 環烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{烷基}$ 、具有1至5個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-S(O)-C_1-C_4$ 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 $-SO_2-C_1-C_4$ 鹵代烷基及 $(C_1-C_4\text{烷氧基})_2P(=O)-$ ；

雜環基- $C_1-C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、 $-OH$ 、側氧基、 $C_1-C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_4$ 鹵代烷氧基；

苯基、苯并- $C_5-C_6$ 環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代

基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、-OH、側氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基；及

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、-OH、側氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；

R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

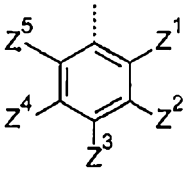
氫；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個

取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、  
氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷  
氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；

雜環基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4  
員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況  
經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：  
鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基；

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>及Z<sup>5</sup>獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰  
基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基、C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷  
基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環  
烷基)、4員至6員雜環基，該雜環基視情況經1或2個取代基取代，該  
等取代基選自由以下組成之群：氟、氯、溴、甲基及氰基、-S-(C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>烷基)、-S(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)，或

Z<sup>1</sup>及Z<sup>2</sup>連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員雜環烷基、5員雜  
芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，  
該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

$Z^3$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基，或

$Z^2$ 及 $Z^3$ 連同連接至其之碳原子一起形成5員或6員飽和或部分飽和雜環、5員雜芳基或6員雜芳基，其中之每一者可視情況經一或兩個取代基取代，該等取代基選自由以下組成之群：甲基、氟及側氧基，及

$Z^1$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基，

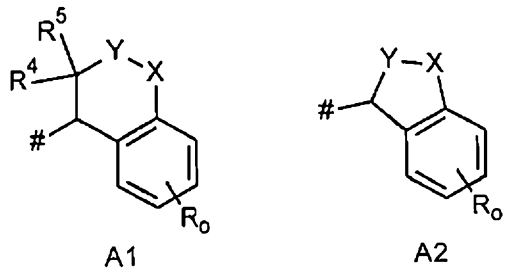
其中當Y為O、S或N- $R^8$ 時， $R^4$ 不為-OH，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

【第4項】

如請求項1、2或3之化合物，其中：

A為A1或A2，



o為0或1，

R選自由以下組成之群：氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基，

X選自由以下組成之群： $CR^6R^7$ 、O、S及N- $R^8$ ，

Y為 $CR^6R^7$ ，

G為S、O、N-R<sup>8</sup>

R<sup>1</sup>為氫或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、鹵素，

-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；

-OR<sup>11</sup>；

-SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基，其中之每一者視情況經1、2、3、4或5個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-及-C(O)-NH<sub>2</sub>；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、雜螺環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、側氧基、-COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-、-NH<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)及4員至10員雜環烷基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C(O)-、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-S(O)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，

$R^4$ 選自由以下組成之群：氫、-OH及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^5$ 為氫，

$R^6$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^7$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^8$ 選自由以下組成之群：氫及 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^9$ 及 $R^{10}$ 獨立地選自由以下組成之群：

氫、-NH(-C(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基)、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

$C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、-COOH、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、-C(O)-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-NH-C(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、-NH<sub>2</sub>、-N( $C_1$ - $C_4$ 烷基)<sub>2</sub>、-S- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-S(O)- $C_1$ - $C_4$ 烷基、-SO<sub>2</sub>- $C_1$ - $C_4$ 烷基及( $C_1$ - $C_4$ 烷氧基)<sub>2</sub>P(=O)-；

雜環基- $C_1$ - $C_4$ 烷基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、-OH、側氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基及 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

苯基及苯并- $C_5$ - $C_6$ 環烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：4員至10員雜環烷基、

5員雜芳基及6員雜芳基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、側氧基、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

R<sup>11</sup>選自由以下組成之群：

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：鹵素、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基；及

4員至10員雜環烷基，

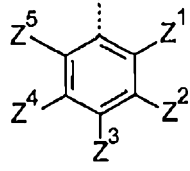
R<sup>12</sup>選自由以下組成之群：

氫；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：-OH及-COOH；及

6員雜芳基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-OH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、-NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基)、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷

基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、-S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及4員至6員雜環烷基，及

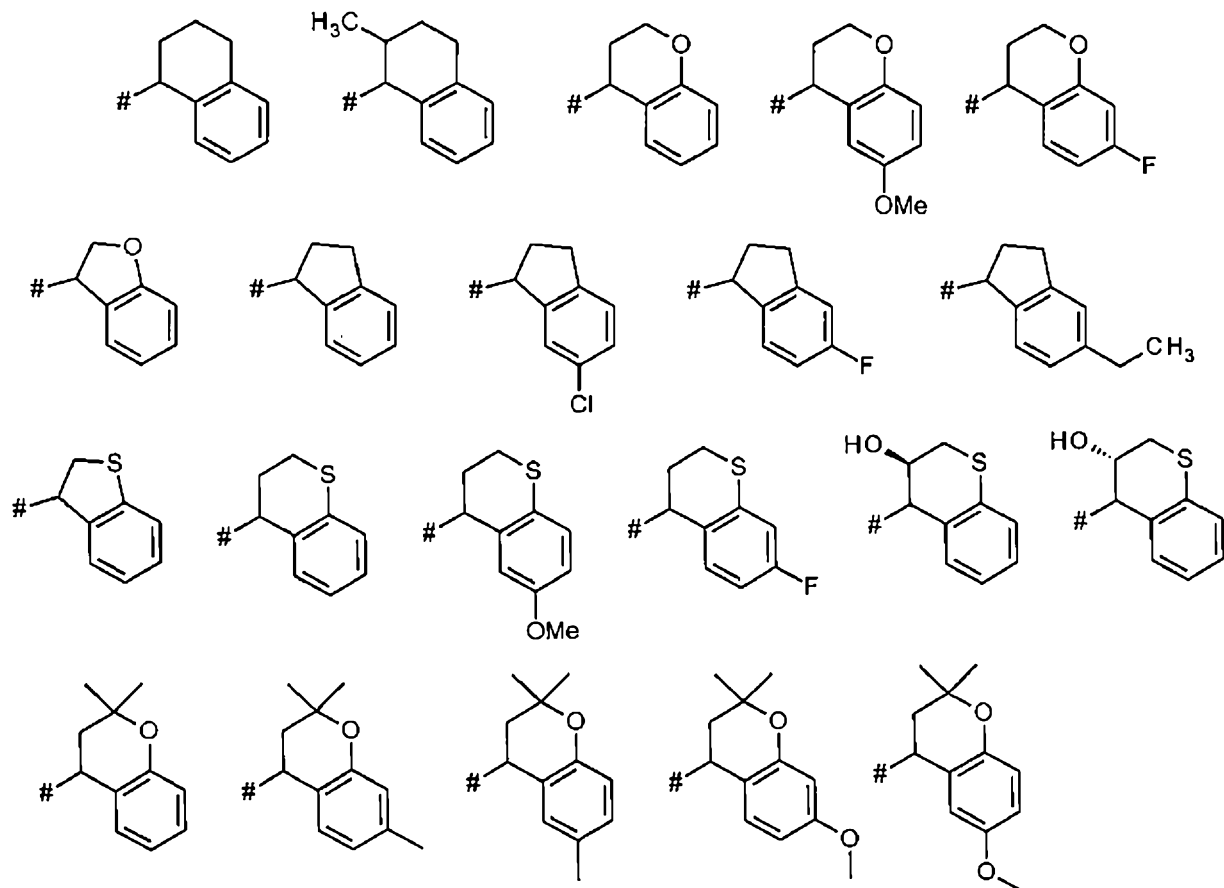
Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)及-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>，

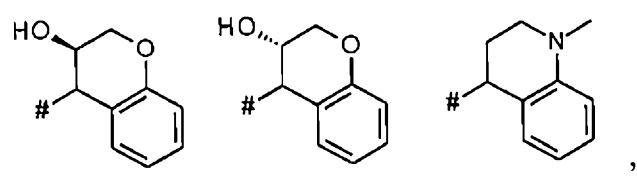
Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，  
Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，  
或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

【第5項】

如請求項1、2、3或4之化合物，其中：

A選自由以下組成之群：





G為S、O、N-R<sup>8</sup>

R<sup>1</sup>為氫或甲基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

- 氫、氯、氟，
- NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>；
- OR<sup>11</sup>；
- SR<sup>12</sup>、-S(O)R<sup>12</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>；

甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、環己基、丙烯基、環戊烯基、環己烯基，其中之每一者視情況經1或2個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氰基、乙氧基-C(O)-及-C(O)-NH<sub>2</sub>；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：氮雜環丁烷、吡咯啉、吡啶啉、咪啶啉、1,2,4-三唑啉、哌啶、哌嗪、四氫吡啶、二氫-2H-哌喃、1,2-噁唑啉、1,2-噁嗪、嗎啉、硫代嗎啉、3,4-二氫異喹啉、2,3-二氫-吡啶、1,3-二氫-異吡啶、3,9-二氧雜-7-氮雜雙環[3.3.1]壬烷、6-氧雜-3-氮雜雙環[3.1.1]庚烷、8-氧雜-3-氮雜雙環[3.2.1]辛烷、咪唑、吡唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、4-氧雜-7-氮雜螺[2.5]辛烷，其中之每一者視情況經1、2、3或4個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、氯、氰基、-OH、側氧基、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、第三丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH<sub>2</sub>、甲基、甲基-C(O)-、三氟甲基、羥甲基、甲氧基甲基-

、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NMe}_2$ 、吡咯啉，

$\text{R}^3$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基及三氟甲基，

$\text{R}^8$ 選自由以下組成之群：氫及甲基，

$\text{R}^9$ 及 $\text{R}^{10}$ 獨立地選自由以下組成之群：

氫、 $-\text{NH}(-\text{C}(\text{O})-\text{甲基})$ 、甲氧基；

甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、環丙基、環丁基、苯甲基、1-苯乙基，其中之每一者視情況經1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{COOH}$ 、甲氧基 $-\text{C}(\text{O})-$ 、乙氧基 $-\text{C}(\text{O})-$ 、第三丁氧基 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NMe}_2$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-\text{甲基}$ 、甲基、甲氧基、環丙基、 $-\text{NH}_2$ 、 $\text{NMe}_2$ 、S-甲基、S(O)-甲基、 $\text{SO}_2$ -甲基及 $(\text{EtO})_2\text{P}(=\text{O})-$ ；

雜環基-甲基、雜環基-乙基，其中該雜環基取代基選自由以下組成之群：吡咯啉、嗎啉、吡啶、1,2,4-噁二唑、吡啶，其中之每一者視情況經1個取代基取代，該取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、氯、 $-\text{OH}$ 、側氧基及甲基；

苯基；

2,3-二氫-1H-茛，及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：氧雜環丁烷、硫雜環丁烷、吡咯啉、嗎啉、四氫吡喃、吡啶及吡啶，其中之每一者視情況經1或2個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、氯、 $-\text{OH}$ 、側氧基、甲基；

$\text{R}^{11}$ 選自由以下組成之群：

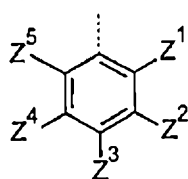
甲基、乙基、異丙基、丁基、環戊基、苯甲基，其中之每一者視情況經1或2個取代基取代，該等取代基獨立地選自由以下組成之群：氟、-OH、甲基、甲氧基及環戊基；及

單環或雙環雜環，其選自由以下組成之群：吡咯啉及四氫吡喃，  
 $R^{12}$ 選自由以下組成之群：

甲基及乙基，其中之每一者視情況經1個取代基取代，該取代基獨立地選自由以下組成之群：-OH及-COOH；及

吡啶，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

$Z^1$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

$Z^2$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、-OH、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、-NH(CH<sub>3</sub>)、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、三氟甲基、三氟甲氧基，

$Z^3$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基、甲氧基、-NH(CH<sub>3</sub>)及-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，

$Z^4$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

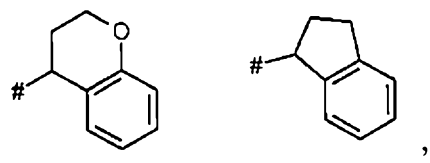
$Z^5$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

# 【第6項】

如請求項1、2、3、4或5之化合物，其中：

A選自由以下組成之群：



G為S、O、NH或N-CH<sub>3</sub>，

R<sup>1</sup>為氫或甲基

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

-NH<sub>2</sub>、-NH(CH<sub>3</sub>)、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，

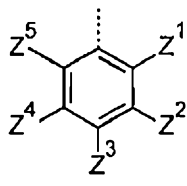
甲氧基、乙氧基，

甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基，

三氟甲基及三氟甲氧基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、氯、氟、甲基、甲氧基及三氟甲基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、-OH、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、-NH(CH<sub>3</sub>)、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、三氟甲基、三氟甲氧基，

Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基、甲氧基、-NH(CH<sub>3</sub>)及-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，

Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫、氟、氯、甲基及甲氧基，

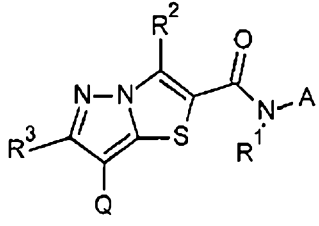
或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

【第7項】

如請求項1、2、3、4、5或6之化合物，其中G為S。

【第8項】

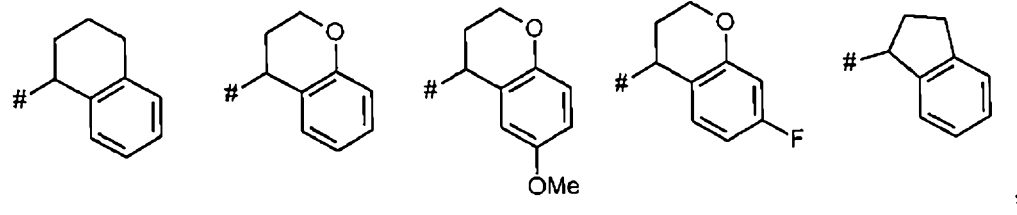
一種通式(II)化合物：



(II)，

其中：

A選自由以下組成之群：



R<sup>1</sup>為氫或甲基，

R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：

氫、氯、氟，

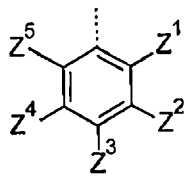
甲氧基，

甲基、乙基、丙基、異丙基，

三氟甲基及三氟甲氧基，

R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、氯、氟、甲基、甲氧基及三氟甲基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

Z<sup>1</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

Z<sup>2</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)<sub>2</sub>、具有1至5個鹵素原子之-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基及具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基，

Z<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

Z<sup>4</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

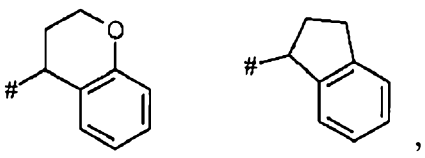
Z<sup>5</sup>選自由以下組成之群：氫及鹵素，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或鹽，或其混合物。

【第9項】

如請求項8之化合物，其中

A選自由以下組成之群：

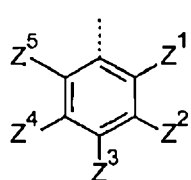


R<sup>1</sup>為氫，

R<sup>2</sup>為異丙基，

R<sup>3</sup>為甲基，

Q為式(Q1)之經取代苯基環



(Q1)

其中：

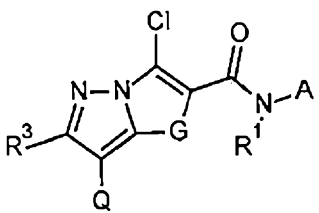
$Z^1$ 、 $Z^3$ 、 $Z^4$ 及 $Z^5$ 獨立地選自由以下組成之群：氫、氟及氯，以及

$Z^2$ 選自由以下組成之群：氫、氟、氯、 $-N(CH_3)_2$ 、三氟甲基及三  
氟甲氧基，

或其立體異構體、互變異構體、N-氧化物、水合物、溶劑合物或  
鹽，或其混合物。

【第10項】

一種製備如請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物之方法，該方  
法包含以下步驟：允許通式1N中間化合物：



1N ,

其中，G、A、 $R^1$ 、 $R^3$ 及Q如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或  
(II)化合物所定義，

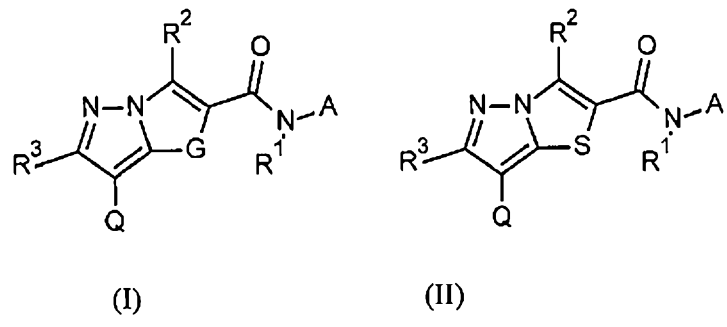
與通式1F化合物反應：



1F，

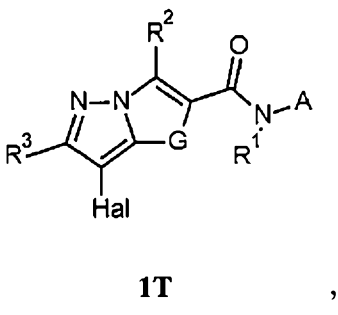
其中 $R^2$ 選自由以下組成之群： $-NR^9R^{10}$ 、 $-OR^{11}$ 及 $-SR^{12}$ ，其中 $R^9$ 、  
 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 及 $R^{12}$ 如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，

由此得到通式(I)或(II)化合物：



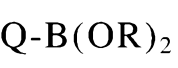
其中，G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，

或以下步驟：允許通式**1T**之中間化合物：



其中，G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及R<sup>3</sup>如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，且其中Hal為鹵素，特定為氯、溴或碘，

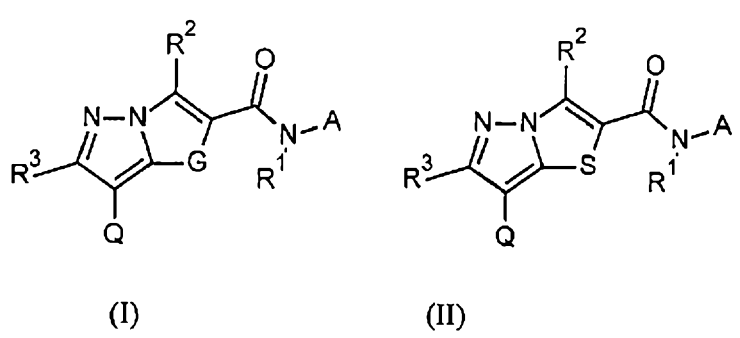
與通式**1H**化合物反應：



**1H**，

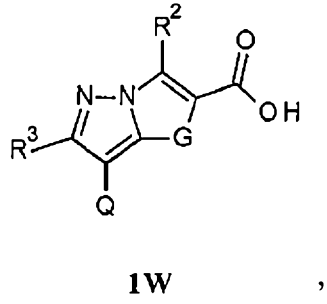
其中Q如依據請求項1至7中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，且各R可個別地為H或Me或兩個R為頻哪醇酯基，

由此得到通式(I)或(II)化合物：



其中，G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，

或以下步驟：允許通式**1W**之中間化合物：



其中G、Q、R<sup>2</sup>及R<sup>3</sup>如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，

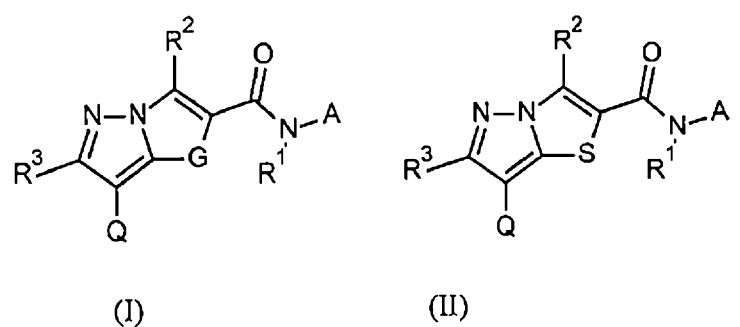
與通式**1M**化合物反應：



**1M**，

其中R<sup>1</sup>及A如依據請求項1至9中任一項之通式(I)化合物所定義，

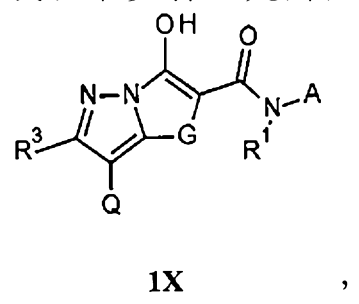
由此得到通式(I)或(II)化合物：



其中，G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及Q如依據請求項1至9中任一項之通式(I)

或(II)化合物所定義，

或以下步驟：允許通式**1X**之中間化合物：



其中，G、Q、A、R<sup>1</sup>及R<sup>3</sup>如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，

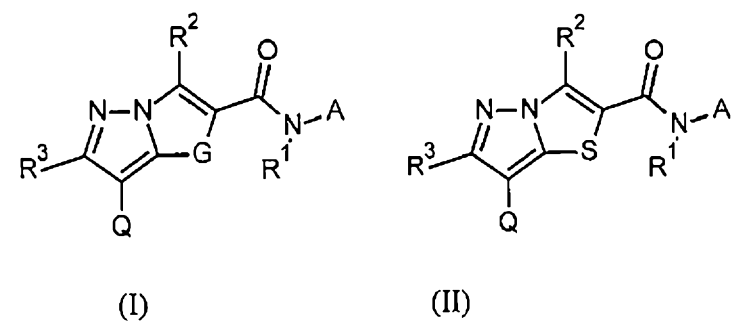
與通式**1Y**化合物反應：



**1Y**，

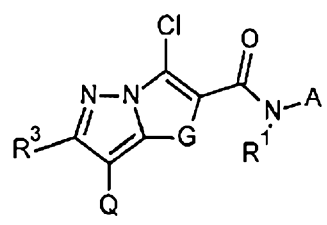
其中R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，其視情況如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義而經取代，

由此得到通式(I)或(II)化合物：



其中，G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及Q如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，及R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，其視情況如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義而經取代，

或以下步驟：允許通式**1N**之中間化合物：



1N ,

其中，G、Q、A、R<sup>1</sup>及R<sup>3</sup>如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，

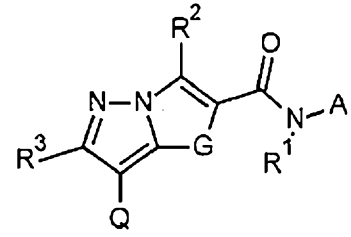
與通式2A化合物反應：



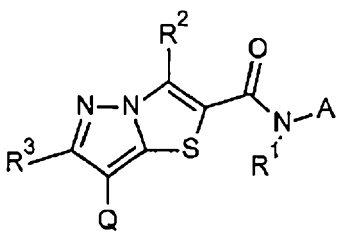
2A，

其中R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義而經取代，Met為鎂或鋅，及X為氯、溴或碘，

由此得到通式(I)或(II)化合物：



(I)

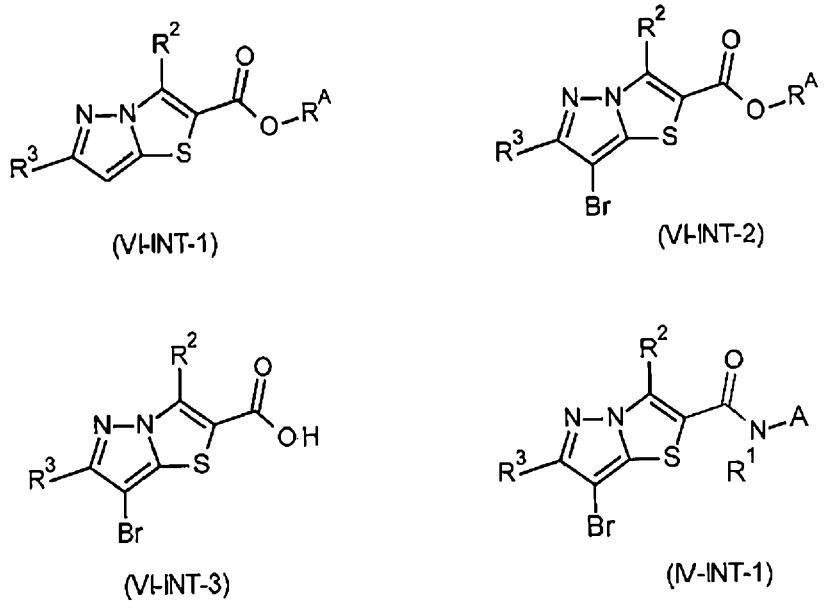


(II)

其中G、A、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及Q如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義，及R<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，其中之每一者視情況如依據請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物所定義而經取代。

【第11項】

一種通式 (VI-INT-1)、(VI-INT-2)、(VI-INT-3) 或 (IV-INT-1) 化合物：



其中

- R<sup>A</sup>選自由以下組成之群：甲基、乙基及第三丁基，
- R<sup>2</sup>選自由以下組成之群：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基；
- R<sup>3</sup>選自由以下組成之群：氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基及C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，及
- A及R<sup>1</sup>如前述請求項中之任一者中所定義。

【第12項】

一種如請求項11之通式(VI-INT-1)、(VI-INT-2)、(VI-INT-3)及(IV-INT-1)化合物之用途，其用於製備如請求項1至9中任一項之通式(I)及(II)化合物。

【第13項】

如請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物，其用於控制、治療及/或預防疾病。

【第14項】

一種醫藥組合物，其包含如請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化

物及一或多種醫藥學上可接受之賦形劑。

**【第15項】**

一種如請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物之用途，其用於控制、治療及/或預防疾病。

**【第16項】**

一種如請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物之用途，其用於製備供控制、治療及/或預防疾病用之藥物。

**【第17項】**

如請求項11、13或14之用途，其中該疾病為蠕蟲感染。

**【第18項】**

一種用於控制人類及/或動物之蠕蟲感染之方法，該方法係藉由向有需要之人類或動物投與驅蠕蟲有效量之至少一種如請求項1至9中任一項之通式(I)或(II)化合物。