



(21)申請案號：104123814

(22)申請日：中華民國 104 (2015) 年 07 月 23 日

(51)Int. Cl.：

C07D401/04 (2006.01)

C07D401/14 (2006.01)

C07D405/04 (2006.01)

A61K31/443 (2006.01)

A61K31/4439(2006.01)

A61K31/497 (2006.01)

A61P33/10 (2006.01)

(30)優先權：2014/07/25

歐洲專利局

14178621.0

2015/05/29

歐洲專利局

15169965.9

(71)申請人：拜耳動物保健有限公司(德國) BAYER ANIMAL HEALTH GMBH (DE)

德國

(72)發明人：威里 克勞迪亞 WELZ, CLAUDIA (DE)；克勒 愛德琳 KOEHLER, ADELINE

(FR)；伯恩根 克斯汀 BOERNGEN, KIRSTEN (DE)；格根斯 尤里奇

GOERGENS, ULRICH (DE)；施瓦茨 漢斯 喬治 SCHWARZ, HANS-GEORG

(DE)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：0 共 100 頁

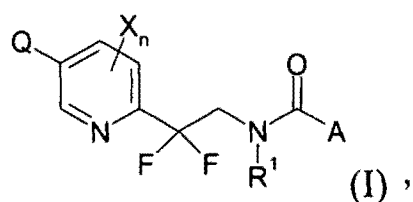
(54)名稱

用於抗蠕蟲治療之化合物

COMPOUNDS FOR USE IN ANTHELMINTHIC TREATMENT

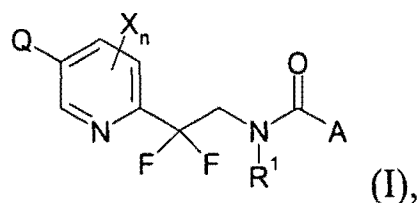
(57)摘要

本發明揭示具有抗蠕蟲性質之式(I)化合物，



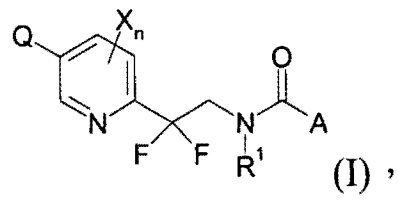
其中結構單元具有如說明中所指示之意義。本發明另外揭示該等用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之化合物。

Disclosed are compounds of formula (I) which possess anthelmintic properties



wherein the structural elements have the meaning as indicated in the description. Further disclosed are such compounds for the control, treatment and/or prevention of infections with helminths in animals and humans.

特徵化學式：



201617330

發明摘要

※ 申請案號：104123814

※ 申請日：※IPC分類：

104 7 23

C07D 401/4, 401/4, 405/4 (2006.01)

A61K 31/443, 31/4439, 31/497 (2006.01)

A61P 33/10 (2006.01)

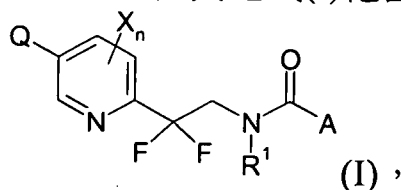
【發明名稱】(中文/英文)

用於抗蠕蟲治療之化合物

COMPOUNDS FOR USE IN ANTHELMINTHIC TREATMENT

【中文】

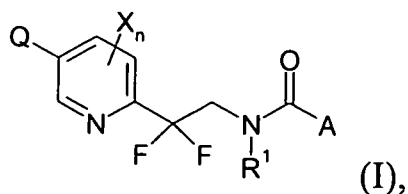
本發明揭示具有抗蠕蟲性質之式(I)化合物，



其中結構單元具有如說明中所指示之意義。本發明另外揭示該等用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之化合物。

【英文】

Disclosed are compounds of formula (I) which possess anthelmintic properties



wherein the structural elements have the meaning as indicated in the description. Further disclosed are such compounds for the control, treatment and/or prevention of infections with helminths in animals and humans.

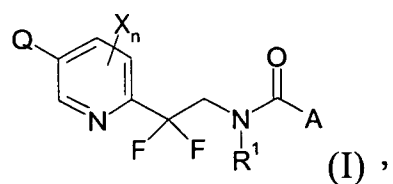
【代表圖】

【本案指定代表圖】：第（無）圖。

【本代表圖之符號簡單說明】：

無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：



發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

用於抗蠕蟲治療之化合物

COMPOUNDS FOR USE IN ANTHELMINTHIC TREATMENT

【技術領域】

【0001】 本發明係有關某些吡啶基甲醯胺衍生物。此外，本發明係有關某些吡啶基甲醯胺衍生物用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之用途，含有該等化合物之調配物和用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之方法。

【先前技術】

【0002】 抗所有商業抗蠕蟲劑之抗藥性的出現在獸醫領域中似乎是日益嚴重的問題。因此，迫切需要具有新的分子作用模式的殺內寄生蟲劑。新活性成分應以抗廣泛的蠕蟲(像線蟲)之極佳功效進行，較佳地對治療之生物無任何不良毒性作用。殺內寄生蟲劑為用於對抗或抑制動物或人類中的內寄生蟲之醫藥。

【0003】 某些N-2-(吡啶基)乙基-甲醯胺衍生物用於控制線蟲之用途係描述於WO 2007/108483 A1和EP 2 132 987 A1中。

【0004】 某些甲醯胺作為殺寄生蟲劑之用途係描述於WO 2012/118139 A1、WO 2013/0676230 A1、WO 2014/034750 A1和WO 2014/034751 A1中。

【0005】 此外，某些甲醯胺在WO 2013/064518 A1、WO 2013/064519 A1、WO 2013/064520 A1、WO 2013/064521 A1、WO 2014/004064 A1係描述為殺蟲劑或在WO 2013/064460 A1和

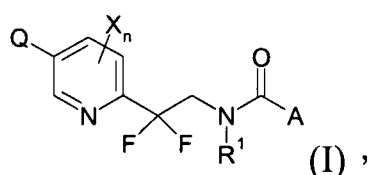
WO 2013/064461 A1中係描述為殺線蟲劑。

【0006】 另外，某些甲醯胺(本文中提及為實施例1、2和3)係描述於具有申請案號EP13181692.8之歐洲專利申請案中。

【發明內容】

【0007】 本發明之目的為提供用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之化合物，其在醫學(尤其是獸醫)領域上可用作殺內寄生蟲劑且具有抗廣泛的蠕蟲(像線蟲)之令人滿意或改良的抗蠕蟲活性，特別是在較低劑量，較佳地對治療之生物無任何不良毒性作用。

【0008】 本發明係有關式(I)化合物



其中

R¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、-CHO、-OH、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、C₃-C₆-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₆-鹵環烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-環烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷胺基-C₁-C₄-烷基、二-(C₁-C₄-烷基)胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰基、C₁-C₄-烷氧羰基、苄氧羰基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷羰基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，及具有 1 至 5 個鹵素原子之 -S(O)₂-C₁-C₄-鹵烷基，

n 為 0、1、2 或 3，

各 X係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、羥

基、胺基、-SH、-SF₅、-CHO、-OCHO、-NHCHO、-COOH、-CONH₂、
-CONH(OH)、-OCONH₂、(羥亞胺基)-C₁-C₆-烷基、C₁-C₈-烷基、具有 1
至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷胺
基、二-(C₁-C₈-烷基)胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-
鹵烷氧基、C₂-C₈-烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₈-鹵烯氧基、
C₃-C₈-炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵炔氧基、C₃-C₈-環烷
基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵環烷基、C₁-C₈-烷羰基、具有 1
至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₈-烷基)、-CON(C₁-C₈-
烷基)₂、-CONH(OC₁-C₈-烷基)、-CON(OC₁-C₈-烷基)(C₁-C₈-烷基)、C₁-C₈-
烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧
基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、C₁-C₈-烷羰胺基、具
有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₈-烷基)、
-OCON(C₁-C₈-烷基)₂、OCONH(OC₁-C₈-烷基)、-OCO(OC₁-C₈-烷基)、
-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₈-
烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、(C₁-C₆-烷氧基亞胺
基)-C₁-C₆-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺
基)-C₁-C₆-烷基、(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺
基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，

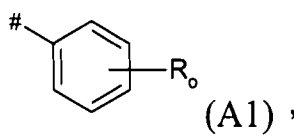
Q 表示含有四個選自 N、S 和 O 之雜原子及帶有取代基 Y_m 的芳族 5-員雜
環，且

m 為 0、1、2、3 或 4，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用
位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、側氧基、鹵素、

硝基、氰基、羧基、胺基、-SH、-SF₅、-CHO、-OCHO、-NHCHO、
-COOH、-CONH₂、-CONH(OH)、-OCONH₂、(羥亞胺基)-C₁-C₆-
烷基、C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-
烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷胺基、二-(C₁-C₈-烷基)胺基、C₁-C₈-
烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₂-C₈-烯氧
基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₈-鹵烯氧基、C₃-C₈-炔氧基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵炔氧基、C₃-C₈-環烷基、具有
1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵環烷基、C₁-C₈-烷羰基、具有 1 至
5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₈-烷基)、
-CON(C₁-C₈-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₈-烷基)、-CON(OC₁-C₈-烷
基)(C₁-C₈-烷基)、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之
C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之
C₁-C₈-鹵烷羰氧基、C₁-C₈-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之
C₁-C₈-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₈-烷基)、-OCON(C₁-C₈-烷基)₂、
-OCONH(OC₁-C₈-烷基)、-OCO(OC₁-C₈-烷基)、-S-C₁-C₈-烷基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、-CH₂-S-C₁-C₈-烷
基、-CH₂-S(O)-C₁-C₈-烷基、-CH₂-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、(C₁-C₆-烷
氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、
(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(苧氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、
苧氧基、-S-苧基、苧胺基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，及

A 表示式(A1)之苯基



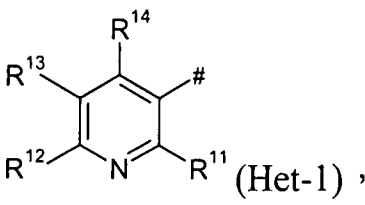
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 0、1、2、3、4 或 5，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、NH₂、SH、SF₅、CHO、OCHO、NHCHO、COOH、氰基、C₁-C₈-烷基、具有 1 至 9 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₃-C₆-環烷基、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 -S-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷氧基-C₂-C₈-烯基、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 -S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 -S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷基磺醯胺、-NH(C₁-C₈-烷基)、N(C₁-C₈-烷基)₂、苯基(視需要地經 C₁-C₆-烷氧基取代)和苯氧基，或鍵結至相鄰碳原子的二個 R 一起表示-O(CH₂)_pO-，其中 p 表示 1 或 2，或

A 表示式(Het-1)之雜環



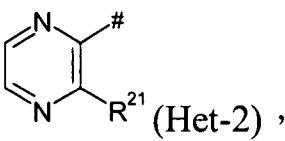
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-

烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、
-S-C₁-C₅-烷基、S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-
烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、C 具有 1 至 5
個鹵素原子之 -C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-
烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及
R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，其可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：氫、
鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷
基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之
C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

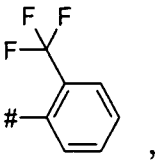
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5
個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，

或其醫藥上可接受的鹽、N-氧化物、金屬錯合物或類金屬錯合物，

其條件為：若

A 為

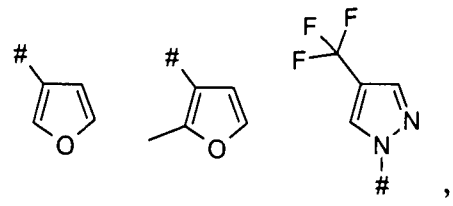


其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

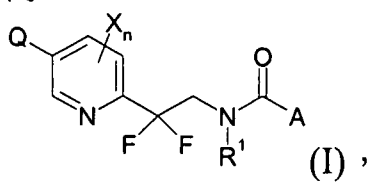
R¹ 為氫，

- X 為氯，在其所連接之吡啶環的位置 3，及
- n 為 1，則
- Q 為下列中之一者



其中
描述將Q連接至分子其餘部分之鍵。

【0009】 本發明進一步係有關用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之式(I)化合物



其中

R¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、-CHO、-OH、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、C₃-C₆-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₆-鹵環烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-環烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷胺基-C₁-C₄-烷基、二-(C₁-C₄-烷基)胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰基、C₁-C₄-烷氧羰基、苄氧羰基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷羰基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，及具有 1 至 5 個鹵素原子之 -S(O)₂-C₁-C₄-鹵烷基，

n 為 0、1、2 或 3，

各 X係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、羥

基、胺基、-SH、-SF₅、-CHO、-OCHO、-NHCHO、-COOH、-CONH₂、-CONH(OH)、-OCONH₂、(羥亞胺基)-C₁-C₆-烷基、C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷胺基、二-(C₁-C₈-烷基)胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₂-C₈-烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₈-鹵烯氧基、C₃-C₈-炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵炔氧基、C₃-C₈-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵環烷基、C₁-C₈-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₈-烷基)、-CON(C₁-C₈-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₈-烷基)、-CON(OC₁-C₈-烷基)(C₁-C₈-烷基)、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、C₁-C₈-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₈-烷基)、-OCON(C₁-C₈-烷基)₂、-OCONH(OC₁-C₈-烷基)、-OCO(OC₁-C₈-烷基)、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、(C₁-C₆-烷氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(苧氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苧氧基、-S-苧基、苧胺基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，

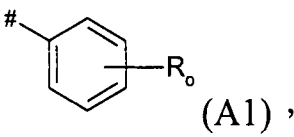
Q 表示含有一至四個選自 N、S 和 O 之雜原子及帶有取代基 Y_m 的芳族 5-員雜環，且

m 為 0、1、2、3 或 4，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、側氧基、鹵素、硝

基、氰基、羧基、胺基、-SH、-SF₅、-CHO、-OCHO、-NHCHO、
-COOH、-CONH₂、-CONH(OH)、-OCONH₂、(羧亞胺基)-C₁-C₆-
烷基、C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-
烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷胺基、二-(C₁-C₈-烷基)胺基、C₁-C₈-
烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₂-C₈-烯氧基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₈-鹵烯氧基、C₃-C₈-炔氧基、具有 1
至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵炔氧基、C₃-C₈-環烷基、具有 1 至 5 個
鹵素原子之 C₃-C₈-鹵環烷基、C₁-C₈-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原
子之 C₁-C₈-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₈-烷基)、-CON(C₁-C₈-烷基)₂、
-CONH(OC₁-C₈-烷基)、-CON(OC₁-C₈-烷基)(C₁-C₈-烷基)、C₁-C₈-
烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-
烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、C₁-C₈-
烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰胺基、
-OCONH(C₁-C₈-烷基)、-OCON(C₁-C₈-烷基)₂、-OCONH(OC₁-C₈-
烷基)、-OCO(OC₁-C₈-烷基)、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原
子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子
之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子
之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、-CH₂-S-C₁-C₈-烷基、-CH₂-S(O)-C₁-C₈-烷基、
-CH₂-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、(C₁-C₆-烷氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₂-C₆-
烯氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(苄
氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺基、苯氧基、-S-
苯基和苯胺基，及

A 表示式(A1)之苯基



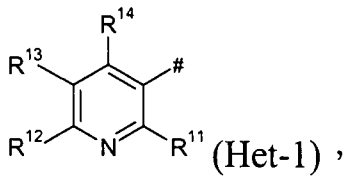
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 0、1、2、3、4 或 5，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、NH₂、SH、SF₅、CHO、OCHO、NHCHO、COOH、氰基、C₁-C₈-烷基、具有 1 至 9 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₃-C₆-環烷基、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷氧基-C₂-C₈-烯基、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷基磺醯胺、-NH(C₁-C₈-烷基)、N(C₁-C₈-烷基)₂、苯基(視需要地經 C₁-C₆-烷氧基取代)和苯氧基，或鍵結至相鄰碳原子的二個 R 一起表示-O(CH₂)_pO-，其中 p 表示 1 或 2，或

A 表示式(Het-1)之雜環



其中

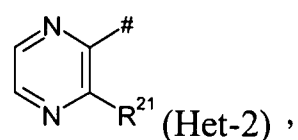
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、

具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1-C_4 -鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 $-S-C_1-C_5$ -
 烷基、 $S(O)-C_1-C_4$ -烷基、 $-S(O)_2-C_1-C_4$ -烷基、 $-S-C_2-C_5$ -烯基、具有
 1 至 5 個鹵素原子之 $-S-C_1-C_4$ -鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之
 C_1-C_4 -鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C_1-C_4 -烷基取代)和 $-S$ -
 苯基(視需要地經鹵素或 C_1-C_4 -烷基取代)，及

R^{12} 、 R^{13} 和 R^{14} ，其可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：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 -鹵烷基、
 C_1-C_4 -烷氧基、 $-S-C_1-C_4$ -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1-C_4 -鹵
 烷氧基、 $-S(O)-C_1-C_4$ -烷基、 $-S(O)_2-C_1-C_4$ -烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R^{21} 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、 C_1-C_4 -烷基和具有 1 至 5
 個鹵素原子之 C_1-C_4 -鹵烷基，

或其醫藥上可接受的鹽、N-氧化物、金屬錯合物或類金屬錯合物。

【0010】 在式(A1)、(Het-1)和(Het-2)中，#描繪A連接至式(I)或式(I-1)
 中之化合物的 $C(O)NR^1$ 部分的鍵。在描述其餘Q之式的情況下，#描繪將Q連
 接至式(I)或式(I-1)之吡啶基部分的鍵。一般而言，除非另有說明，否則在本
 申請案中 # 描繪結構元素的連接鍵。

【0011】 任何根據本發明之化合物可存在一或多個光學或對掌異構
 物形式，其取決於化合物中的不對稱中心數量。本發明因此同等地有關所
 有光學異構物及有關彼等之消旋(racemic)或非消旋(scalemic)混合物("非消

旋"術語表示呈不同比例之鏡像異構物的混合物),而且有關所有比例之所有可能的立體異構物之混合物。非鏡像異構物及/或光學異構物可根據本身為熟習該項技術之一般技術者已知的方法來分離。

【0012】 本發明之化合物亦可存在一或多個幾何異構物形式,其取決於化合物中的雙鍵數量,尤其是所有同/逆(或順/反)異構物及以所有可能的同/逆(或順/反)混合物。本發明因此同等地有關所有幾何異構物及有關所有比例的所有混合物。幾何異構物可根據本身為熟習該項技術之一般技術者已知的方法來分離。

【0013】 式(I)化合物可找到其互變異構形式,其係由該羥基、硫烷基、或胺基基團的質子移位所造成。該等化合物的該等互變異構形式亦為本發明的一部分。更廣泛地說,式(I)化合物的所有互變異構形式,以及視需要可用作製備方法中的中間物並於此等方法說明中定義之化合物的互變異構形式亦為本發明的一部分。

【0014】 而且,本發明係有關醫藥組成物,其包含本發明之化合物。此外,本發明係有關用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之醫藥組成物,其包含本發明之化合物。本發明也提供一種組成物,其包含式(I)化合物、或其N-氧化物、或其醫藥上可接受的鹽,及至少一種藥學上可接受的賦形劑。在一實施態樣中,本發明提供該類組成物,其進一步包含至少一種另外的活性成分,較佳如下所述之混合夥伴。

【0015】 另外,本發明係有關本發明之化合物及/或組成物用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之用途。本發明也提供一種用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之方法,其包含將生物有效量的式(I)化合物;或其N-氧化物、或醫藥上可接受的鹽,或本文中所述之組成物投予至需要的動物或人類。本發明亦關於該方法,其中將包含生

物有效量的式(I)化合物、其N-氧化物、或醫藥上可接受的鹽及至少一種藥學上可接受的賦形劑之組成物投予至需要的動物或人類，該組成物視需要地進一步包含生物有效量的至少一種另外的活性成分，較佳如下所述之混合夥伴。根據本發明，所述用途和方法也適用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之情況。若在任何時候任何該用途或方法僅提及關於動物，此應為一般情況，且除非另有具體說明，否則係指關於動物和人類之用途/方法且不應理解為限制。然而，在一實施態樣中，根據本發明之用途和方法係有關控制、治療及/或預防非人類動物(僅)的蠕蟲感染。在一實施態樣中，根據本發明之方法不包含外科手術的人體治療或對人體實施的治療和診斷方法。

【0016】 如使用於本文中，術語“包含(comprises、comprising)”、“包括(includes、including)”、“具有(has、having)”、“含有(contains; containing)”、“其特徵為”或其任何其他的變化係意欲涵蓋非排他性的涵括，並受到任何明確表示的限制。例如，包含要素列表的組成物、混合物、製程或方法不必僅限於彼等要素，而是可包括該組成物、混合物、製程或方法未明確列出或所固有的其他要素。

【0017】 連接詞“由...組成(consisting of)”排除任何未經指定之要素、步驟或成分。若在申請專利範圍中，該連接詞將該項申請專利範圍侷限於：除了通常與其相關之雜質外，不包括所列舉材料之外者。當該詞“由...組成”出現在申請專利範圍之主體子句中，而非緊接在前言之後時，其只限制在此子句中所述之要素；其他要素並未自該整個申請專利範圍中排除。

【0018】 連接詞“基本上由...組成”係用於定義一種組成物或方法包括除了字面上所揭示者之外的材料、步驟、特徵、成分或要素，其條件為這些另外的材料、步驟、部件，成分或要素不實質上影響所主張的發明之

基本和新穎特徵。術語“基本上由...組成”佔據“包含”和“由...組成”之間一個中間地帶。

【0019】 當申請人已經以開放式術語如“包含”定義發明或其部分時，應容易理解的是(除非另有說明)：該說明應解釋為也描述了該類使用術語“基本上由...組成”或“由...組成”的發明。

【0020】 而且，除非明確有相反的說明，否則“或”係指包容性的或非排他性的或。例如，條件A或B係滿足下列中的任一者：A為真(或存在)和B為假(或不存在)，A為假(或不存在)和B為真(或存在)，及A和B二者皆為真(或存在)。

【0021】 另外，本發明的要素或成分之前的不定冠詞“一(a和an)”意欲非限制性關於要素或成分的情況(即出現)之數量。因此“一(a和an)”應被理解為包括一個或至少一個，及在要素或成分的單數詞語形式亦包括複數，除非有數字明顯表示單數。

【0022】 在上述敘述中，術語“烷基”，單獨使用或使用於複合詞諸如“鹵烷基”中，包括直鏈或支鏈烷基，諸如甲基、乙基、正丙基、異丙基或不同的丁基、戊基或己基異構物。“烯基”包括直鏈或支鏈烯類諸如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、以及不同的丁烯基、戊烯基及己烯基異構物。“烯基”也包括多烯類諸如1,2-丙二烯基及2,4-己二烯基。“炔基”包括直鏈或支鏈炔類諸如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、以及不同丁炔基、戊炔基及己炔基異構物。“炔基”亦包括含複數個參鍵的部分(moieties)，如2,5-己二炔基。

【0023】 “烷氧基”包括(例如)甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基與不同的丁氧基、戊氧基與己氧基異構物。“烷氧基烷基”表示在烷基上之烷氧基取代。“烷氧基烷基”的實例包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

【0024】 “環烷基”包括(例如)環丙基、環丁基、環戊基和環己基。術語“環烷基烷基”表示在烷基部分上之環烷基取代。“環烷基烷基”之實例包括環丙基甲基、環戊基乙基和其他鍵結到直鏈或支鏈烷基的環烷基部分。“環烯基”包括諸如環戊烯基與環己烯基的基團，以及具有超過一個雙鍵的基團，諸如1,3-與1,4-環己二烯基。術語“環烷基環烷基”表示在另一環烷基環上之環烷基取代，其中每個環烷基環獨立具有3到7個碳原子環員。“環烷基環烷基”之實例包括環丙基環丙基(諸如1,1'-雙環丙基-1-基、1,1'-雙環丙基-2-基)、環己基環戊基(諸如4-環戊環基己基)及環己基環己基(諸如1,1'-雙環己基-1-基)與不同之順-及反-環烷基環烷基異構物，(諸如(1R,2S)-1,1'-雙環丙基-2-基與及(1R,2R)-1,1'-雙環丙基-2-基)。

【0025】 術語“鹵素”，單獨或於複合詞如“鹵烷基”中，或者當使用於描述諸如“經鹵素取代之烷基”中時，包括氟、氯、溴或碘。此外，當使用於複合詞諸如“鹵烷基”中時，或者當使用於描述諸如“經鹵素取代之烷基”中時，該烷基可經相同或不同的鹵素原子部分或完全取代。“鹵烷基”或“經鹵素取代之烷基”的實例包括 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 和 CF_3CCl_2 。術語“鹵烷氧基”、“鹵烯基”、“鹵炔基”、等等，定義類似於術語“鹵烷基”。“鹵烷氧基”的實例包括 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。“鹵烯基”的實例包括 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ 。“鹵炔基”的實例包括 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 和 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 。

【0026】 化學縮寫 $\text{C}(\text{O})$ 如使用於本文中表羰基部分。例如， $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 表示乙醯基。化學縮寫 CO_2 和 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ 如使用於本文中表酯部分。例如， CO_2Me 和 $\text{C}(\text{O})\text{OMe}$ 表示甲酯。 CHO 表示醛部分。

【0027】 “OCN”意指 $-\text{O}-\text{C}\equiv\text{N}$ ，及“SCN”意指 $-\text{S}-\text{C}\equiv\text{N}$ 。

【0028】 取代基中的碳原子總數以“ $\text{Ci}-\text{Cj}$ ”字首表示，其中i和j為1到

14的數目。C₂烷氧基烷基指定CH₃OCH₂；C₃烷氧基烷基指定(例如)CH₃CH(OCH₃)、CH₃OCH₂CH₂或CH₃CH₂OCH₂；和C₄烷氧基烷基指定含有總計四個碳原子的經烷氧基取代之烷基的各種異構物，實施例包括CH₃CH₂CH₂OCH₂和CH₃CH₂OCH₂CH₂。

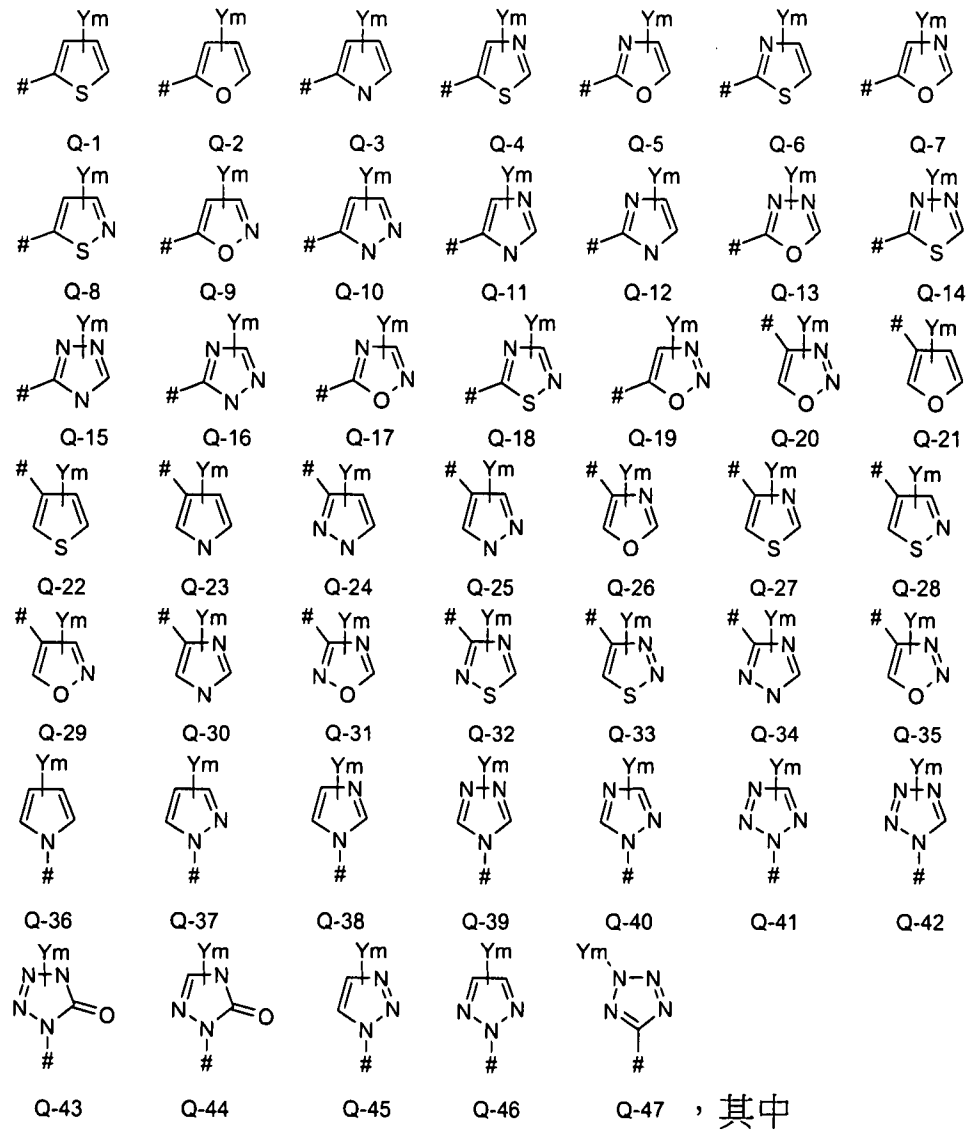
【0029】 當化合物係經帶有指示該取代基之數目的下標可超過1之取代基取代時，該等取代基(當它們超過1時)係獨立選自所定義的取代基之群組，例如n=0、1、2、3或4。當含有取代基(其可為氫)之基團，例如R²或R³，則當此取代基表示為氫時，此被認為是相當於該基團未經取代。

【0030】 除非另有指示，否則作為式(I)之成分的“環”或“環系統”為碳環或雜環。術語“環系統”表示二或多個稠合環。術語“雜環”表示其中至少一個形成環骨架之原子不為碳(例如，氮、氧或硫)的環。典型雜環含有不超過4個氮、不超過2個氧和不超過2個硫。除非另有指示，否則雜環可為飽和、部分不飽和、或完全不飽和的環。術語“雜環系統”表示其中環系統之至少一個環為雜環的環系統。除非另有指示，否則雜環和環系統可藉由該碳或氮上之氫的置換而連接任何可用的碳或氮。

【0031】 如使用於本文中，除非另有指示，否則下列定義應適用。術語“視需要經取代”可與短語“經取代或未經取代”或與術語“(未)經取代”互換使用。詞句“視需要經1至4個取代基取代”意指沒有取代基存在(即未經取代)或指1、2、3或4個取代基存在(受限於可鍵結位置之數目)。除非另有指示，否則視需要經取代之基團可具有在基團之各可取代位置的取代基，且各取代彼此獨立。

【0032】 下列有關式(I)之實施態樣應理解為係指根據本發明之化合物本身或指用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之根據本發明的化合物，或二者。

【0033】 在一實施態樣中，本發明提供式(I)化合物，其中
Q 表示選自由Q-1至Q-47所組成群組之5-員環：



描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

且 m 和 Y 具有如前所述的意義，及

R¹、n、X、和A具有如本文中所述之意義。

【0034】 根據另一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
Q 表示選自由Q-1至Q-47所組成群組之5-員環，且

m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，

及

各 Y係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、

C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-烷胺基、二-(C₁-C₄-烷基)胺基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、C₂-C₄-烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₄-鹵烯氧基、C₃-C₄-炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₄-鹵炔氧基、C₃-C₆-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₆-鹵環烷基、C₁-C₄-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₄-烷基)、-CON(C₁-C₄-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₄-烷基)、-CON(OC₁-C₄-烷基)(C₁-C₄-烷基)、C₁-C₄-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧羰基、C₁-C₄-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰氧基、C₁-C₄-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₄-烷基)、-OCON(C₁-C₄-烷基)₂、-OCONH(OC₁-C₄-烷基)、-OCO(OC₁-C₄-烷基)、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)-具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 -S(O)₂-C₁-C₄- 鹵 烷 基 、 -CH₂-S-C₁-C₄- 烷 基 、 -CH₂-S(O)-C₁-C₄-烷基、-CH₂-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、(C₁-C₄-烷氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，及

R¹、n、X、和A具有如本文中所述之意義。

【0035】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中 Q 表示選自由Q-1至Q-47所組成群組之5-員環，且 m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，

及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基
和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，及

R¹、n、X、和A具有如本文中所述之意義。

【0036】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
Q 表示選自由下列所組成群組之5-員環：Q-1、Q-2、Q-3、Q-4、Q-5、Q-6、
Q-7、Q-8、Q-9、Q-10、Q-11、Q-12、Q-13、Q-14、Q-15、Q-16、Q-18、
Q-21、Q-22、Q-23、Q-24、Q-25、Q-26、Q-27、Q-28、Q-29、Q-30、
Q-31、Q-32、Q-33、Q-34、Q-36、Q-37、Q-38、Q-39、Q-40、Q-41和
Q-44，

且 m 和 Y 具有如前所述之意義，及

R¹、n、X、和A具有如本文中所述之意義。

【0037】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
Q 表示選自由下列所組成群組之5-員環：Q-1、Q-4、Q-6、Q-10、Q-21、
Q-23、Q-24、Q-25、Q-27、Q-37、Q-41和Q-44，

且 m 和 Y 具有如前所述之意義，及

R¹、n、X、和A具有如本文中所述之意義。

【0038】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
Q 表示選自由下列所組成群組之5-員環：Q-21、Q-23、Q-25、Q-37和Q-44，
且 m 和 Y 具有如前所述之意義，及

R¹、n、X、和A具有如本文中所述之意義。

【0039】 在另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
n 為1或2，受限於取代基 X 可連接至其之環中的可用位置數，
各 X係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-

烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-烷胺基、二-(C₁-C₄-烷基)胺基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、C₂-C₄-烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₄-鹵烯氧基、C₃-C₄-炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₄-鹵炔氧基、C₃-C₆-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₆-鹵環烷基、C₁-C₄-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₄-烷基)、-CON(C₁-C₄-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₄-烷基)、-CON(OC₁-C₄-烷基)(C₁-C₄-烷基)、C₁-C₄-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧羰基、C₁-C₄-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰氧基、C₁-C₄-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₄-烷基)、-OCON(C₁-C₄-烷基)₂、-OCONH(OC₁-C₄-烷基)、-OCO(OC₁-C₄-烷基)、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₄-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₄-鹵烷基、(C₁-C₄-烷氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，及

R¹、Q和A具有如本文中所述之意義。

【0040】 根據另一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中 n 為1或2，受限於取代基X可連接至其之環中的可用位置數，各X係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，及

R¹、Q和A具有如本文中所述之意義。

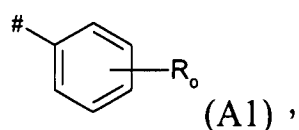
【0041】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為1或2，受限於取代基X可連接至其之環中的可用位置數，
各X係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素和CF₃，及
R¹、Q和A具有如本文中所述之意義。

【0042】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
n 為1或2，受限於取代基X可連接至其之環中的可用位置數，
X 為Cl，及
R¹、Q和A具有如本文中所述之意義。

【0043】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
n 為1，及
R¹、X、Q和A具有如本文中所述之意義。

【0044】 在另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
A 表示式(A1)之苯基



其中

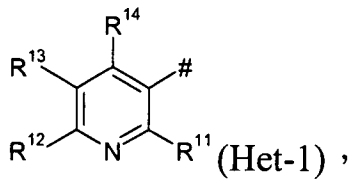
描述將A連接至分子其餘部分之鍵，

o 為0、1或2，及

各R係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、CHO、
OCHO、NHCHO、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5個鹵素原子之
C₁-C₄-鹵烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-環烷基、-S-C₁-C₄-
烷基、具有1至5個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、
具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₄-烯
基、C₁-C₄-烷氧羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷氧羰基、
C₁-C₄-烷羰氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷羰氧基、

-S(O)-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₄-鹵烷基、
-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₄-鹵烷基、
C₁-C₄-烷基磺醯胺、-NH(C₁-C₄-烷基)、N(C₁-C₄-烷基)₂、苯基(視需要地經 C₁-C₄-烷氧基取代)和苯氧基，或鍵結至相鄰碳原子的二個 R 一起表示-O(CH₂)_pO-，其中 p 表示 1 或 2，或

A 表示式(Het-1)之雜環



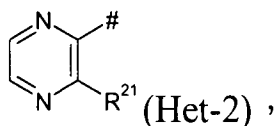
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、-S-C₁-C₅-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

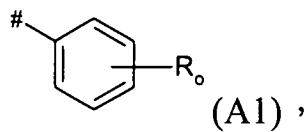
A 表示式(Het-2)之雜環



其中

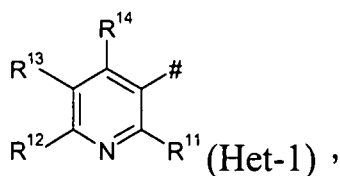
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及
R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5
個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，及
R¹、n、X和Q具有如本文中所述之意義。

【0045】 根據另一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
A 表示式(A1)之苯基



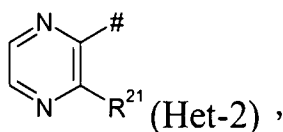
其中
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，
o 為 0、1 或 2，及
各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、具有 1 至 5
個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷
氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



其中
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，
R¹¹ 為具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，及
R¹²、R¹³和 R¹⁴為氫，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

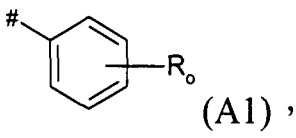
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R²¹ 為具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，及

R¹、n、X和Q具有如本文中所述之意義。

【0046】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

A 表示式(A1)之苯基



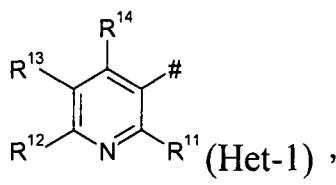
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-CF₃、-CHF₂、
-OCF₃，或

A 表示式(Het-1)之雜環



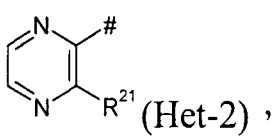
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 為 CF₃，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴ 為氫，或

A 表示式(Het-2)之雜環



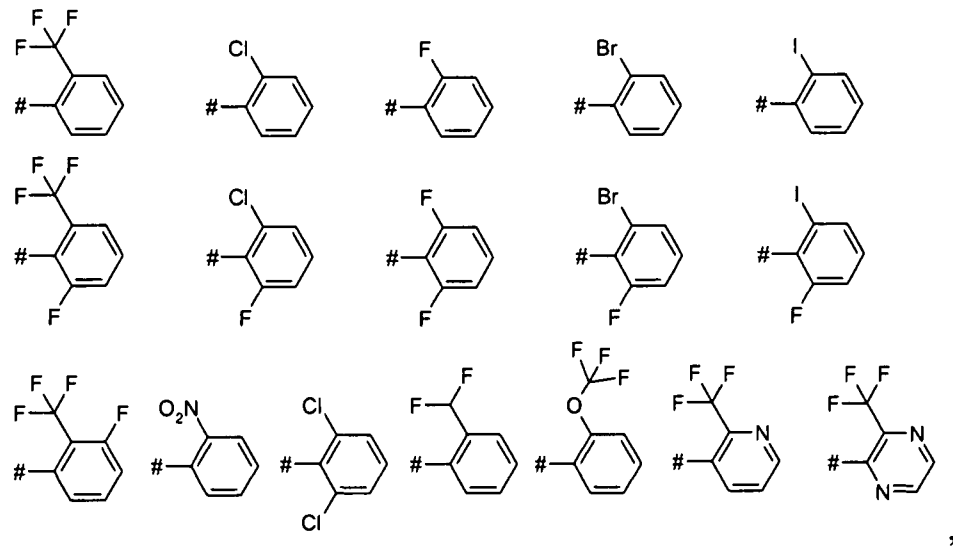
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及
 R^{21} 為 CF_3 ，及

R^1 、n、X和Q具有如本文中所述之意義。

【0047】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

A 係選自由下列所組成之群組：



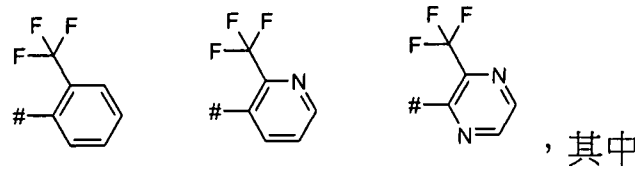
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R^1 、n、X和Q具有如本文中所述之意義。

【0048】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

A 係選自由下列所組成之群組：

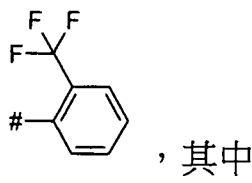


描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R^1 、n、X和Q具有如本文中所述之意義。

【0049】 根據又一實施態樣，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

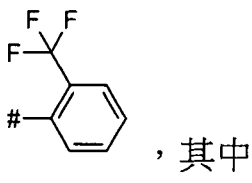
A 為



描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及
R¹、n、X和Q具有如本文中所述之意義。

【0050】 在另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，
其中A、R¹、n、X和Q具有如本文中所述之意義，
其條件為：若

A 為



- # 描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，
- R¹ 為氫，
- X 為氯，在其所連接之吡啶環的位置 3，及
- n 為 1，則
- Q 不為 Q-21 或
- Q 不為 Q-37 或
- Q 不為Q-21和Q-37。

【0051】 除了個別實施態樣，上述個別實施態樣的任何可能組合提供
在本發明範圍內的根據式(I)之化合物。這些組合導致在本發明範圍內的另
外具體實施態樣，其一些係以舉例的方式由下列特定實施態樣說明。

【0052】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
n 為1或2，受限於取代基 X可連接至其之環中的可用位置數，
各 X係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-

烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-烷胺基、二-(C₁-C₄-烷基)胺基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、C₂-C₄-烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₄-鹵烯氧基、C₃-C₄-炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₄-鹵炔氧基、C₃-C₆-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₆-鹵環烷基、C₁-C₄-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₄-烷基)、-CON(C₁-C₄-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₄-烷基)、-CON(OC₁-C₄-烷基)(C₁-C₄-烷基)、C₁-C₄-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧羰基、C₁-C₄-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰氧基、C₁-C₄-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₄-烷基)、-OCON(C₁-C₄-烷基)₂、-OCONH(OC₁-C₄-烷基)、-OCO(OC₁-C₄-烷基)、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₄-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₄-鹵烷基、(C₁-C₄-烷氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₄-烷基、(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，

Q 表示選自由下列所組成群組之 5-員環：Q-1、Q-2、Q-3、Q-4、Q-5、Q-6、Q-7、Q-8、Q-9、Q-10、Q-11、Q-12、Q-13、Q-14、Q-15、Q-16、Q-17、Q-18、Q-19、Q-20、Q-21、Q-22、Q-23、Q-24、Q-25、Q-26、Q-27、Q-28、Q-29、Q-30、Q-31、Q-32、Q-33、Q-34、Q-35、Q-36、Q-37、Q-38、Q-39、Q-40、Q-41、Q-42、Q-43、Q-44、Q-45、Q-46 和 Q-47，且

m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，

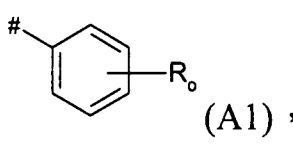
及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、
 C_1 - C_4 -烷基、C 具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基、 C_2 - C_4 -烯基、
 C_2 - C_4 -炔基、 C_1 - C_4 -烷基胺基、二- $(C_1$ - C_4 -烷基)胺基、 C_1 - C_4 -烷氧基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷氧基、 C_2 - C_4 -烯氧基、具有 1
至 5 個鹵素原子之 C_2 - C_4 -鹵烯氧基、 C_3 - C_4 -炔氧基、具有 1 至 5 個
鹵素原子之 C_3 - C_4 -鹵炔氧基、 C_3 - C_6 -環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原
子之 C_3 - C_6 -鹵環烷基、 C_1 - C_4 -烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之
 C_1 - C_4 -鹵烷羰基、 $-CONH(C_1$ - C_4 -烷基)、 $-CON(C_1$ - C_4 -烷基) $_2$ 、
 $-CONH(OC_1$ - C_4 -烷基)、 $-CON(OC_1$ - C_4 -烷基)(C_1 - C_4 -烷基)、 C_1 - C_4 -
烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷氧羰基、 C_1 - C_4 -
烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷羰氧基、 C_1 - C_4 -
烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷羰胺基、
 $-OCONH(C_1$ - C_4 -烷基)、 $-OCON(C_1$ - C_4 -烷基) $_2$ 、 $-OCONH(OC_1$ - C_4 -
烷基)、 $-OCO(OC_1$ - C_4 -烷基)、 $-S-C_1$ - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原
子之 $-S-C_1$ - C_4 -鹵烷基、 $-S(O)-C_1$ - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子
之 $-S(O)-C_1$ - C_4 -鹵烷基、 $-S(O)_2-C_1$ - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子
之 $-S(O)_2-C_1$ - C_4 -鹵烷基、 $-CH_2-S-C_1$ - C_4 -烷基、 $-CH_2-S(O)-C_1$ - C_4 -烷基、
 $-CH_2-S(O)_2-C_1$ - C_4 -烷基、 $(C_1$ - C_4 -烷氧基亞胺基)- C_1 - C_4 -烷基、 $(C_2$ - C_6 -
烯氧基亞胺基)- C_1 - C_4 -烷基、 $(C_3$ - C_6 -炔氧基亞胺基)- C_1 - C_4 -烷基、 $($ 苄
氧基亞胺基)- C_1 - C_6 -烷基、苄氧基、 $-S$ -苄基、苄胺基、苯氧基、 $-S$ -
苯基和苯胺基，

R^1 係選自由下列所組成之群組：氫、 $-CHO$ 、 $-OH$ 、 C_1 - C_4 -烷基、具有 1
至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原

子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₆-鹵環烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-環烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷胺基-C₁-C₄-烷基、二-(C₁-C₄-烷基)胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰基、C₁-C₄-烷氧羰基、苄氧羰基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷羰基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，及具有 1 至 5 個鹵素原子之 -S(O)₂-C₁-C₄-鹵烷基，及

A 表示式(A1)之苯基



其中

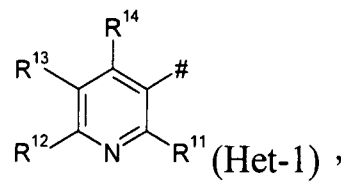
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 0、1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、CHO、OCHO、NHCHO、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-環烷基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧羰基、C₁-C₄-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₄-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷基磺醯胺、-NH(C₁-C₄-烷基)、N(C₁-C₄-烷基)₂、苯基(視需要地經 C₁-C₄-烷氧基取代)和苯氧基，或鍵結至相鄰碳原子的二個

R 一起表示-O(CH₂)_pO-，其中 p 表示 1 或 2，或

A 表示式(Het-1)之雜環



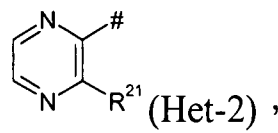
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、-S-C₁-C₅-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

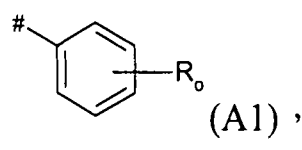
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷基。

【0053】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

- n 為1，
- X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷氧基，
- Q 表示選自由下列所組成群組之視需要地經單-或多取代之雜芳族環：
Q-1、Q-2、Q-3、Q-4、Q-5、Q-6、Q-7、Q-8、Q-9、Q-10、Q-11、Q-12、
Q-13、Q-14、Q-15、Q-16、Q-18、Q-21、Q-22、Q-23、Q-24、Q-25、
Q-26、Q-27、Q-28、Q-29、Q-30、Q-31、Q-32、Q-33、Q-34、Q-36、
Q-37、Q-38、Q-39、Q-40、Q-41 和 Q-44，
- 且
- m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，
- 及
- 各 Y係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、-CF₃、-CH₂CF₃、甲基、乙基、氟、氯、溴、碘、氰基、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-OCH(CH₃)₂、-OCH₂CF₃、-CH₂-S(O)₂-CH₃，
- R¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷羰基、C₁-C₄-烷氧羰基，及

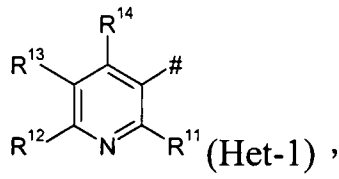
A 表示式(A1)之苯基



- 其中
- # 描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，
- o 為 0、1 或 2，及
- 各 R係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、氰基、

C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧羰基、-NH(C₁-C₄-烷基)、苯基(視需要地經 C₁-C₄-烷氧基取代)和苯氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



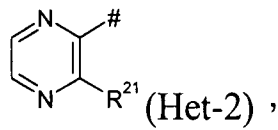
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、-S-C₁-C₅-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有1至5

個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷基。

【0054】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中
n 為1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷氧基，

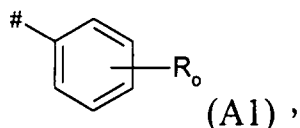
Q 表示選自由下列所組成群組之5-員環：Q-1、Q-4、Q-6、Q-10、Q-21、Q-23、Q-24、Q-25、Q-27、Q-37、Q-41和Q-44，且

m 為0、1或2，受限於取代基Y可連接至其之Q中的可用位置數，
及

各Y係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、-CF₃、-CH₂CF₃、甲基、乙基、氟、氯、溴、碘、氰基、-OCH₃、-OCH₂CH₃，

R¹ 為氫，及

A 表示式(A1)之苯基



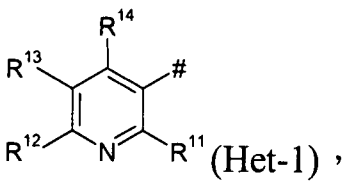
其中

描述將A連接至分子其餘部分之鍵，

o 為1或2，及

各R係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



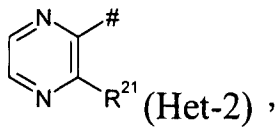
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基。

【0055】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為 1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、-CF₃，

Q 表示選自由下列所組成群組之 5-員環：Q-21、Q-23、Q-25、Q-37 和 Q-44，且

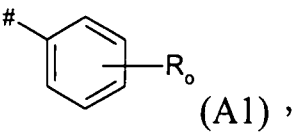
m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，

及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、-CF₃、-CH₂CF₃、
甲基、乙基、氟、氯，

R¹ 為氫，及

A 表示式(A1)之苯基



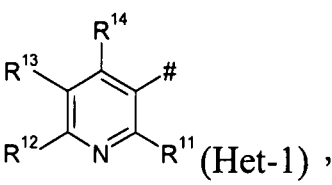
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、氰基、
甲基和-CF₃，或

A 表示式(Het-1)之雜環



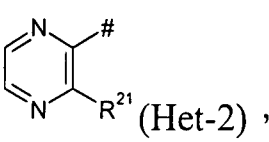
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、甲基和-CF₃，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：
氫、鹵素和-CF₃，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

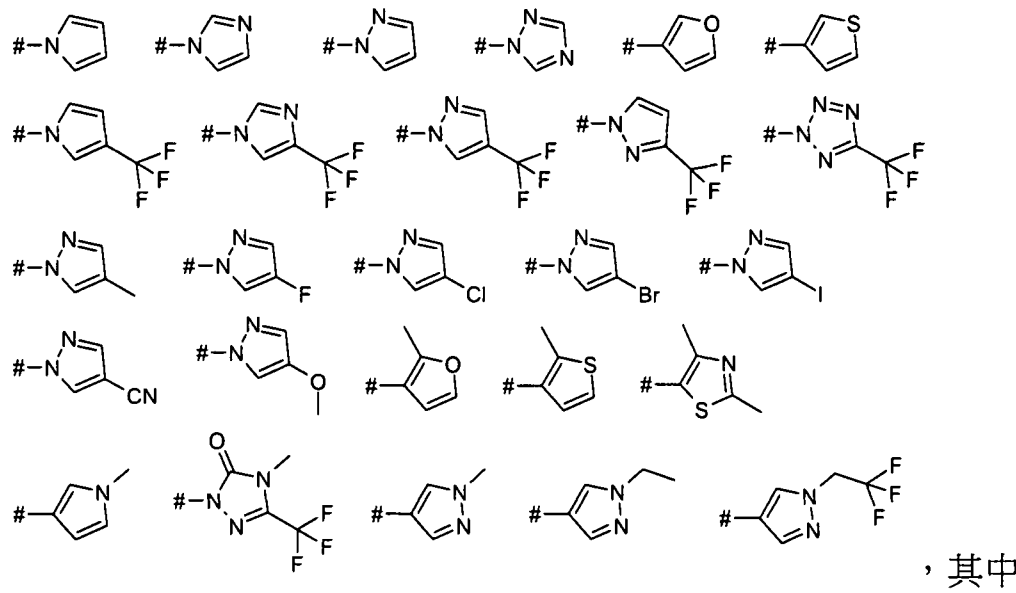
R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、甲基和-CF₃。

【0056】 在另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基，

Q 係選自由下列所組成之群組：

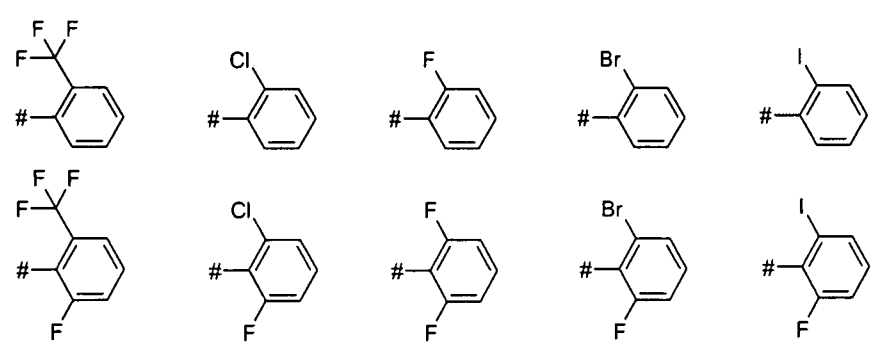


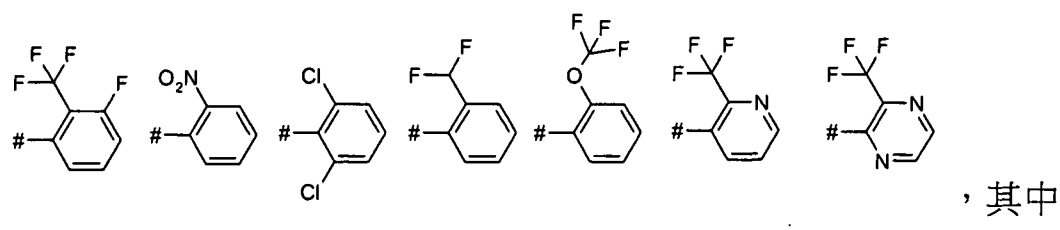
，其中

描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹ 為氫，及

A 係選自由下列所組成之群組：





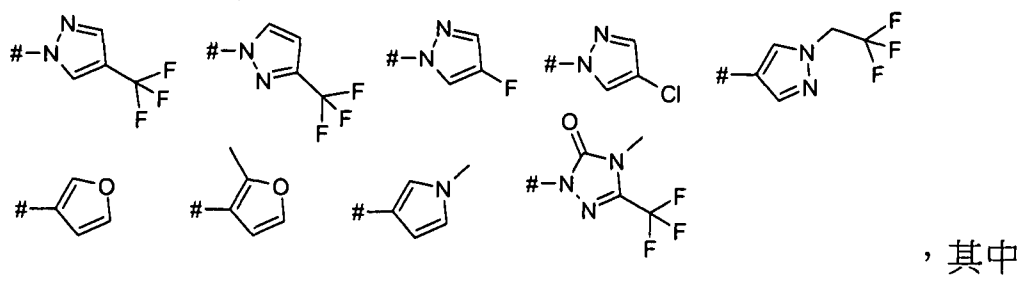
描述將A連接至分子其餘部分之鍵。

【0057】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫或氯，

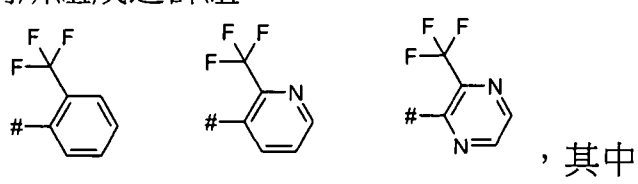
Q 係選自由下列所組成之群組：



描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹ 為氫，及

A 係選自由下列所組成之群組：



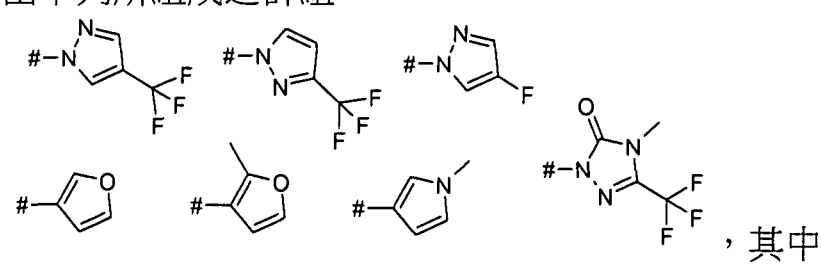
描述將A連接至分子其餘部分之鍵。

【0058】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫或氯，

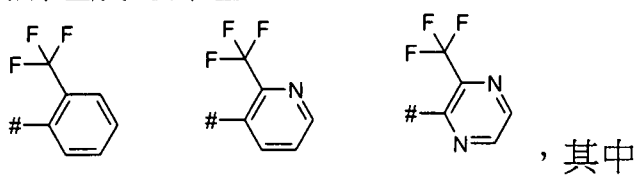
Q 係選自由下列所組成之群組：



描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹ 為氫，及

A 係選自由下列所組成之群組：



，其中

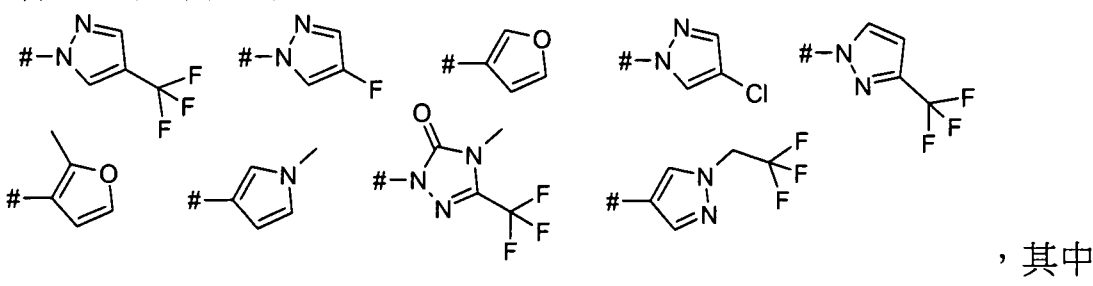
描述將A連接至分子其餘部分之鍵。

【0059】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為1，

X 為氯，

Q 係選自由下列所組成之群組：

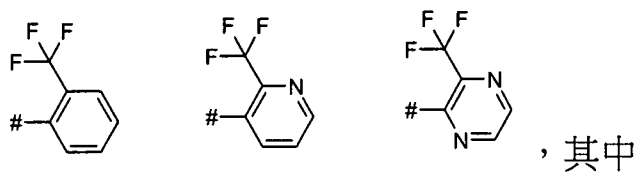


，其中

描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹ 為氫，及

A 係選自由下列所組成之群組：



，其中

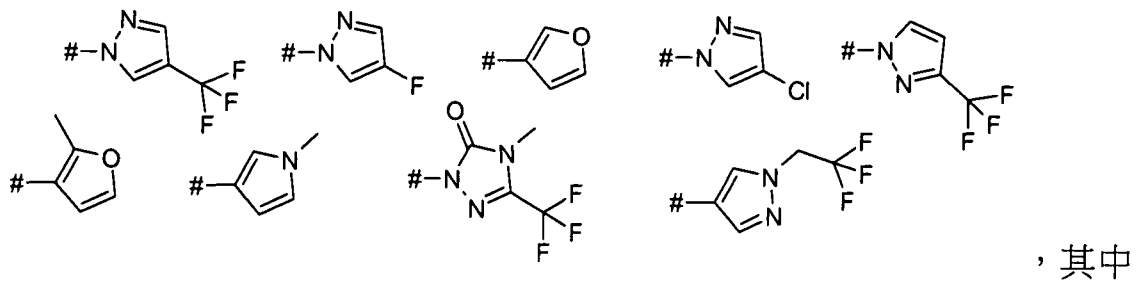
描述將A連接至分子其餘部分之鍵。

【0060】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為1，

X 為氯，

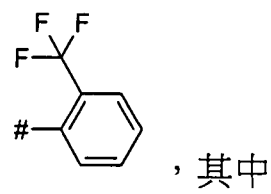
Q 係選自由下列所組成之群組：



描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹ 為氫，及

A 為



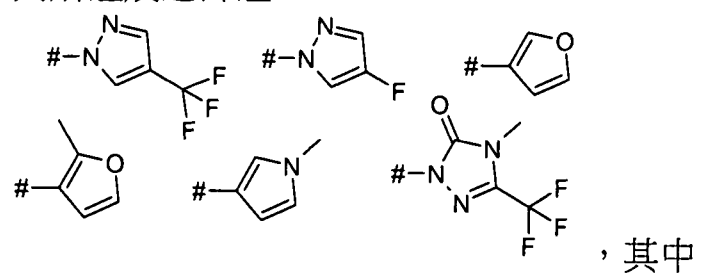
描述將A連接至分子其餘部分之鍵。

【0061】 在又另一實施態樣中，本發明提供根據式(I)之化合物，其中

n 為1，

X 為氯，

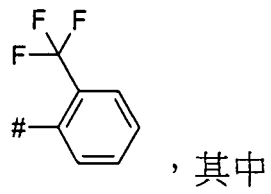
Q 係選自由下列所組成之群組：



描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹ 為氫，及

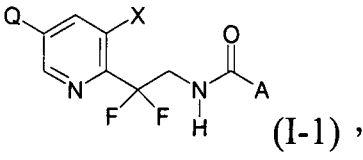
A 為



描述將A連接至分子其餘部分之鍵。

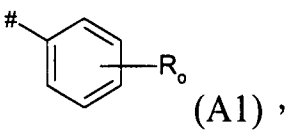
【0062】 在基團的各個組合中特別指示的基團之定義係根據需要而不論該等基團所指示的特定組合替換為其它組合的基團之定義。

【0063】 在另一實施態樣中，本發明提供用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之下式(I-1)化合物



其中

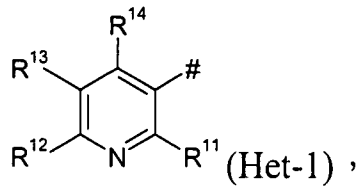
- Q 為選自由下列所組成群組之 5-員環：Q-1、Q-4、Q-6、Q-10、Q-21、Q-23、Q-24、Q-25、Q-27、Q-37、Q-41 和 Q-44，且
- m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及
- 各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，
- X 係選自由下列所組成之群組：氟、氯和三氟甲基，及
- A 表示式(A1)之苯基



其中

- # 描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，
- o 為 0、1 或 2，及
- 各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁C₁-C₄-烷氧羰基、-NH(C₁-C₄-烷基)，苯基(視需要地經 C₁-C₄-烷氧基取代)和苯氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



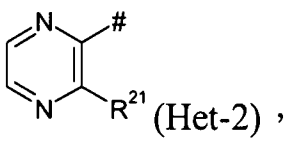
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、-S-C₁-C₅-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



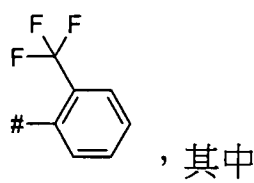
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

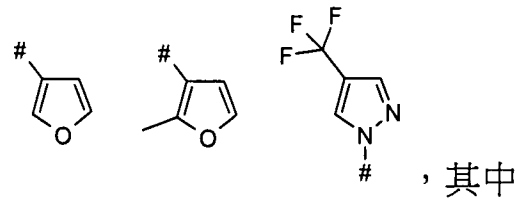
R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，

其條件為：若

A 為

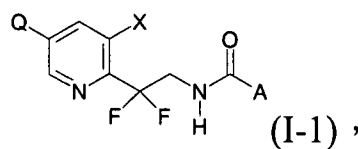


- # 描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及
- X 為氯，則
- Q 不為下列中之一者



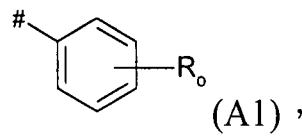
描述將Q連接至分子其餘部分之鍵。

【0064】 在又一實施態樣中，本發明提供下式(I-1)之化合物



其中

- Q 為選自由下列所組成群組之 5-員環：Q-1、Q-4、Q-6、Q-10、Q-21、Q-23、Q-24、Q-25、Q-27、Q-37、Q-41 和 Q-44，且
- m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及
- 各 Y係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，
- X 係選自由下列所組成之群組：氟、氯和三氟甲基，及
- A 表示式(A1)之苯基



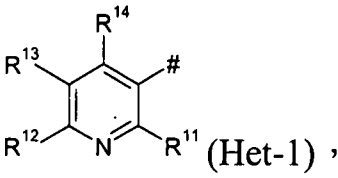
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 0、1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、氰基、
C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₃-C₆-環烷
基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧羰基、-NH(C₁-C₄-烷基)、苯基(視需
要地經 C₁-C₄-烷氧基取代)和苯氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



其中

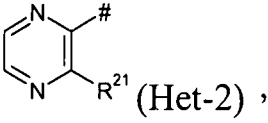
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、
具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、-S-C₁-C₅-
烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有
1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之
C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-
苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：

氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-
鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子
之 C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



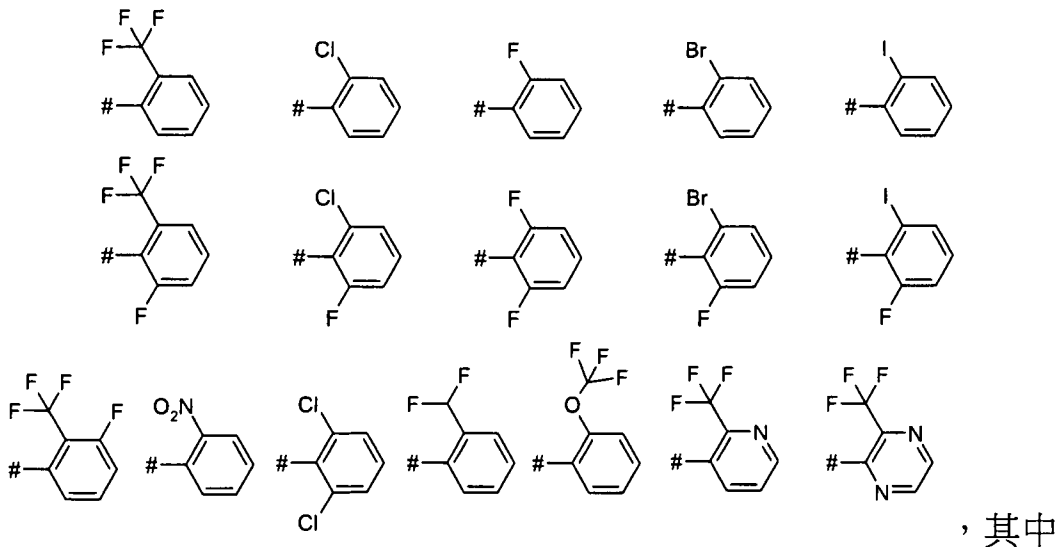
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及
R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有1至5
個鹵素原子之C₁-C₄-鹵烷基，
其用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染。

【0065】 下列關於式(I-1)之實施態樣應理解為係指該等根據本發明
之化合物本身或指該等用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染
之根據本發明化合物，或二者。

【0066】 在又一另外實施態樣中，本發明提供根據式(I-1)之化合物，
其中

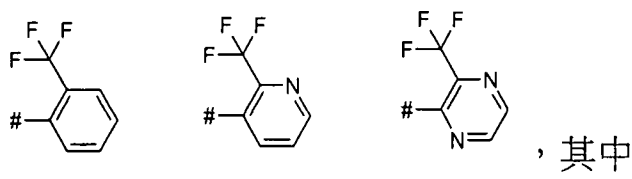
A 係選自由下列所組成之群組：



描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及
Q和X具有如前述關於式(I-1)的意義。

【0067】 在又一另外實施態樣中，本發明提供根據式(I-1)之化合物，
其中

A 係選自由下列所組成之群組：



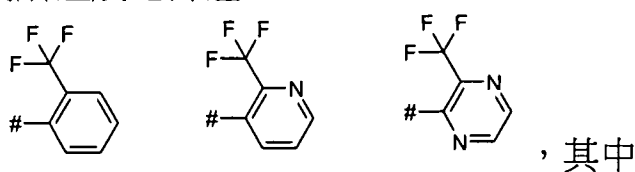
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及
Q和X具有如前述關於式(I-1)的意義。

【0068】 在又一另外實施態樣中，本發明提供根據式(I-1)之化合物，
其中
Q 表示選自由下列所組成群組之5-員環：Q-21、Q-23、Q-37和Q-44，且
m 和 Y 具有如前述關於式(I-1)的意義，及
X和A具有如前述關於式(I-1)的意義。

【0069】 在又一另外實施態樣中，本發明提供根據式(I-1)之化合物，
其中
X 為氯，及
Q和A具有如前述關於式(I-1)的意義。

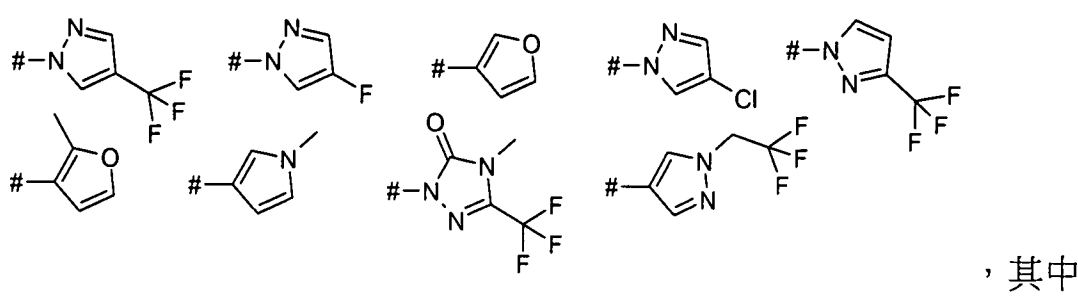
【0070】 在又一另外實施態樣中，本發明提供根據式(I-1)之化合物，
其中

A 係選自由下列所組成之群組：



描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，
X 為氯，及

Q 係選自由下列所組成之群組：

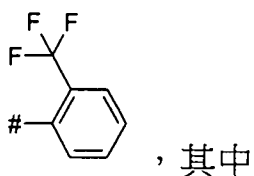


描述將Q連接至分子其餘部分之鍵。

【0071】 在又一另外實施態樣中，本發明提供根據式(I-1)之化合物，

其中

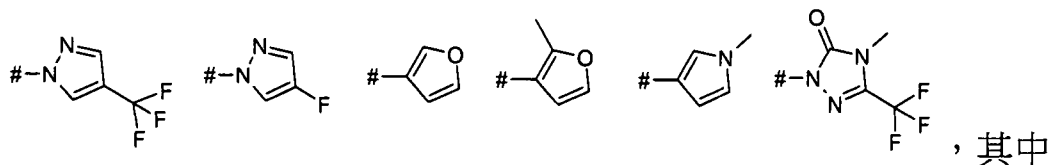
A 為



描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

X 為氯，及

Q 係選自由下列所組成之群組：



描述將Q連接至分子其餘部分之鍵。

【0072】 基團的定義，及給予於上文之一般或較佳選擇或另外實施態樣的範圍之闡釋彼此可任意組合，因此包括各自範圍和較佳選擇/實施態樣的範圍之間的組合。定義和闡釋適用於最終產物以及前驅物和對應中間物。

【0073】 本發明另外係有關一種醫藥組成物，其包含至少一種根據前面所提及的實施態樣中任一者之式(I)化合物。

【0074】 本發明另外係有關一種用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之醫藥組成物，其包含至少一種根據前面所提及的實施態樣中任一者之式(I)化合物。

【0075】 本發明另外係有關前面所提及的實施態樣中任一者之式(I)化合物用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之用途。

【0076】 本發明另外係有關如前面所提及的醫藥組成物用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之用途。

【0077】 本發明另外係有關前面所提及的實施態樣中任一者之式(I)

化合物用於製造供控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之藥物的用途。

【0078】 本發明另外係有關一種用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之方法，其包含將有效量之前面所提及的實施態樣之式(I)化合物或如前面所提及的醫藥組成物投藥至需要其之動物或人類的步驟。

【0079】 飽和或不飽和烴基團諸如烷基、烷二基或烯基在各情況下(無論是單獨或與雜原子結合，例如在烷氧基中)-可為-可能的話-為直鏈或支鏈。

【0080】 除非另有指示，否則任何經取代之基團可經一或多次取代且在多取代的情況下取代基為相似或不同。

【0081】 在被稱作為較佳的基團之定義中，鹵素(鹵基)為氟基、氯基、溴基和碘基，非常較佳為氟基、氯基和溴基，及尤佳為氟基和氯基。

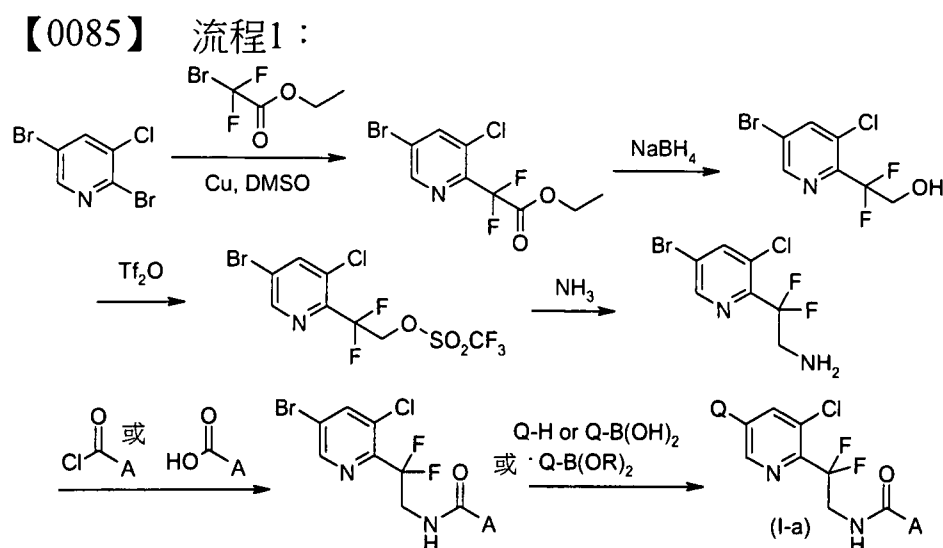
步驟和方法

【0082】 式(I)化合物的合成可根據或類似於流程1 (式(I-a)化合物的合成)進行。所需要的起始材料為已知的或可經由更詳細地描述於WO 2007/141009、WO 2013/064460或WO 2014/004064中的一般已知方法獲得。

【0083】 式(I-a)之化合物係藉由偶聯反應合成。在Q= N-鍵結之唑類的情況下，也可使用與唑QH、氧化銅(I)、碘化鉀、水楊醛肟或反-N,N-二甲基環己烷二胺作為配位基在溶劑如乙腈或二噁烷中，在鹼如碳酸鉀或碳酸鉀存在下的銅介導之方法。在Q=碳鍵結之雜環的情況下，可使用與適當硼酸(Q-B(OH)₂)或酯(Q-B(OR)₂)在鈀觸媒和鹼存在下的鈴木型偶聯。

【0084】 另外具有式(I-a)之Q=三唑的化合物可如US2011/0077410 A1中所述經由重氮化-還原將胺轉化至對應肼並隨後的三唑形成而獲得。具有Q =四唑之化合物係經重氮化-氰化將胺轉化成對應腈和隨後與疊氮化物

的環加成而獲得。



【0086】 根據本發明之化合物可根據上述方法製備。然而應當理解的是，根據該項技術人員的普通知識和可用出版物，其將能夠根據所要合成之各化合物的細節調整此方法。

【0087】 本發明之化合物可用作殺內寄生蟲劑。至少在本發明的情況下，作為殺內寄生蟲劑之用途應包括控制、治療及/或預防動物和人類(較佳非人類動物中)中的蠕蟲感染之用途。

【0088】 本發明之化合物係作為抗動物和人類中之內寄生蟲的抗蠕蟲劑。

【0089】 在獸醫領域中及在動物飼養時，根據本發明之活性化合物的投藥係以適宜製劑形式以已知方式直接地或經腸、胃腸外、經皮或經鼻進行。投藥可預防性地或治療性地進行。

【0090】 在動物健康領域中，即在獸醫學領域中，根據本發明之化合物係具有抗動物寄生蟲(尤其是內寄生蟲)之活性。內寄生蟲術語特別包括蠕蟲與原生動物，例如球蟲(coccidia)。式(I)化合物較佳係具有抗蠕蟲之活性。

【0091】 在獸醫學領域中，具有利的溫血毒性之根據本發明化合物適合於控制出現在動物育種和畜牧業的家畜、育種動物、動物園動物、實驗

室動物、實驗動物和家養動物中的寄生蟲。彼等具有對抗所有或特定發育期之寄生蟲的活性。

【0092】 農業家畜包括(例如)哺乳動物諸如綿羊、山羊、馬、驢、駱駝、水牛、兔、馴鹿、黥鹿，且特別是牛和豬；或家禽諸如火雞、鴨、鵝、且特別是雞；例如水產養殖大之魚或甲殼動物；或視情況可為昆蟲諸如蜜蜂。

【0093】 家畜包括(例如)哺乳類動物，諸如倉鼠、天竺鼠、大鼠、小鼠、絨鼠、雪貂、或特別是狗、貓；籠中鳥；爬蟲類；兩棲類和觀賞魚。

【0094】 根據一較佳實施態樣，根據本發明之化合物係投予至哺乳動物。

【0095】 根據另一較佳實施態樣，根據本發明之化合物係投予至鳥類，亦即籠中鳥且特別是家禽。

【0096】 藉由使用根據本發明之活性化合物控制動物寄生蟲(較佳蠕蟲)，意欲減少或防止病症、死亡個案和性能降低(在肉、奶、羊毛、皮革、蛋、蜂蜜、等等的情況下)，致使能夠更經濟和更簡單地飼育動物且可達成更好的動物福利。

【0097】 本文中所使用之關於動物健康領域的“控制(control或controlling)"術語意指活性化合物有效地將感染該等寄生蟲的動物中之個別寄生蟲的數目減少至無害程度。更明確地說，"控制(controlling)"如使用於本文中意指活性化合物可有效地殺死個別寄生蟲、抑制其生長、及/或抑制其繁殖。

【0098】 人類和動物之例示性致病內寄生蟲(其為蠕蟲)包括扁形動物門(Platyhelmintha)(例如單殖目(monogenea)、條蟲及吸蟲)、線蟲、棘頭動物門(acanthocephala)及舌形動物門(pentastoma)。另外的例示性蠕蟲包括但

沒有任何限制：

單殖目(Monogenea)，例如：三代蟲屬(*Gyrodactylus* spp.)、指環蟲屬(*Dactylogyrus* spp.)、多盤吸蟲屬(*Polystoma* spp.)

條蟲(Cestodes)：來自擬葉目(Pseudophyllidea)，例如：裂頭條蟲屬(*Diphyllobothrium* spp.)、旋宮條蟲屬(*Spirometra* spp.)、裂首條蟲屬(*Schistocephalus* spp.)、舌狀條蟲屬(*Ligula* spp.)、溝槽條蟲屬(*Bothridium* spp.)、複殖孔條蟲屬(*Diplogonoporus* spp.)

來自圓葉目(Cyclophyllida)之目，例如：中殖孔條蟲屬(*Mesocestoides* spp.)、裸頭條蟲屬(*Anoplocephala* spp.)、副裸頭條蟲屬(*Paranoplocephala* spp.)、莫尼茨條蟲屬(*Moniezia* spp.)、隧體條蟲屬(*Thysanosoma* spp.)、曲子官條蟲屬(*Thysaniezia* spp.)、無卵黃腺條蟲(*Avitellina* spp.)、斯泰勒條蟲屬(*Stilesia* spp.)、裸頭條蟲屬(*Cittotaenia* spp.)、安迪亞條蟲屬(*Andyra* spp.)、伯特條蟲屬(*Bertiella* spp.)、帶狀條蟲屬(*Taenia* spp.)、棘球條蟲屬(*Echinococcus* spp.)、泡尾條蟲屬(*Hydatigera* spp.)、戴文條蟲屬(*Davainea* spp.)、雷氏條蟲屬(*Raillietina* spp.)、包膜條蟲屬(*Hymenolepis* spp.)、棘殼條蟲屬(*Echinolepis* spp.)、棘葉條蟲屬(*Echinocotyle* spp.)、雙睾條蟲屬(*Diorchis* spp.)、複孔條蟲屬(*Dipylidium* spp.)、約優克斯條蟲屬(*Joyeuxiella* spp.)、雙孔條蟲屬(*Diplopylidium* spp.)

吸蟲：來自複殖目(Digenea)之綱，例如：複口吸蟲屬(*Diplostomum* spp.)、莖雙穴吸蟲屬(*Posthodiplostomum* spp.)、血吸蟲屬(*Schistosoma* spp.)、毛畢屬(*Trichobilharzia* spp.)、毛樣線蟲屬(*Ornithobilharzia* spp.)、澳畢吸蟲屬(*Austroilharzia* spp.)、巨畢吸蟲屬(*Gigantobilharzia* spp.)、彩蚴吸蟲屬(*Leucochloridium* spp.)、短咽吸蟲屬(*Brachylaima* spp.)、棘口吸蟲屬(*Echinostoma* spp.)、棘緣吸蟲屬(*Echinoparyphium* spp.)、棘隙吸蟲屬

(*Echinochasmus* spp.)、低頸吸蟲屬(*Hypoderaeum* spp.)、肝吸蟲屬(*Fasciola* spp.)、擬片形吸蟲(*Fasciolides* spp.)、薑片蟲屬(*Fasciolopsis* spp.)、環腸吸蟲屬(*Cyclocoelum* spp.)、盲腔屬(*Typhlocoelum* spp.)、雙口吸蟲屬(*Paramphistomum* spp.)、杯殖吸蟲屬(*Calicophoron* spp.)、盤吸蟲屬(*Cotylophoron* spp.)、巨盤吸蟲屬(*Gigantocotyle* spp.)、菲策吸蟲屬(*Fischoederius* spp.)、腹袋吸蟲屬(*Gastrothylacus* spp.)、背孔吸蟲屬(*Notocotylus* spp.)、下彎吸蟲屬(*Catatropis* spp.)、斜睪吸蟲屬(*Plagiorchis* spp.)、前殖吸蟲屬(*Prosthogonimus* spp.)、雙腔吸蟲屬(*Dicrocoelium* spp.)、闊盤吸蟲屬(*Eurytrema* spp.)、鮭吸蟲屬(*Troglootrema* spp.)、並殖吸蟲屬(*Paragonimus* spp.)、肛瘤吸蟲屬(*Collyriclum* spp.)、隱孔吸蟲屬(*Nanophyetus* spp.)、後睪吸蟲屬(*Opisthorchis* spp.)、支睪吸蟲屬(*Clonorchis* spp.)、次睪吸蟲屬(*Metorchis* spp.)、異形吸蟲屬(*Heterophyes* spp.)、後殖吸蟲屬(*Metagonimus* spp.)

線蟲：來自毛形線蟲亞目(*Trichinellida*)，例如：鞭蟲屬(*Trichuris* spp.)、絲蟲屬(*Capillaria* spp.)、*Paracapillaria* 屬、裂頭條蟲屬(*Trichomosoides* spp.)、旋毛蟲屬(*Trichinella* spp.)、*Eucoleus* 屬；

來自墊刃目(*Tylenchida*)之目，例如：細絲鯰屬(*Micronema* spp.)、糞桿線蟲屬(*Strongyloides* spp.)；

來自小桿圓蟲目(*Rhabditida*)之目，例如：圓蟲屬糞小桿線蟲(*Strongylus* spp.)、三齒線蟲屬(*Triodontophorus* spp.)、食管齒線蟲屬(*Oesophagodontus* spp.)、毛樣線蟲屬(*Trichonema* spp.)、輻首線蟲屬(*Gyalocephalus* spp.)、柱咽線蟲屬(*Cylindropharynx* spp.)、孟口線蟲屬(*Poteriostomum* spp.)、環腸線蟲屬(*Cyclococercus* spp.)、杯冠線蟲屬(*Cylicostephanus* spp.)、腸結節蟲屬(*Oesophagostomum* spp.)、夏柏特線蟲屬(*Chabertia* spp.)、冠尾線蟲屬

(*Stephanurus* spp.)、鉤蟲屬(*Necator* spp.)、鉤口線蟲屬(*Ancylostoma* spp.)、彎口線蟲屬(*Uncinaria* spp.)、仰口線蟲屬(*Bunostomum* spp.)、球頭線蟲屬(*Globocephalus* spp.)、開口蟲屬(*Syngamus* spp.)、杯口線蟲屬(*Cyathostoma* spp.)、肺蟲屬(*Metastrongylus* spp.)、網尾線蟲屬(*Dictyocaulus* spp.)、繆氏線蟲屬(*Muellerius* spp.)、原圓線蟲屬(*Protostrongylus* spp.)、新圓線蟲屬(*Neostrongylus* spp.)、囊尾線蟲屬(*Cystocaulus* spp.)、肺圓蟲屬(*Pneumostomum* spp.)、尖尾線蟲亞屬(*Spicocaulus* spp.)、鹿圓線蟲屬(*Elaphostomum* spp.)、副鹿圓線蟲屬(*Parelaphostomum* spp.)、環棘線蟲屬(*Crenosoma* spp.)、副環棘線蟲屬(*Paracrenosoma* spp.)、管圓線蟲屬(*Angiostrongylus* spp.)、貓圓線蟲屬(*Aelurostrongylus* spp.)、類絲蟲屬(*Filaroides* spp.)、副類絲蟲屬(*Parafilaroides* spp.)、奧斯勒屬(*Oslerus* spp.)、毛樣線蟲屬(*Trichostrongylus* spp.)、血矛線蟲屬(*Haemonchus* spp.)、牛胃絲蟲屬(*Ostertagia* spp.)、背帶線蟲屬種(*Teladorsagia* spp.)、馬什線蟲屬(*Marshallagia* spp.)、古柏線蟲屬(*Cooperia* spp.)、細頸線蟲屬(*Nematodirus* spp.)、豬圓線蟲屬(*Hyostomum* spp.)、尖柱線蟲屬(*Obeliscoides* spp.)、裂口線蟲屬(*Amidostomum* spp.)、盤尾絲蟲屬(*Ollulanus* spp.)；螺旋線蟲屬(*Heligmosomoides* spp.)、日圓線蟲屬(*Nippostrongylus* spp.)；

來自旋尾目(*Spirurida*)之目，例如：尖尾線蟲屬(*Oxyuris* spp.)、蟯蟲屬(*Enterobius* spp.)、栓尾線蟲屬(*Passalurus* spp.)、管狀線蟲屬(*Syphacia* spp.)、無刺線蟲屬(*Aspicularis* spp.)、異刺線蟲屬(*Heterakis* spp.)；蛔蟲屬(*Ascaris* spp.)、弓蛔線蟲屬(*Toxascaris* spp.)、弓首蛔蟲屬(*Toxocara* spp.)、貝利斯蛔蟲屬(*Baylisascaris* spp.)、副蛔蟲屬(*Parascaris* spp.)、異尖線蟲屬(*Anisakis* spp.)、禽蛔蟲屬(*Ascaridia* spp.)；顎口線蟲屬(*Gnathostoma* spp.)、泡翼線蟲屬(*Physaloptera* spp.)、吸吮線蟲屬(*Thelazia* spp.)、筒線蟲屬(*Gongylonema*

spp.)、麗線蟲屬(*Habronema* spp.)、副柔線蟲屬(*Parabronema* spp.)、德斯線蟲屬(*Draschia* spp.)、龍線蟲屬(*Dracunculus* spp.)；冠絲蟲屬(*Stephanofilaria* spp.)、副絲蟲屬(*Parafilaria* spp.)、腹腔絲蟲屬(*Setaria* spp.)、羅阿絲蟲屬(*Loa* spp.)、心絲蟲屬(*Dirofilaria* spp.)、光絲蟲屬(*Litomosoides* spp.)、布氏絲蟲屬(*Brugia* spp.)、吳策線蟲屬(*Wuchereria* spp.)、蟠尾絲蟲屬(*Onchocerca* spp.)、蟠尾線蟲屬(*Spirocerca* spp.)

棘頭動物門(*Acanthocephala*)：來自寡棘吻目(*Oligacanthorhynchida*)之目，例如：巨吻棘頭蟲屬(*Macracanthorhynchus* spp.)、前罩棘頭蟲屬(*Prosthenorchis* spp.)；來自多形目(*Polymorphida*)之目，例如：細頸棘頭蟲屬(*Filicollis* spp.)；來自念珠目(*Moniliformida*)之目，例如：念珠棘頭蟲屬(*Moniliformis* spp.)；來自棘吻目(*Echinorhynchida*)之目，例如，棘頭蟲屬(*Acanthocephalus* spp.)、棘吻蟲屬(*Echinorhynchus* spp.)、似細吻棘頭蟲屬(*Leptorhynchoides* spp.)；舌形動物門(*Pentastoma*)：來自舌形蟲目(*Porocephalida*)之目，例如，舌形蟲屬(*Linguatula* spp.)。

【0099】 因此，本發明之一實施態樣係指用作藥物之根據本發明化合物。

【0100】 另一態樣係指根據本發明之化合物用作抗內寄生蟲劑，特別是抗蠕蟲劑。例如，在畜牧業、在動物育種、在動物籠舍、在衛生領域中，例如，根據本發明之化合物可用作抗內寄生蟲劑，特別是抗蠕蟲劑。

【0101】 在動物健康或獸醫領域之情況中，術語"治療"包括預防性、後預防性(*metaphylactic*)或治療性治療。在一個具體實施態樣中，對於動物健康領域，亦提供與其他抗蠕蟲劑的混合物。

【0102】 例示性混合夥伴包括而沒有任何限制：
抗蠕蟲活性成分，包括殺線蟲、殺白蟻(*trematicidal*)和殺細胞的活性成分：

來自大環內酯之類型，例如：

阿巴汀(abamectin)、多拉菌素(doramectin)、甲胺基阿維菌素(emamectin)、乙醯胺基阿維菌素(eprinomectin)、阿維菌素(ivermectin)、伊維菌素(ivermectin)、米貝黴素(milbemycin)、莫西菌素(moxidectin)、奈馬克丁(nemadectin)、塞拉菌素(selamectin)；

來自苯并咪唑和前苯并咪唑之類型，例如：

阿苯達唑(albendazole)、阿苯達唑亞碲、坎苯達唑(cambendazole)、環苯達唑(cyclobendazole)、非班太爾(febantel)、芬苯達唑(fenbendazole)、氟苯達唑(flubendazole)、甲苯達唑(mebendazole)、奈托比胺(netobimin)、奧芬達唑(oxfendazole)、奧苯達唑(oxibendazole)、帕苯達唑(parbendazole)、腐絕(thiabendazole)、多保淨(thiophanate)、三氯苯達唑(triclabendazole)；

來自環辛酯肽(cyclooctadepsipeptide)之類型，例如：

艾莫得賽得(emodepside)、PF1022；

來自胺基乙腈衍生物之類型，例如：

莫盤太爾(monepantel)；

來自四氫嘧啶之類型，例如：

莫侖太爾(morantel)、噻嘧啶(pyrantel)、奧克太爾(oxantel)；

來自咪唑并噻唑之類型，例如：

布他咪唑(butamisol)、左旋咪唑(levamisole)、四咪唑(tetramisol)；

來自柳醯胺苯之類型，例如：

溴沙尼特(bromoxanide)、溴替尼特(brotianide)、氯碘沙尼(cloxanide)、氯氰碘柳胺(closantel)、氯硝柳胺(niclosamide)、羥氯柳苯胺(oxyclozanide)、雷複尼特(rafoxanide)、三溴沙侖(tribromsalan)；

來自對郝青醯胺(paraherquamide)之類型，例如：

得曲恩特(derquantel)、對郝青醯胺(paraherquamide)；

來自胺基苯基脒之類型，例如：

阿米太爾(amidantel)、去醯基化阿米太爾(dAMD)、三苯雙脒(tribendimidine)；

來自有機磷酸酯之類型，例如：

牛壁逃(coumaphos)、育畜磷(crufomate)、二氯松(dichlorvos)、哈洛克酮(haloxon)、萘肽磷(naftalofos)、三氯松(trichlorfon)；

來自經取代的酚之類型，例如：

硫雙二氯酚(bithionole)、二碘硝酚(disophenol)、六氯酚(hexachlorophen)、聯硝氯酚(niclofolan)、美克芬崙(meniclopholan)、硝碘酚腈(nitroxynil)；

來自哌啶酮之類型，例如：

吡嗪酮(praziquantel)、依西太爾(epsiprantel)；

來自羰基胺苯之類型，例如：

雙咪苯脒(imidocarb)；

來自喹啉酮生物鹼之類型，例如：

鹵夫酮(halofuginon)；

來自磺醯胺之類型，例如：

沙克立(sulfaclozin)；

來自三吡之類型，例如：

地克珠利(diclazuril)、托曲珠利(toltrazuril)；

來自各種其他類別，例如：

硝硫氰胺(amoscanate)、苳芬寧(bephenium)、丁萘脒(bunamidine)、氯硝西泮(clonazepam)、氯舒隆(clorsulon)、地芬尼泰(diamfenetid)、二氯酚(dichlorophen)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、吐根素(emetine)、三氯苯哌嗪

(hetolin)、海恩酮(hycanthone)、硫恩酮(lucanthone)、米列西(miracil)、米拉傘(mirasan)、氯硝柳胺(niclosamide)、硝咪唑(niridazole)、硝碘酚腈(nitroxynil)、硝硫氰酯(nitroscanate)、奧替普拉(oltipraz)、歐法洛提(omphalotin)、奧沙尼喹(oxamniquine)、巴龍黴素(paromomycin)、哌嗪(piperazine)、雷瑣太爾(resorantel)。

【0103】 所有命名的混合夥伴，若彼等的官能基允許的話，則視需要地與適當鹼或酸形成鹽。

【0104】 在另一具體實施態樣中，對於動物健康領域，亦提供與殺外寄生蟲劑的混合物。

【0105】 例示性混合夥伴包括而沒有任何限制：

來自脘衍生物之類型，例如：

三亞蟎(amitraz)、殺蟲脘(chlormebuform)、蟎蜱胺(cymiazole)、得米地曲(demiditraz)；

來自芳基異噁唑啉之類型，不排除與吡咯啉或吡咯啉部分置換異噁唑啉環相關的類型，例如：

厄福內(afoxolaner)、氟拉內(fluralaner)；

來自蘇力菌菌株之類型，例如：

蘇力菌菌株；

來自苯甲醯基脘之類型，例如：

雙三氟蟲脘(bistrifluron)、克福隆(chlofluazuron)、定蟲隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟佐隆(fluzuron)、氟蟎脘(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、諾伏隆(noviflumuron)、氟幼脘(penfluron)、得福隆(teflubenzuron)、三伏隆(triflumuron)；

來自 β -酮腈衍生物之類型，例如：

腈吡蟎酯(cyenopyrafen)、賽芬蟎(cyflumetofen)；

來自胺基甲酸酯之類型，例如：

棉鈴威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、涕滅虱威(aldoxycarb)、除害威(allyxycarb)、滅害威(aminocarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、必克蝨(bufencarb)、畜蟲威(butacarb)、佈嘉信(butocarboxim)、丁酮虱威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、地蟲威(cloethocarb)、敵蠅威(dimetilan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、丁基滅必蝨(fenobucarb)、芬硫克(fenothiocarb)、覆滅蟎(formetanate)、藻蟎威(formparanate)、呋線威(furathiocarb)、滅必虱(isoprocarb)、威百畝(metam-sodium)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、治滅蝨(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、猛殺威(promecarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、硫伐隆(thiofanox)、啞蚜威(triazamate)、混殺威(trimethacarb)、xmc、滅爾蝨(xylylcarb)；

來自氯菸鹼基(chloronicotinyl)之類型氯基，例如：

亞滅培(acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、達特南(dinotefuran)、弗哌第呋隆(flupyradifurone)、益達胺(imidacloprid)、尼古丁(nicotine)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、硝蟲噻嗪(nithiazine)、噻蟲啉(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)；

來自二醯肼之類型，例如：

可芬諾(chromafenozide)、氯蟲醯肼(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide)；

來自二醯胺之類型，例如：

氯蟲醯胺(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)；

來自二甲醯胺之類型，例如：

蟲醯胺(flubendiamide)；

來自二硝基酚之類型，例如：

樂殺蟎(binapacryl)、敵蟎通(dinobuton)、敵蟎普(dinocap)、dnoc；

來自進食抑制劑之類型，例如：

冰晶石(cryolite)、氟尼胺(flonicamid)、派滅淨(pymetrozine)；

來自煙薰劑之類型，例如：

磷化鋁、溴甲烷、硫醯氟(sulphuryl fluoride)；

來自鹵化碳氫化合物 (hch)之類型，例如：

ddt、甲氧滴滴涕(methoxychlor)；

來自大環內酯之類型，例如：

莫西菌素(moxidectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、拉替菌素(latidectin)、

雷皮菌素(lepimectin)；

來自微生物之類型，例如：

桿菌屬種(bacillus spec.)、白僵菌屬種(beauveria spec.)、綠僵菌屬種(metarrhizium spec.)、擬青黴屬種(paecilomyces spec.)、輪枝胞屬種(verticillium spec.)；

來自蟎生長抑制劑之類型，例如：

胺福美特(amidoflume)、苯洛賽(benclothiaz)、西脫蟎(benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、新殺蟎(bromopropylate)、殺蟲脒(chlordimeform)、克氯苯(chlorobenzilate)、氯化苦(chloropicrin)、克芬蟎(clofentezine)、氯賽本(clothiazoben)、環普靈(cycloprene)、地昔尼爾(dicyclanil)、依殺蟎(etoxazole)、芬諾靈(fenoxacrim)、氟硝二苯胺(fentrifanil)、氟苯亞胺噻唑(flubenzimine)、嘧蟲胺(flufenerim)、殺蟎淨(flutenzin)、紅鈴蟲性誘劑(gossyplure)、合賽多

(hexythiazox)、愛美松 (hydramethylnone)、日本麗金龜性誘素(japonilure)、惡蟲酮(metoxadiazone)、石油、油酸鉀、啖蟲丙醚(pyridalyl)、蟎離丹(quinomethionate)、殺蟎硫醚(tetrasul)、苯蟎噻 (triarathene)；

來自天然產物之類型，例如：

十二碳二烯醇(codlemone)、精油、蘇力菌素(thuringiensin)；

來自印楝成分之類型，例如：

印楝素(azadirachtin) a；

來自沙蠶毒素類似物之類型，例如：

免速達(bensultap)、培丹(cartap)、氟啖蟲胺脒(sulfoxaflo)、硫賜安(thiocyclam)、硫賜安草酸氫鹽、殺蟲雙(thiosultap sodium)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)；

來自有機酸之類型，例如：

甲酸、草酸；

來自有機氯之類型，例如：

毒殺芬(camphchlor)、氯丹(chlordane)、安殺番(endosulfan)、 γ -hch、hch、飛佈達(heptachlor)、靈丹(lindane)；

來自有機磷酸鹽之類型，例如：

歐殺松(acephate)、阿隆芬文松(aromfenvinfos)(-甲基)、阿莫松(aromophos)-乙基、奧他硫松(autathiofos)、亞滅松(azamethiphos)、谷速松(azinphos)(-甲基、-乙基)、硫線磷(cadusafos)、三硫磷(carbophenothion)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、克芬松(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)(-甲基/-乙基)、苯腈磷(cyanofenphos)、殺螟腈(cyanophos)、滅賜松(demeton-s-methyl)、滅賜砒(demeton-S-methylsulphon)、氯亞胺硫磷(dialifos)、大利松(diazinon)、除線磷(dichlofenthion)、二氯松(dichlorvos)/ddvp、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏

(dimethylvinphos)、蔬果磷(dioxabenzofos)、二硫松(disulfoton)、epn、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、益多松(etrifos)、氨磺磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、繁福松(fensulfothion)、芬殺松(fenthion)、福拉松(flupyrzofos)、大福松(fonofos)、福木松(formothion)、丁苯硫磷(fosmethilan)、福賽絕(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、碘硫磷(iodofenphos)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依殺松(isazofos)、亞芬松(isofenphos)、o-水楊酸異丙酯、加福松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、滅克松(methacrifos)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、乃力松(naled)、歐滅松(omethoate)、滅多松(oxydemeton-methyl)、巴拉松(parathion)(-甲基/-乙基)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidone)、福賜卡(phosphocarb)、巴賽松(phoxim)、亞特松(pirimiphos)(-甲基/-乙基)、佈飛松(profenofos)、加護松(propaphos)、撲達松(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、發硫磷(prothoate)、白克松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、必達松(pyridathion)、拜裕松(quinalphos)、克線丹(sebufos)、硫特普(sulfotep)、硫丙磷(sulprofos)、丁噠硫磷(tebupirimfos)、亞培松(temephos)、托福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、硫滅松(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(triclorfon)、繁米松(vamidothion)。

【0106】 來自有機錫化合物之類型，例如：

亞環錫(azocyclotin)、錫蟎丹(cyhexatin)、芬佈賜(fenbutatin-oxide)；

來自其他去偶合劑之類型，例如：

氟蟲胺(sulfluramid)；

來自其他角質層發育的抑制劑之類型，例如：

布芬淨(buprofezin)、賽滅淨(cyromazine)；

來自其他角質層發育的抑制劑之類型，例如：

布芬淨(buprofezin)、賽滅淨(cyromazine)；

來自其他之類型，例如：

蟎離丹(chinomethionat)、必伏隆(pyrifluquinazon)；

來自噁二吡之類型，例如：

因得克(indoxacarb)；

來自苯基吡唑之類型，例如：

乙醯蟲腈(acetoprole)、乙蟲清(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、吡氟蟲腈(pyrafluprole)、吡蟲腈(pyriprole)、三氟甲硫蟲腈(vaniliprole)；

來自擬除蟲菊酯(pyrethroid)之類型，例如：

阿納寧(acrinathrin)、亞列寧(allethrin，d-順-反、d-反-)、 β -賽扶寧(beta-cyfluthrin)、畢芬寧(bifenthrin)、百亞列寧(bioallethrin)、百亞列寧-s-環戊烯基異構物、苄呋烯菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、百列滅寧(bioresmethrin)、氯威迫速寧(chlovaporthrin)、順-亞滅寧(cypermethrin)、順-百滅寧(permethrin)、順-列滅寧(resmethrin)、三氟氯氰菊酯(clocythrins)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)(λ -)、亞滅寧(cypermethrin)(α -、 β -、 θ -、 ξ -)、賽芬寧(cyphenothrin)、第滅寧(deltamethrin)、益避寧(empenthrin)(1r-異構物)、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、五氟苯菊酯(fenfluthrin)、芬普寧(fenpropathrin)、氯吡氰菊酯(fenpyrithrin)、芬化利(fenvalerate)、溴護賽寧(flubrocycythrinate)、護賽寧(flucythrinate)、三氟醚菊酯(flufenprox)、福滅寧(flumethrin)、福化利(flualinate)、苄蟎醚(fubfenprox)、 γ -賽洛寧、依普寧(imiprothrin)、剋特寧(kadethrin)、 λ -賽洛寧、美特寧(metofluthrin)、百滅寧

(permethrin)、(順-、反-)，酚丁滅蟲(phenothrin) (1r-反異構物)、普亞列寧(prallethrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、普屈芬布(protrifenbute)、派滅寧(pyresmethrin)、除蟲菊素(pyrethrin)(除蟲菊精(pyrethrum))、列滅寧(resmethrin)、ru 15525、氟矽菊酯(silafluofen)、 τ -福化利(fluvalinate)、七氟菊酯(tefluthrin)、環戊烯丙菊酯(terallethrin)、治滅寧(tetramethrin) (-1r-異構物)、泰滅寧(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)、zxi 8901；

來自吡咯之類型，例如：

克凡派(chlorfenapyr)；

來自醌之類型，例如：

亞醌蟎(acequinocyl)；

來自魚藤酮(rotenone)之類型，例如：

魚藤酮；

來自半卡脞之類型，例如：

美氟綜(metaflumizone)；

來自賜諾斯(spinosyn)之類型，例如：

賜諾特(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)；

來自特窗酸和特密酸(tetramic acid)衍生物之類型，例如：

賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)；

來自沙蠶毒素(nereistoxin)類似物之類型，例如：

免速達(bensultap)、培丹(cartap)、氟啉蟲胺脲(sulfoxaflor)、硫賜安(thiocyclam)、

硫賜安草酸氫鹽、殺蟲雙(thiosultap sodium)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)；

來自各種其他類別，例如：

硝硫氰胺(amoscanate)、苳芬寧(bephenium)、丁蔡脒(bunamidine)、氯硝西洋

(clonazepam)、氯舒隆(clorsulon)、地芬尼泰(diamfenetid)、二氯酚

(dichlorophen)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、吐根素(emetine)、三氯苯哌嗪(hetolin)、海恩酮(hycanthone)、硫恩酮(lucanthone)、米列西(miracil)、米拉傘(mirasan)、氯硝柳胺(niclosamide)、硝咪唑(niridazole)、硝碘酚腈(nitroxynil)、硝硫氰酯(nitroscanate)、奧替普拉(oltipraz)、歐法洛提(omphalotin)、奧沙尼喹(oxamniquine)、巴龍黴素(paromomycin)、哌啶(piperazine)、雷瑣太爾(resorantel)。

【0107】 包括鹽類像鹽酸鹽、酒石酸鹽、檸檬酸鹽、恩波酸鹽/雙羥萘酸鹽或苯甲酸鹽。

【圖式簡單說明】

無

【實施方式】

製備例

【0108】 ^1H -NMR-數據用配備流通槽(60 μl 體積)之Bruker Avance 400或用配備1.7 mm cryo-CPTCI探頭之Bruker AVIII 400或用配備cyroTCI探頭之Bruker AVII 600 (600.13MHz)或用配備cryo CPMNP探頭之Bruker AVIII 600(601.6MHz)與四甲基矽烷作為參考(0.0)及溶劑 CD_3CN 、 CDCl_3 、或 D_6 -DMSO來測定。

【0109】 所選擇之實施例的NMR數據係典型型式(δ 值、多重性、氫原子數)或呈NMR波峰列表來列示。

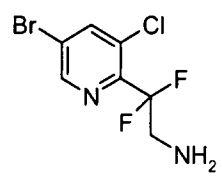
【0110】 製備例1之步驟的NMR光譜和實施例1-6之NMR光譜已以Varian 400 MHz Mercury Plus測定。

製備例 1：

步驟 1：

【0111】 類似於WO 2013/064460 A1進行2-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)-2,2-

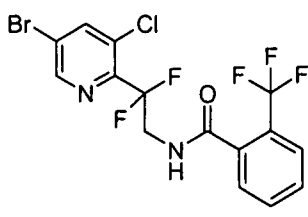
二氟乙胺的合成。



¹H-NMR (400 MHz, d6-DMSO); δ 8.78 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.52 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.37 (t, J = 14.8 Hz, 2H), 1.72 (s, 2H).

步驟2：

【0112】 N-[2-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)-2,2-二氟乙基]-2-(三氟甲基)苯甲醯胺的合成

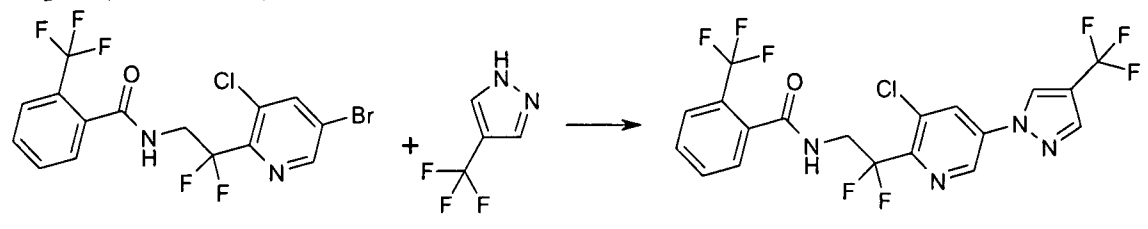


在室溫下將三乙胺(3.38 ml, 3.0 eq.)和2-三氟甲基苯甲酸氯化物(1.68 g, 1.0 eq.)加至2-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)-2,2-二氟乙胺(2.56 g, 1.03 eq.)在二氯甲烷(50 ml)中的溶液，及攪拌過夜。反應完成後，用水稀釋反應混合物並用二氯甲烷萃取。在減壓下蒸發合併之有機層的溶劑。藉矽膠層法析(環己烷/乙酸乙酯)純化殘餘物以產生2.86 g (68.5 %)呈灰白色固體。

¹H-NMR (400 MHz, d6-DMSO); δ 8.97 (t, 1H, NH), 8.80 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 7.77 – 7.63 (m, 3 H), 7.45 (d, 1H), 4.28 – 4.19 (m, 2H).

步驟3：

【0113】 N-[2-[3-氯-5-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]-2-吡啶基]-2,2-二氟乙基]-2-(三氟甲基)苯甲醯胺的合成(實施例3)



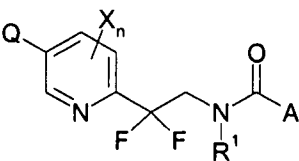
將 170 mg (0.38 mmol) N-[2-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)-2,2-二氟乙基]-2-(三氟甲基)苯甲醯胺(來自步驟 2)和 62.6 mg(0.46 mmol) 4-(三氟甲基)-1H-吡唑溶解在 5 mL 乙腈中，其後，添加 5.48 mg 氧化銅(II)(0.03 mmol)，187.3 mg (0.57 mmol) 碳酸銨和 10.5 mg (0.07 mmol)水楊基醛肟並在密封瓶中於 100℃ 下加熱 24 小時。將反應混合物經過矽膠-硫酸鈉筒過濾，蒸發溶劑並藉由製備級 HPLC 純化粗製產物以產生 50 mg (24.4 %)的呈灰白色固體之標題化合物。

¹H-NMR (400 MHz, d6-DMSO) ; 9.45 (s, 1H), 9.21 (s, 1H), 9.01 (t, 1H, NH), 8.69 (d, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.78-7.63 (m, 3H), 7.47 (d, 1H), 4.34-4.25 (m, 2H)。

【0114】 根據上述方法，已製得下列通式(I)之化合物。

表1

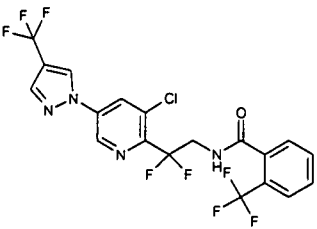
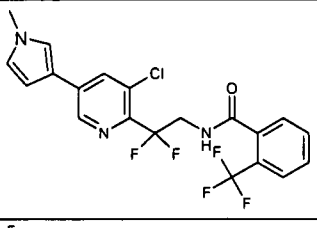
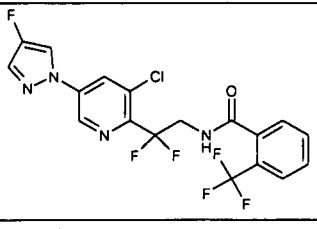
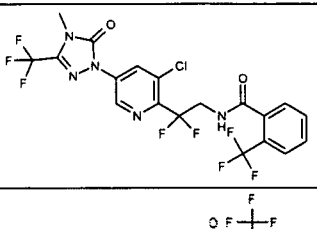
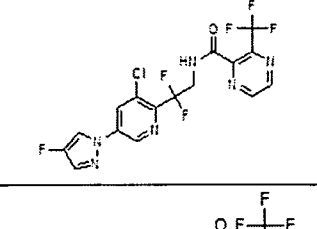
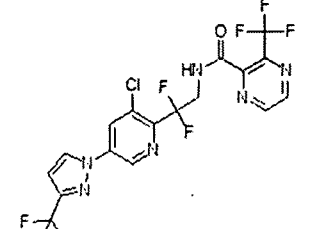
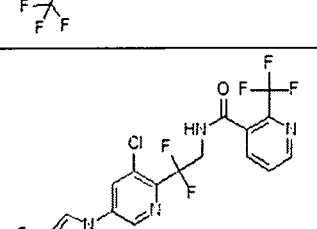
【0115】 式(I)化合物

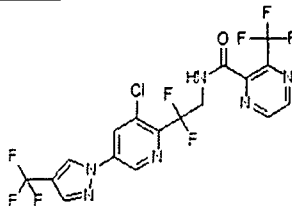
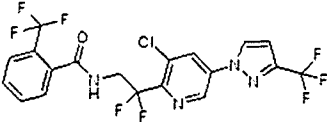
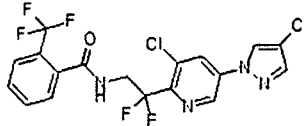
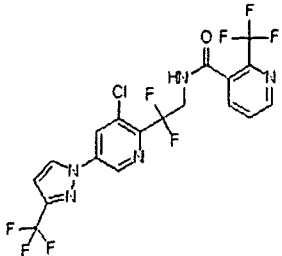
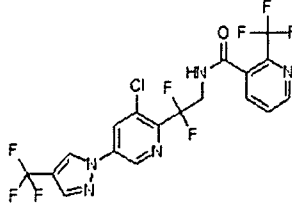
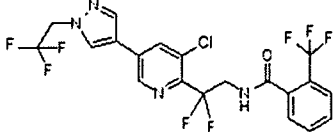
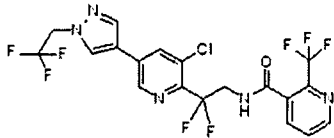
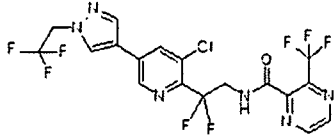
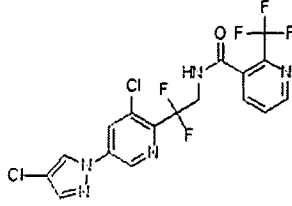


Q、X、n、A、R¹如由每個個別結構所定義。

【0116】

實施例 編號	式	logP ^{a)} (HCOOH)	M+1 (LC/MS)	¹ H-NMR
1		3,21	430,1	NMR 波峰列表
2		3,53	444,1	NMR 波峰列表

實施例 編號	式	logP ^{a)} (HCOOH)	M+1 (LC/MS)	¹ H-NMR
3		3,62	499,0	400 MHz , D ₆ -DMSO : 9.45 (s, 1H) , 9.21 (s, 1H) , 9.01 (t, 1H, NH) , 8.69 (d, 1H) , 8.34 (s, 1H) , 7.78-7.63 (m, 3H) , 7.47 (d, 1H) , 4.34-4.25 (m, 2H) 。
4		3,22	444,0	NMR 波峰列表
5		3,12	449,1	NMR 波峰列表
6		3,32	530,0	NMR 波峰列表
7		2,88	451.0	NMR 波峰列表
8		3,49	501.0	NMR 波峰列表
9		2,7	450.0	NMR 波峰列表

實施例 編號	式	logP ^{a)} (HCOOH)	M+1 (LC/MS)	¹ H-NMR
10		3,43	501.0	NMR 波峰列表
11		3,63	499.0	NMR 波峰列表
12		3,5	465.0	NMR 波峰列表
13		3,27	500.0	NMR 波峰列表
14		3,24	500.1	NMR 波峰列表
15		3,1	513.1	NMR 波峰列表
16		2,66	513.9	NMR 波峰列表
17		2,85	515.0	NMR 波峰列表
18		3,07	465.9	NMR 波峰列表

LC-MS

【0117】 LogP之測量值係根據EEC Directive 79/831 Annex V.A8，藉

由HPLC (高效液相層析法)在逆相管柱(C 18)上使用下列方法進行：

^[a] LogP值係藉由LC-MS之測量，在酸性範圍，使用0.1%甲酸之水溶液和乙腈作為溶離劑(10%乙腈至95%乙腈之線性梯度)測定。

^[b] LogP值係藉由LC-MS之測量，在中性範圍，使用在水中之0,001莫耳濃度的碳酸氫銨溶液和乙腈作為溶離劑(10%乙腈至95%乙腈之線性梯度)測定。

【0118】 校準係以具有已知LogP值(使用滯留時間以連續烷酮之間的線性內插法之LogP測量)之直鏈烷-2-酮(帶有3至16個碳原子)來進行。 λ -最大值係使用200 nm至400nm之UV-光譜及層析訊號之波峰值所測定。

【0119】 在表1中，M+1(或M+H)分別係指分子離子波峰，加或減1 a.m.u. (原子質量單位)，如藉由電灑游離的質譜中所觀察者(ESI +或-)。

¹H-NMR數據

【0120】 ¹H-NMR-數據係用配備流通槽(60 μ l體積)之Bruker Avance 400或用配備5 mm cryo-CPTCI探頭之Bruker AVIII 400或用配備cyroTCI探頭之Bruker AVII 600 (600.13MHz)或用配備5 mm cryo CPMNP探頭之Bruker AVIII 600(601.6MHz)以四甲基矽烷作為參考(0.0)及溶劑CD₃CN、CDCl₃、或D₆-DMSO來測定。

NMR波峰列表

【0121】 選定實例之¹H-NMR數據係以¹H-NMR-波峰列表之形式書寫。各個信號峰之以ppm計的 δ -值和信號強度係列在圓括號中。 δ 值-信號強度對之間係以分號作為分隔。

【0122】 實例之波峰列表因此具有下列形式：

δ_1 (強度₁) ; δ_2 (強度₂) ; ; δ_i (強度_i) ; ; δ_n (強度_n)

【0123】 尖銳信號之強度與NMR光譜列印例中以cm計之信號高度相

關且顯示信號強度之真實關係。從寬信號，可顯示數個波峰或信號中間及其相較於光譜中最強的信號之相對強度。

【0124】 四甲基矽烷及/或所使用之溶劑的化學位移，尤其在DMSO(二甲亞砜)中所測量之光譜的情況下，已被用於校準。因此，四甲基矽烷波峰會但非必然出現於NMR波峰列表中。

【0125】 ^1H -NMR波峰列表類似於典型 ^1H -NMR印出資料，且因此通常含有在典型NMR解讀中所列示之所有波峰。

【0126】 另外，彼等可顯示像溶劑、目標化合物(其亦為本發明的標的)之立體異構物及/或雜質的波峰之典型 ^1H -NMR印出資料信號。

【0127】 溶劑的一般波峰，例如在DMSO- D_6 中之DMSO波峰及水波峰，係給於 ^1H -NMR波峰列表中以顯示溶劑及/或水之 δ 範圍中的化合物信號。彼等通常平均具有高強度。

【0128】 目標化合物之立體異構物的波峰及/或雜質的波峰通常平均具有比目標化合物(例如，具有純度>90%)的波峰更低的強度。

【0129】 該等立體異構物及/或雜質可為特定製備方法之典型。因此，彼等之波峰可經由“副產物圖譜”而助於辨識吾等之製備方法的再現性。

【0130】 若必要時，用已知的方法(MestreC、ACD模擬，但是亦具有經驗評估之預期值)計算目標化合物的波峰之專家如需要可視需要地使用附加的強度濾波器分離目標化合物的波峰。此分離將會類似於典型 ^1H -NMR解讀中相關的波峰擷取。

【0131】 以波峰列表之NMR-數據說明的進一步詳情可發現於出版物“Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications”(參見Research Disclosure Database Number 564025，2011年3月或[http : //www.rdelectronic.co.uk/rd/free/rd564025.pdf](http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/rd564025.pdf))。

【0132】 具有NMR波峰之表

實施例 1：¹H-NMR(400.0 MHz，d6-DMSO)： δ= 8.985(3.3)；8.971(6.8)；8.955(3.6)；8.942(14.3)；8.938(14.6)；8.523(15.6)；8.492(0.3)；8.412(14.2)；8.408(13.9)；8.317(0.8)；7.936(0.3)；7.857(9.5)；7.853(16.0)；7.849(9.9)；7.799(0.4)；7.781(7.3)；7.761(10.0)；7.747(3.3)；7.729(8.2)；7.710(5.7)；7.668(5.8)；7.649(7.3)；7.630(2.8)；7.472(8.6)；7.453(7.6)；7.215(13.2)；7.212(13.1)；4.326(3.3)；4.310(3.3)；4.289(7.5)；4.273(7.3)；4.251(3.9)；4.235(3.5)；3.345(159.1)；3.219(0.4)；3.205(0.3)；2.996(0.5)；2.711(0.5)；2.676(1.8)；2.672(2.3)；2.667(1.7)；2.542(130.3)；2.507(297.5)；2.503(386.0)；2.498(282.1)；2.434(0.7)；2.427(0.6)；2.406(0.3)；2.376(0.3)；2.368(0.7)；2.334(1.8)；2.329(2.3)；2.325(1.8)；2.292(0.5)；2.048(0.4)；1.259(0.5)；1.235(2.1)；0.146(0.5)；0.008(3.8)；0.000(101.9)；-0.008(3.8)；-0.021(0.4)；-0.150(0.6)
實施例 2：¹H-NMR(400.0 MHz，d6-DMSO)： δ= 8.994(3.3)；8.979(7.2)；8.963(3.3)；8.757(14.2)；8.753(14.1)；8.439(0.4)；8.317(1.0)；8.177(14.4)；8.172(14.0)；7.872(0.4)；7.855(0.5)；7.782(7.1)；7.762(9.7)；7.750(3.4)；7.731(7.9)；7.713(5.8)；7.684(15.7)；7.680(16.0)；7.669(6.1)；7.650(7.2)；7.631(2.8)；7.569(0.3)；7.553(0.7)；7.533(0.5)；7.520(0.4)；7.504(0.5)；7.483(8.2)；7.464(7.2)；6.953(14.6)；6.948(14.3)；4.340(3.1)；4.325(3.4)；4.303(7.3)；4.288(7.0)；4.266(3.7)；4.251(3.4)；3.338(161.3)；3.229(0.5)；3.170(0.5)；2.712(0.4)；2.676(1.7)；2.671(2.5)；2.542(112.1)；2.507(320.9)；2.503(392.5)；2.498(281.0)；2.494(136.2)；2.447(0.8)；2.418(0.5)；2.395(0.4)；2.367(0.7)；2.346(0.6)；2.334(1.7)；2.329(2.3)；2.325(1.8)；2.291(0.5)；2.271(0.4)；2.186(0.4)；1.740(0.4)；1.685(0.3)；1.258(0.5)；1.235(1.9)；0.146(0.4)；0.008(4.2)；0.000(95.8)；-0.008(3.4)；-0.150(0.5)
實施例 3：¹H-NMR(400.0 MHz，d6-DMSO)： δ= 9.522(0.5)；9.471(0.6)；9.453(0.8)；9.439(11.7)；9.328(0.4)；9.214(11.7)；9.208(11.7)；9.156(0.5)；9.094(0.4)；9.028(2.6)；9.012(5.4)；8.997(2.6)；8.970(0.3)；8.953(0.4)；8.847(0.6)；8.785(0.3)；8.715(0.6)；8.710(0.7)；8.689(11.1)；8.684(10.9)；8.429(0.8)；8.399(16.0)；8.316(2.0)；8.173(0.3)；8.109(0.3)；7.992(0.7)；7.960(0.4)；7.938(0.5)；7.879(0.8)；7.856(0.4)；7.841(0.4)；7.817(0.5)；7.801(0.5)；7.780(5.4)；7.759(7.6)；7.732(6.2)；7.714(4.4)；7.670(4.4)；7.650(5.5)；7.631(2.1)；7.523(0.4)；7.517(0.4)；7.500(0.5)；7.473(6.4)；7.454(5.6)；5.757(1.3)；4.338(2.5)；4.322(2.7)；4.301(5.7)；4.286(5.4)；4.264(3.0)；4.249(2.7)；4.033(0.4)；4.009(0.3)；3.551(0.4)；3.483(0.5)；3.463(0.7)；3.447(0.6)；3.438(0.5)；3.424(1.0)；3.406(1.1)；3.390(2.1)；3.339(1821.8)；3.306(2.8)；3.300(2.3)；3.283(0.7)；3.275(0.8)；3.264(1.0)；3.250(1.0)；3.169(0.3)；2.891(0.9)；2.731(0.8)；

2.677(2.5) ; 2.672(3.5) ; 2.668(2.5) ; 2.592(0.3) ; 2.525(9.1) ; 2.512(212.0) ; 2.507(427.4) ; 2.503(558.1) ; 2.498(396.7) ; 2.494(186.4) ; 2.469(1.1) ; 2.429(0.4) ; 2.334(2.6) ; 2.330(3.4) ; 2.325(2.5) ; 1.386(1.9) ; 1.235(0.6) ; 1.175(0.7) ; 1.166(1.2) ; 1.150(0.6) ; 0.146(2.0) ; 0.021(0.7) ; 0.018(1.0) ; 0.008(20.0) ; 0.000(511.9) ; -0.009(17.4) ; -0.025(0.5) ; -0.034(0.4) ; -0.040(0.4) ; -0.150(2.0)

實施例 4 : ^1H -NMR (400.0 MHz , d₆-DMSO) :

δ = 8.956 (0.8) ; 8.940 (1.6) ; 8.925 (0.8) ; 8.786 (3.2) ; 8.781 (3.3) ; 8.160 (3.3) ; 8.156 (3.3) ; 7.781 (1.6) ; 7.762 (2.3) ; 7.746 (0.7) ; 7.728 (1.9) ; 7.709 (1.3) ; 7.666 (1.3) ; 7.647 (1.7) ; 7.628 (0.7) ; 7.538 (1.8) ; 7.533 (3.1) ; 7.529 (1.9) ; 7.479 (1.9) ; 7.460 (1.7) ; 6.845 (1.7) ; 6.839 (2.9) ; 6.833 (1.9) ; 6.650 (2.0) ; 6.646 (2.5) ; 6.644 (2.5) ; 6.639 (1.9) ; 4.312 (0.7) ; 4.296 (0.7) ; 4.275 (1.7) ; 4.259 (1.6) ; 4.237 (0.9) ; 4.222 (0.8) ; 3.934 (0.5) ; 3.665 (16.0) ; 3.331 (14.5) ; 2.525 (0.4) ; 2.507 (18.5) ; 2.502 (24.0) ; 2.498 (17.8) ; 1.989 (0.4) ; 1.071 (4.2) ; 0.008 (0.7) ; 0.000 (19.0) ; -0.008 (0.8)

實施例 5 : ^1H -NMR (400.0 MHz , d₆-DMSO) :

δ = 9.127 (15.3) ; 9.121 (16.0) ; 9.017 (3.7) ; 9.001 (7.8) ; 8.986 (3.8) ; 8.484 (14.4) ; 8.479 (14.6) ; 8.316 (0.7) ; 7.774 (7.5) ; 7.754 (12.4) ; 7.732 (8.7) ; 7.714 (6.0) ; 7.665 (6.1) ; 7.646 (7.8) ; 7.627 (2.9) ; 7.460 (9.0) ; 7.441 (8.0) ; 4.323 (3.3) ; 4.308 (3.5) ; 4.287 (7.6) ; 4.271 (7.4) ; 4.251 (3.9) ; 4.235 (3.6) ; 3.419 (0.4) ; 3.377 (56.4) ; 3.329 (346.1) ; 2.676 (1.3) ; 2.671 (1.8) ; 2.667 (1.4) ; 2.524 (4.6) ; 2.511 (100.7) ; 2.507 (201.5) ; 2.502 (267.0) ; 2.498 (201.7) ; 2.333 (1.3) ; 2.329 (1.8) ; 2.325 (1.3) ; 2.075 (1.9) ; 1.989 (1.0) ; 1.234 (0.6) ; 1.175 (0.6) ; 0.146 (1.9) ; 0.008 (16.2) ; 0.000 (410.0) ; -0.009 (21.5) ; -0.150 (1.9)

實施例 6 : ^1H -NMR (400.0 MHz , d₆-DMSO) :

δ = 9.120 (15.4) ; 9.114 (16.0) ; 9.005 (3.6) ; 8.990 (7.5) ; 8.974 (3.6) ; 8.947 (12.4) ; 8.936 (12.5) ; 8.532 (14.9) ; 8.526 (15.1) ; 8.317 (0.7) ; 8.058 (11.9) ; 8.047 (12.4) ; 7.778 (7.2) ; 7.758 (10.1) ; 7.750 (3.9) ; 7.731 (8.2) ; 7.712 (5.8) ; 7.667 (5.8) ; 7.648 (7.4) ; 7.629 (2.7) ; 7.469 (8.7) ; 7.450 (7.6) ; 5.757 (3.1) ; 4.324 (3.3) ; 4.309 (3.4) ; 4.288 (7.6) ; 4.272 (7.3) ; 4.251 (3.8) ; 4.236 (3.6) ; 3.330 (319.5) ; 2.676 (1.5) ; 2.672 (2.0) ; 2.667 (1.5) ; 2.663 (0.8) ; 2.525 (5.0) ; 2.511 (110.7) ; 2.507 (225.7) ; 2.503 (299.6) ; 2.498 (223.2) ; 2.494 (113.2) ; 2.334 (1.4) ; 2.329 (2.0) ; 2.325 (1.5) ; 1.233 (0.5) ; 0.146 (0.8) ; 0.008 (5.9) ; 0.000 (177.3) ; -0.008 (7.9) ; -0.150 (0.8)

實施例 7 : ^1H -NMR(400.0 MHz , d₆-DMSO) :

δ = 9.255(4.0) ; 9.240(7.9) ; 9.224(4.1) ; 9.111(15.6) ; 9.105(16.0) ; 9.023(12.6) ; 9.018(15.2) ; 8.970(15.8) ; 8.964(13.8) ; 8.953(12.8) ; 8.942(12.2) ; 8.875(0.4) ; 8.871(0.4) ; 8.797(0.7) ; 8.793(0.7) ; 8.590(0.7) ; 8.585(0.7) ; 8.555(15.6) ; 8.550(15.5) ; 8.317(0.6) ; 8.296(0.4) ; 8.066(12.0) ; 8.056(12.2) ; 7.716(0.5) ; 7.695(0.5) ; 4.415(3.6) ; 4.399(3.7) ; 4.378(8.3) ; 4.362(8.0) ; 4.340(4.3) ;

4.324(4.0) ; 4.220(0.4) ; 4.204(0.4) ; 3.330(152.0) ; 2.677(1.3) ; 2.672(1.7) ; 2.668(1.3) ; 2.512(94.5) ; 2.508(184.8) ; 2.503(241.4) ; 2.499(181.6) ; 2.334(1.1) ; 2.330(1.6) ; 2.326(1.2) ; 1.990(0.6) ; 1.259(0.4) ; 1.233(0.5) ; 1.175(0.4) ; 0.008(0.8) ; 0.000(17.9)
實施例 8 : ¹ H-NMR(400.0 MHz , d ₆ -DMSO) : δ= 9.277(2.6) ; 9.262(5.4) ; 9.246(2.6) ; 9.192(10.3) ; 9.187(10.6) ; 9.028(8.2) ; 9.022(10.2) ; 8.981(7.4) ; 8.974(16.0) ; 8.968(9.4) ; 8.703(10.4) ; 8.697(10.4) ; 8.318(0.4) ; 7.212(8.9) ; 7.206(9.0) ; 4.430(2.4) ; 4.414(2.4) ; 4.393(5.5) ; 4.377(5.2) ; 4.355(2.9) ; 4.339(2.6) ; 4.038(0.8) ; 4.021(0.8) ; 3.331(103.2) ; 2.677(0.8) ; 2.673(1.1) ; 2.668(0.9) ; 2.564(0.5) ; 2.526(3.2) ; 2.512(59.8) ; 2.508(119.5) ; 2.504(156.9) ; 2.499(115.6) ; 2.335(0.7) ; 2.330(0.9) ; 2.326(0.7) ; 1.990(3.4) ; 1.259(0.3) ; 1.234(0.5) ; 1.194(0.9) ; 1.176(1.8) ; 1.158(0.9) ; 0.008(0.4) ; 0.000(12.0) ; -0.008(0.4)
實施例 9 : ¹ H-NMR(400.0 MHz , d ₆ -DMSO) : δ= 9.173(3.5) ; 9.157(7.7) ; 9.142(4.0) ; 9.123(15.6) ; 9.117(16.0) ; 8.949(12.1) ; 8.938(12.2) ; 8.804(9.7) ; 8.795(8.3) ; 8.793(8.5) ; 8.580(1.4) ; 8.575(1.4) ; 8.544(15.0) ; 8.539(15.0) ; 8.318(0.4) ; 8.062(11.7) ; 8.052(12.1) ; 7.936(6.7) ; 7.919(8.9) ; 7.917(8.8) ; 7.904(1.0) ; 7.803(7.9) ; 7.791(7.8) ; 7.783(6.4) ; 7.772(6.1) ; 4.360(3.2) ; 4.345(3.3) ; 4.324(7.6) ; 4.308(7.4) ; 4.287(4.0) ; 4.271(3.8) ; 4.242(0.5) ; 4.227(0.4) ; 3.333(231.3) ; 2.677(0.8) ; 2.673(1.2) ; 2.668(0.9) ; 2.526(3.0) ; 2.521(4.6) ; 2.512(62.1) ; 2.508(128.2) ; 2.504(170.7) ; 2.499(126.7) ; 2.495(63.9) ; 2.335(0.8) ; 2.330(1.2) ; 2.326(0.9) ; 1.990(1.0) ; 1.233(0.5) ; 1.176(0.6) ; 0.146(0.3) ; 0.008(2.7) ; 0.000(84.0) ; -0.008(3.4) ; -0.150(0.4)
實施例 10 : ¹ H-NMR(400.0 MHz , d ₆ -DMSO) : δ= 9.444(12.7) ; 9.287(2.7) ; 9.272(5.9) ; 9.256(3.0) ; 9.203(11.4) ; 9.197(11.7) ; 9.023(9.0) ; 9.017(11.1) ; 8.971(11.2) ; 8.965(9.4) ; 8.712(11.5) ; 8.707(11.4) ; 8.405(16.0) ; 8.313(1.8) ; 8.141(11.1) ; 4.428(2.7) ; 4.412(2.7) ; 4.390(6.1) ; 4.374(5.9) ; 4.352(3.2) ; 4.336(2.9) ; 3.738(0.4) ; 3.355(2895.7) ; 2.677(4.5) ; 2.673(5.8) ; 2.669(4.4) ; 2.508(673.1) ; 2.504(853.5) ; 2.500(627.8) ; 2.335(4.2) ; 2.331(5.6) ; 2.326(4.2) ; 2.288(0.6) ; 2.074(1.1) ; 1.910(4.6) ; 0.000(55.4)
實施例 11 : ¹ H-NMR(400.0 MHz , d ₆ -DMSO) : δ= 9.200(15.5) ; 9.194(16.0) ; 9.024(3.7) ; 9.008(7.9) ; 8.993(3.9) ; 8.974(10.7) ; 8.969(10.9) ; 8.681(15.3) ; 8.676(15.1) ; 8.317(0.6) ; 7.780(7.6) ; 7.760(10.8) ; 7.734(8.6) ; 7.716(6.0) ; 7.669(6.1) ; 7.650(7.8) ; 7.631(2.9) ; 7.476(9.1) ; 7.457(8.0) ; 7.205(13.2) ; 7.199(13.2) ; 4.340(3.4) ; 4.325(3.5) ; 4.304(7.7) ; 4.288(7.4) ; 4.267(3.9) ; 4.252(3.6) ; 3.336(388.4) ; 2.677(1.4) ; 2.672(1.9) ; 2.668(1.4) ; 2.525(4.9) ; 2.508(218.6) ; 2.503(286.6) ; 2.499(213.2) ; 2.334(1.4) ; 2.330(1.9) ; 2.325(1.4) ; 2.076(6.5) ; 1.909(0.5) ; 0.008(0.6) ; 0.000(19.2) ;

-0.008(0.8)
實施例 12： $^1\text{H-NMR}$(400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$)： δ= 9.141(8.6) ; 9.136(8.9) ; 9.037(16.0) ; 9.011(2.2) ; 8.996(4.5) ; 8.981(2.2) ; 8.566(8.5) ; 8.561(8.6) ; 8.317(0.4) ; 8.071(14.7) ; 7.778(4.4) ; 7.759(6.1) ; 7.750(2.3) ; 7.731(5.0) ; 7.712(3.5) ; 7.667(3.6) ; 7.648(4.5) ; 7.629(1.6) ; 7.469(5.2) ; 7.451(4.6) ; 4.327(2.0) ; 4.311(2.1) ; 4.290(4.5) ; 4.275(4.3) ; 4.253(2.3) ; 4.238(2.1) ; 3.338(195.8) ; 2.676(1.0) ; 2.672(1.4) ; 2.668(1.1) ; 2.507(158.5) ; 2.503(205.0) ; 2.499(155.4) ; 2.334(1.0) ; 2.330(1.4) ; 2.325(1.0) ; 2.076(0.9) ; 0.000(11.5)
實施例 13： $^1\text{H-NMR}$(400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$)： δ= 9.466(0.5) ; 9.461(0.5) ; 9.202(15.2) ; 9.197(16.0) ; 9.189(4.2) ; 9.173(7.7) ; 9.158(3.6) ; 9.089(0.4) ; 9.021(0.5) ; 8.976(10.2) ; 8.972(10.4) ; 8.805(8.0) ; 8.793(8.1) ; 8.709(0.8) ; 8.692(14.8) ; 8.687(14.5) ; 8.407(0.4) ; 8.317(1.4) ; 7.980(0.4) ; 7.957(0.5) ; 7.940(6.8) ; 7.921(8.8) ; 7.804(7.3) ; 7.792(7.2) ; 7.784(6.0) ; 7.773(5.6) ; 7.228(0.7) ; 7.220(0.8) ; 7.210(12.9) ; 7.203(12.8) ; 7.093(0.5) ; 7.087(0.5) ; 4.374(3.3) ; 4.358(3.5) ; 4.337(7.6) ; 4.321(7.3) ; 4.300(4.1) ; 4.284(3.5) ; 3.568(0.6) ; 3.392(0.6) ; 3.332(1125.8) ; 3.276(0.6) ; 2.891(0.7) ; 2.731(0.7) ; 2.676(3.5) ; 2.671(4.8) ; 2.667(3.7) ; 2.565(0.6) ; 2.560(0.6) ; 2.524(12.4) ; 2.507(555.7) ; 2.502(731.0) ; 2.498(546.9) ; 2.333(3.5) ; 2.329(4.8) ; 2.325(3.7) ; 2.075(3.9) ; 1.235(0.3) ; 0.008(1.3) ; 0.000(42.7) ; -0.008(1.9)
實施例 14： $^1\text{H-NMR}$(400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$)： δ= 9.466(3.3) ; 9.460(2.7) ; 9.443(12.6) ; 9.216(11.5) ; 9.211(11.9) ; 9.195(2.9) ; 9.181(5.7) ; 9.165(2.7) ; 9.131(0.7) ; 9.116(1.4) ; 9.100(0.7) ; 9.070(1.1) ; 8.857(2.8) ; 8.804(7.6) ; 8.795(7.0) ; 8.728(2.6) ; 8.722(2.6) ; 8.702(11.2) ; 8.697(11.2) ; 8.614(0.9) ; 8.609(0.8) ; 8.576(0.4) ; 8.433(3.7) ; 8.404(16.0) ; 8.317(5.7) ; 8.265(1.1) ; 7.985(1.3) ; 7.967(1.6) ; 7.951(0.7) ; 7.937(5.2) ; 7.919(6.7) ; 7.803(5.9) ; 7.791(5.9) ; 7.784(5.4) ; 7.771(4.5) ; 4.372(2.9) ; 4.356(3.1) ; 4.335(6.2) ; 4.319(6.3) ; 4.298(3.4) ; 4.283(3.0) ; 4.259(0.5) ; 4.249(0.5) ; 4.224(0.3) ; 3.428(0.3) ; 3.376(0.7) ; 3.329(824.8) ; 3.275(0.3) ; 2.676(5.5) ; 2.671(7.6) ; 2.667(5.7) ; 2.638(0.4) ; 2.619(0.3) ; 2.524(18.7) ; 2.507(858.7) ; 2.502(1129.1) ; 2.498(837.7) ; 2.333(5.3) ; 2.329(7.4) ; 2.324(5.5) ; 2.075(5.7) ; 1.990(0.4) ; 1.233(0.4) ; 0.146(0.4) ; 0.008(2.0) ; 0.000(66.1) ; -0.150(0.3)
實施例 15： $^1\text{H-NMR}$(400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$)： δ= 8.965(0.7) ; 8.950(0.4) ; 8.939(1.3) ; 8.934(1.3) ; 8.613(1.9) ; 8.430(1.3) ; 8.425(1.3) ; 8.322(2.1) ; 7.780(0.6) ; 7.761(0.9) ; 7.729(0.7) ; 7.710(0.5) ; 7.668(0.5) ; 7.649(0.6) ; 7.476(0.7) ; 7.457(0.6) ; 5.237(1.0) ; 5.215(1.1) ; 5.192(0.4) ; 4.287(0.6) ; 4.271(0.6) ; 3.934(3.0) ; 3.329(14.2) ; 2.525(0.5) ; 2.507(20.4) ; 2.503(26.0) ; 2.498(19.1) ; 1.909(0.7) ; 1.069(16.0) ; 0.008(0.5) ;

0.000(12.8) ; -0.009(0.6)
實施例 16 : ¹ H-NMR(400.0 MHz , d ₆ -DMSO) : δ= 9.151(2.3) ; 9.136(5.0) ; 9.120(2.4) ; 8.941(9.3) ; 8.936(9.8) ; 8.804(4.9) ; 8.794(4.7) ; 8.792(4.9) ; 8.615(14.3) ; 8.441(9.7) ; 8.437(9.8) ; 8.324(16.0) ; 7.939(4.2) ; 7.922(5.2) ; 7.920(5.3) ; 7.889(0.6) ; 7.800(4.6) ; 7.788(4.5) ; 7.780(3.8) ; 7.768(3.6) ; 5.263(2.4) ; 5.241(7.7) ; 5.218(8.2) ; 5.195(2.8) ; 4.357(2.0) ; 4.341(2.0) ; 4.319(4.6) ; 4.304(4.4) ; 4.282(2.3) ; 4.266(2.1) ; 4.056(0.9) ; 4.038(2.7) ; 4.020(2.8) ; 4.002(0.9) ; 3.330(204.4) ; 2.891(0.6) ; 2.732(0.5) ; 2.676(0.9) ; 2.672(1.2) ; 2.668(0.9) ; 2.525(3.2) ; 2.521(4.8) ; 2.512(64.8) ; 2.507(134.7) ; 2.503(180.9) ; 2.498(136.4) ; 2.494(70.2) ; 2.334(0.9) ; 2.330(1.2) ; 2.325(0.9) ; 1.989(12.0) ; 1.910(0.4) ; 1.259(0.6) ; 1.235(0.4) ; 1.193(3.3) ; 1.175(6.5) ; 1.158(3.2) ; 0.146(0.4) ; 0.008(3.0) ; 0.000(97.0) ; -0.009(4.4) ; -0.150(0.4)
實施例 17 : ¹ H-NMR(400.0 MHz , d ₆ -DMSO) : δ= 9.220(2.5) ; 9.204(5.2) ; 9.189(2.5) ; 9.022(7.6) ; 9.016(9.3) ; 8.968(9.4) ; 8.963(8.0) ; 8.936(9.3) ; 8.932(9.7) ; 8.622(14.4) ; 8.456(9.9) ; 8.452(9.9) ; 8.329(16.0) ; 8.317(0.8) ; 5.757(3.7) ; 5.265(2.5) ; 5.243(8.0) ; 5.220(8.4) ; 5.197(2.9) ; 4.410(2.2) ; 4.394(2.2) ; 4.373(4.9) ; 4.357(4.8) ; 4.335(2.5) ; 4.319(2.4) ; 4.056(1.2) ; 4.038(3.7) ; 4.020(3.7) ; 4.002(1.3) ; 3.934(0.7) ; 3.569(2.0) ; 3.328(100.7) ; 2.676(1.0) ; 2.672(1.4) ; 2.667(1.1) ; 2.507(161.6) ; 2.503(212.6) ; 2.498(164.1) ; 2.334(1.0) ; 2.329(1.4) ; 2.325(1.1) ; 1.989(15.4) ; 1.812(0.5) ; 1.397(0.5) ; 1.298(0.4) ; 1.259(1.8) ; 1.250(0.7) ; 1.235(2.7) ; 1.193(4.2) ; 1.175(8.2) ; 1.158(4.6) ; 1.117(0.6) ; 1.069(4.3) ; 0.854(0.4) ; 0.146(0.4) ; 0.008(3.3) ; 0.000(89.0) ; -0.150(0.4)
實施例 18 : ¹ H-NMR(400.0 MHz , d ₆ -DMSO) : 1 δ= 9.166(2.2) ; 9.151(4.8) ; 9.142(9.9) ; 9.137(11.0) ; 9.037(16.0) ; 8.803(4.7) ; 8.791(4.8) ; 8.575(8.7) ; 8.570(8.7) ; 8.314(0.4) ; 8.071(14.7) ; 7.934(4.1) ; 7.915(5.2) ; 7.800(4.2) ; 7.788(4.2) ; 7.780(3.5) ; 7.768(3.3) ; 4.361(2.0) ; 4.346(2.1) ; 4.324(4.6) ; 4.309(4.4) ; 4.287(2.3) ; 4.272(2.2) ; 3.318(72.2) ; 2.675(0.8) ; 2.671(1.1) ; 2.667(0.9) ; 2.541(1.8) ; 2.524(3.0) ; 2.507(129.3) ; 2.502(169.4) ; 2.498(126.8) ; 2.333(0.8) ; 2.329(1.1) ; 2.325(0.8) ; 0.146(0.8) ; 0.008(6.4) ; 0.000(166.7) ; -0.008(8.1) ; -0.150(0.8)

調配例

【0133】 根據本發明之調配物的實施例如下：

- 8 mg 實施例3之化合物
- 0.2 mL 二乙二醇單乙基醚

0.2 mL Polyoxyl 35 蓖麻油

1.6 mL 生理氯化鈉溶液

【0134】 製備該種調配物之實施例如下。將本發明之化合物溶於1份二乙二醇單乙基醚中並與1份Polyoxyl 35蓖麻油和8份生理氯化鈉溶液混合。

【0135】 該種調配物適於口服或胃腸外施用。

【0136】 本發明之其他化合物的調配物可以類似方式製備且顯示類似或相同的組成。

生物例

實施例A：試管內效力試驗

*庫氏古柏線蟲(Cooperia curticei)*之試管內分析

【0137】 為製造活性化合物的適當製劑，將10mg活性化合物溶於0.5ml二甲亞砜，並以“林格氏液”將濃縮液稀釋至所要濃度。

【0138】 將大約40隻線蟲幼蟲(庫氏古柏線蟲)移至含有化合物溶液的試管中。5天之後記錄幼蟲死亡率之百分比。100%效力意指所有幼蟲被殺死，0%效力意指無幼蟲被殺死。

【0139】 在此試驗中，例如，下列來自製備例之化合物在20 ppm的施用率下顯示100%之良好活性：1、2、3、5、6、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18。

【0140】 在此試驗中，例如，下列來自製備例之化合物在4 ppm的施用率下顯示90%之良好活性：1、2、3、4、5、6、8、9、10、11、12、13、14、15、18。

實施例B：試管內效力試驗

*捻轉血矛線蟲(Haemonchus contortus)*之試管內分析

【0141】 為製造活性化合物的適當製劑，將10mg活性化合物溶於0.5ml二甲亞砜，並以“林格氏液”將濃縮液稀釋至所要濃度。

【0142】 將大約40隻赤色胃蟲幼蟲(捻轉血矛線蟲)移至含有化合物溶液的試管中。5天之後記錄幼蟲死亡率之百分比。100%效力意指所有幼蟲被殺死，0%效力意指無幼蟲被殺死。

【0143】 在此試驗中，例如，下列來自製備例之化合物在20 ppm的施用率下顯示100%之良好活性：3、6、10、11、12、14、18。

【0144】 在此試驗中，例如，下列來自製備例之化合物在20 ppm的施用率下顯示90%之良好活性：2和5。

實施例C：試管內效力試驗

巴西日圓線蟲(*Nippostrongylus brasiliensis*)之試管內分析

【0145】 巴西日圓線蟲成蟲以含有100U/ml青黴素、0.1mg/ml鏈黴素與2.5μg/ml兩性黴素B的生理鹽水緩衝液沖洗。將測試化合物溶於DMSO，並使蟲體在最終濃度10μg/ml之培養基中培育。取一等份培養基用來測定相較於負對照組的乙醯膽鹼酯酶活性。測量乙醯膽鹼酯酶作為驅蠕蟲活性讀數的原理係說明於Rapson等人(1986)與Rapson等人(1987)。

【0146】 就下列實施例而言，於10μg/ml之活性(相較於負對照組，AChE的減少)為75%或更高：1、3、6、8、11、12。

實施例D：體內效力試驗

捻轉血矛線蟲(*Haemonchus contortus*)/蛇形毛樣細蟲(*Trichostrongylus colubriformis*)/沙鼠

【0147】 以實驗方式感染血矛線蟲及/或毛樣線蟲的沙鼠係於晚期前開放性(late prepatency)期間單次處理。將試驗化合物調配成溶液或懸浮液並以腹腔內或口服施予。

【0148】 效力係以相較於被感染並以安慰劑處理的對照組的蟲數，每組在解剖後分別於胃與小腸內的蟲數的減少來測定。

【0149】 試驗下列實施例且在給予治療時具有85%或更高之活性：

處理	血矛線蟲	毛樣線蟲
20 mg/kg 腹膜內	3、12	3、12
20 mg/kg 皮下	6	6
10 mg/kg 皮下	3	3
5 mg/kg 皮下	12	12

【符號說明】

無

【生物材料寄存】

國內寄存資訊【請依寄存機構、日期、號碼順序註記】

無

國外寄存資訊【請依寄存國家、機構、日期、號碼順序註記】

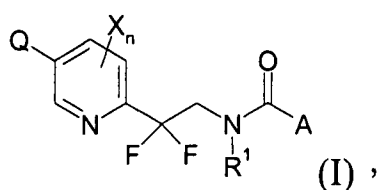
無

【序列表】(請換頁單獨記載)

無

申請專利範圍

1. 一種式(I)化合物，



其中

R^1 係選自由下列所組成之群組：氫、-CHO、-OH、 C_1 - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基、 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、胺基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷胺基- C_1 - C_4 -烷基、二-(C_1 - C_4 -烷基)胺基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷羰基、 C_1 - C_4 -烷氧羰基、苄氧羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷羰基、-S(O)₂- C_1 - C_4 -烷基，及具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂- C_1 - C_4 -鹵烷基，

n 為 0、1、2 或 3，

各 X 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、羥基、胺基、-SH、-SF₅、-CHO、-OCHO、-NHCHO、-COOH、-CONH₂、-CONH(OH)、-OCONH₂、(羥亞胺基)- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_8 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基、 C_2 - C_8 -烯基、 C_2 - C_8 -炔基、 C_1 - C_8 -烷胺基、二-(C_1 - C_8 -烷基)胺基、 C_1 - C_8 -烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷氧基、 C_2 - C_8 -烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_2 - C_8 -鹵烯氧基、 C_3 - C_8 -炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_3 - C_8 -鹵炔氧基、 C_3 - C_8 -環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_3 - C_8 -鹵環烷基、 C_1 - C_8 -烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷羰基、-CONH(C_1 - C_8 -

烷基)、 $-\text{CON}(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{CONH}(\text{OC}_1\text{-C}_8\text{-烷基})$ 、 $-\text{CON}(\text{OC}_1\text{-C}_8\text{-烷基})(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷基})$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷氧羰基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷氧羰基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷羰氧基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷羰氧基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷羰胺基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷羰胺基}$ 、 $-\text{OCONH}(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷基})$ 、 $-\text{OCON}(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{OCONH}(\text{OC}_1\text{-C}_8\text{-烷基})$ 、 $-\text{OCO}(\text{OC}_1\text{-C}_8\text{-烷基})$ 、 $-\text{S-C}_1\text{-C}_8\text{-烷基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $-\text{S-C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_8\text{-烷基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{-C}_1\text{-C}_8\text{-烷基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $-\text{S}(\text{O})_2\text{-C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷基}$ 、 $(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-烷氧基亞胺基})\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 、 $(\text{C}_2\text{-C}_6\text{-烯氧基亞胺基})\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 、 $(\text{C}_3\text{-C}_6\text{-炔氧基亞胺基})\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 、 $(\text{苄氧基亞胺基})\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 、 苄氧基 、 $-\text{S-苄基}$ 、 苄胺基 、 苯氧基 、 $-\text{S-苯基}$ 和 苯胺基 ，

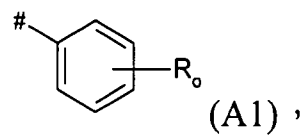
Q 表示含有一至四個選自 N、S 和 O 之雜原子及帶有取代基 Y_m 的芳族 5-員雜環，且

m 為 0、1、2、3 或 4，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、側氧基、鹵素、硝基、氰基、羥基、胺基、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SF}_5$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{OCHO}$ 、 $-\text{NHCHO}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CONH}(\text{OH})$ 、 $-\text{OCONH}_2$ 、 $(\text{羥亞胺基})\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷基}$ 、 $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-烯基}$ 、 $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-炔基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷胺基}$ 、二- $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷基})$ 胺基、 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-烷氧基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-鹵烷氧基}$ 、 $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-烯氧基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-鹵烯氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-炔氧基}$ 、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-鹵炔氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-環烷}$

基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵環烷基、C₁-C₈-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₈-烷基)、-CON(C₁-C₈-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₈-烷基)、-CON(OC₁-C₈-烷基)(C₁-C₈-烷基)、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、C₁-C₈-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₈-烷基)、-OCON(C₁-C₈-烷基)₂、-OCONH(OC₁-C₈-烷基)、-OCO(OC₁-C₈-烷基)、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、-CH₂-S-C₁-C₈-烷基、-CH₂-S(O)-C₁-C₈-烷基、-CH₂-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、(C₁-C₆-烷氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，及

A 表示式(A1)之苯基



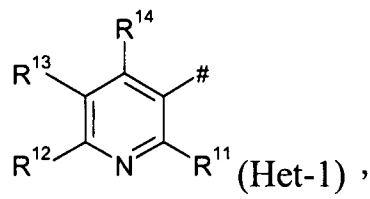
其中

- # 描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，
- o 為 0、1、2、3、4 或 5，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、NH₂、SH、SF₅、CHO、OCHO、NHCHO、COOH、氰基、C₁-C₈-

烷基、具有 1 至 9 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₃-C₆-環烷基、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷氧基-C₂-C₈-烯基、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷基磺醯胺、-NH(C₁-C₈-烷基)、N(C₁-C₈-烷基)₂、苯基(視需要地經 C₁-C₆-烷氧基取代)和苯氧基，或鍵結至相鄰碳原子的二個 R 一起表示-O(CH₂)_pO-，其中 p 表示 1 或 2，或

A 表示式(Het-1)之雜環



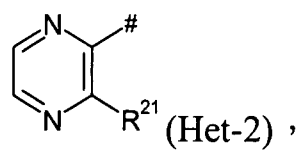
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、-S-C₁-C₅-烷基、S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R^{12} 、 R^{13} 和 R^{14} ，其可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：
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 -
鹵烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、-S- C_1 - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原
子之 C_1 - C_4 -鹵烷氧基、-S(O)- C_1 - C_4 -烷基、-S(O)₂- C_1 - C_4 -烷基，
或

A 表示式(Het-2)之雜環



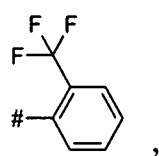
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R^{21} 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、 C_1 - C_4 -烷基和具有 1
至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基，

或其醫藥上可接受的鹽、N-氧化物、金屬錯合物或類金屬錯合物，
其條件為：若

A 為



其中

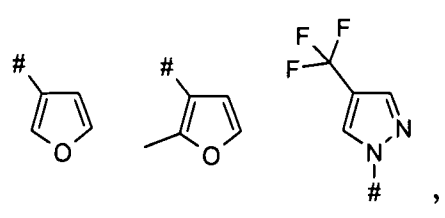
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R^1 為氫，

X 為在其所連接之吡啶環的位置 3 之氯，及

n 為 1，則

Q 為下列中之一者

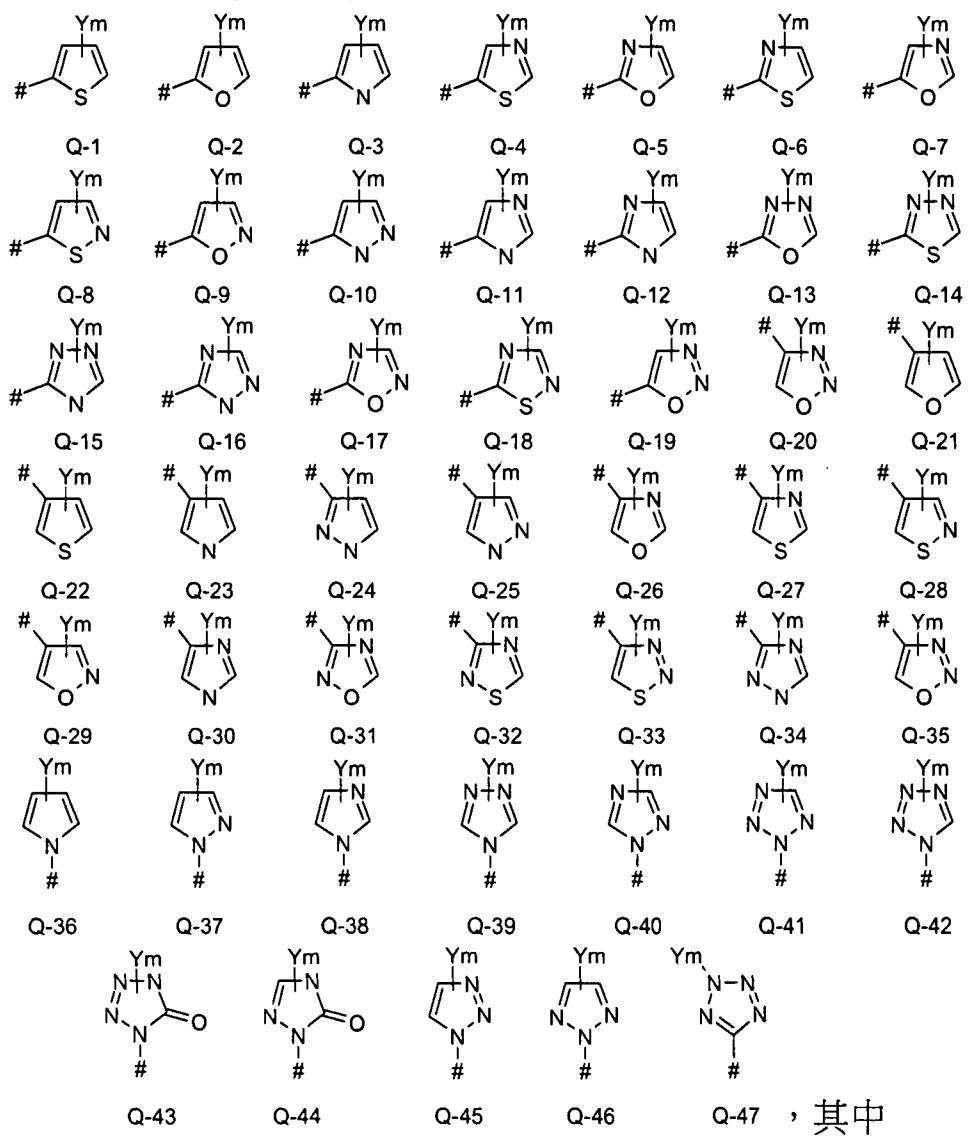


其中

描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

Q 表示選自由 Q-1 至 Q-47 所組成群組之 5-員環：



，其中

描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

且 m 和 Y 具有如前所述之意義。

3. 根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中

n 為 1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基，

Q 表示選自由下列所組成群組之視需要地經單-或多取代之雜芳族環：Q-1、Q-2、Q-3、Q-4、Q-5、Q-6、Q-7、Q-8、Q-9、Q-10、Q-11、Q-12、Q-13、Q-14、Q-15、Q-16、Q-18、Q-21、Q-22、Q-23、Q-24、Q-25、Q-26、Q-27、Q-28、Q-29、Q-30、Q-31、Q-32、Q-33、Q-34、Q-36、Q-37、Q-38、Q-39、Q-40、Q-41 和 Q-44，

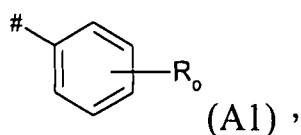
且

m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、-CF₃、-CH₂CF₃、甲基、乙基、氟、氯、溴、碘、氰基、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-OCH(CH₃)₂、-OCH₂CF₃、-CH₂-S(O)₂-CH₃，

R¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷羰基、C₁-C₄-烷氧羰基，及

A 表示式(A1)之苯基



其中

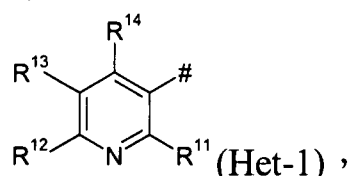
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 0、1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、

氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧羰基、-NH(C₁-C₄-烷基)、苯基(視需要地經 C₁-C₄-烷氧基取代)和苯氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



其中

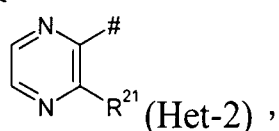
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、-S-C₁-C₅-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：

氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R^{21} 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、 C_1 - C_4 -烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基。

4. 根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中

n 為 1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷氧基，

Q 表示選自由下列所組成群組之 5-員環：Q-1、Q-4、Q-6、Q-10、Q-21、Q-23、Q-24、Q-25、Q-27、Q-37、Q-41 和 Q-44，

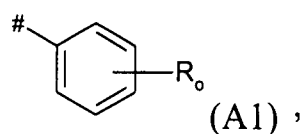
且

m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、甲基、乙基、氟、氯、溴、碘、氰基、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ ，

R^1 為氫，及

A 表示式(A1)之苯基



其中

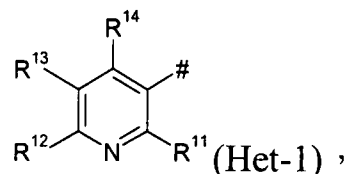
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、 $-OH$ 、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基、

C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



其中

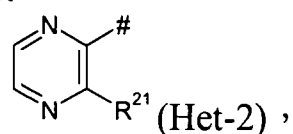
描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：

氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基。

5. 根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中

n 為 1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、-CF₃，

Q 表示選自由下列所組成群組之 5-員環：Q-21、Q-23、Q-25、Q-37

和 Q-44，

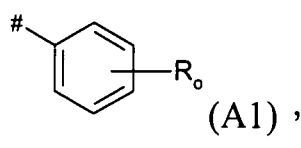
且

m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、-CF₃、-CH₂CF₃、
甲基、乙基、氟、氯，

R¹ 為氫，及

A 表示式(A1)之苯基



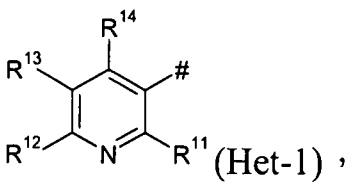
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、
氰基、甲基和-CF₃，或

A 表示式(Het-1)之雜環

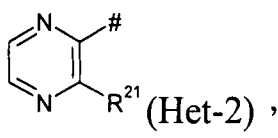


其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、甲基和-CF₃，及
R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，彼等可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：
氫、鹵素和-CF₃，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

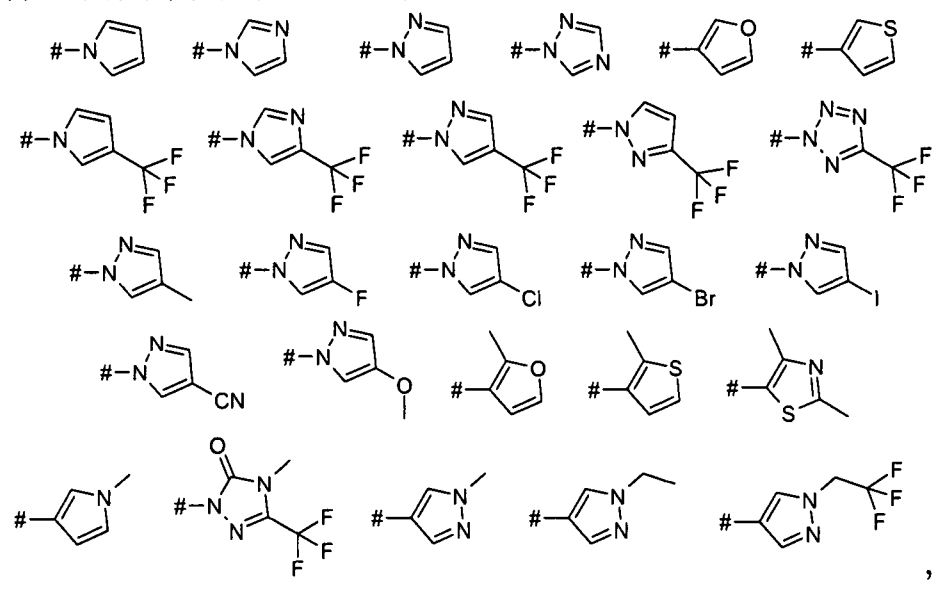
R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、甲基和-CF₃。

6. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

n 為 1，

X 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基，

Q 係選自由下列所組成之群組：

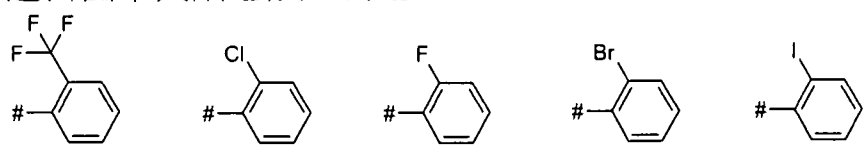


其中

描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹ 為氫，及

A 係選自由下列所組成之群組：

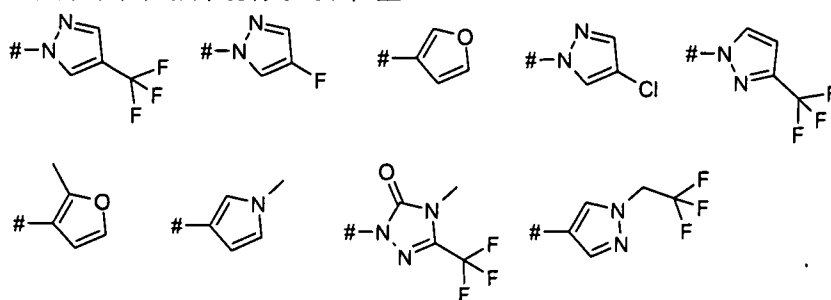




描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵。

n 為 1 ,

Q 係選自由下列所組成之群組：

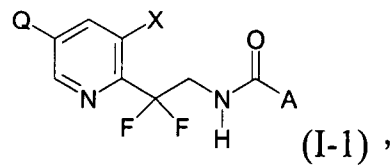


描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵，

A 係選自由下列所組成之群組：



描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵。



其中

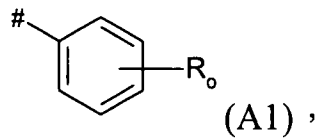
Q 為選自由下列所組成群組之 5-員環：Q-1、Q-4、Q-6、Q-10、Q-21、Q-23、Q-24、Q-25、Q-27、Q-37、Q-41 和 Q-44，且

m 為 0、1 或 2，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可用位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，

X 係選自由下列所組成之群組：氟、氯和三氟甲基，及

A 表示式(A1)之苯基



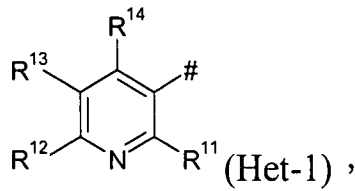
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 0、1 或 2，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧羰基、-NH(C₁-C₄-烷基)、苯基(視需要地經 C₁-C₄-烷氧基取代)和苯氧基，或

A 表示式(Het-1)之雜環



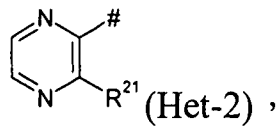
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R¹¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、-S-C₁-C₅-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、-S-C₂-C₅-烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₄-鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)和-S-苯基(視需要地經鹵素或 C₁-C₄-烷基取代)，及

R¹²、R¹³ 和 R¹⁴，其可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、-S-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



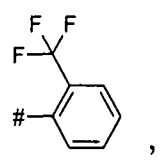
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R²¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，

其條件為：若

A 為

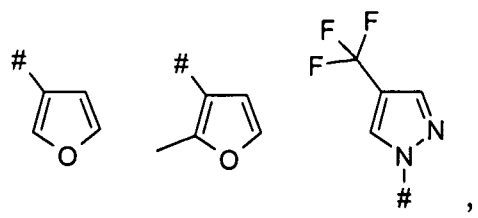


其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

X 為氯，則

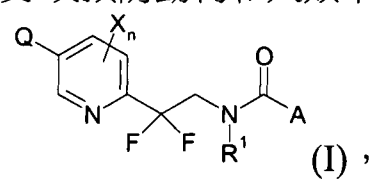
Q 為下列中之一者



其中

描述將 Q 連接至分子其餘部分之鍵。

9. 一種用於控制、治療及/或預防動物和人類中蠕蟲感染之式(I)化合物，



其中

R¹ 係選自由下列所組成之群組：氫、-CHO、-OH、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷氧基、C₃-C₆-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₆-鹵環烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-環烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷胺基-C₁-C₄-烷基、二-(C₁-C₄-烷基)胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷羰基、C₁-C₄-烷氧羰基、苄氧羰基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷羰基、-S(O)₂-C₁-C₄-烷基，及-S(O)₂-具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₄-鹵烷基，

n 為 0、1、2 或 3，

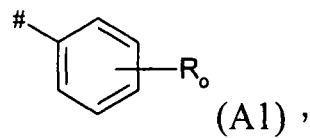
各 X 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、硝基、氰基、

羥基、胺基、-SH、-SF₅、-CHO、-OCHO、-NHCHO、-COOH、-CONH₂、
-CONH(OH)、-OCONH₂、(羥亞胺基)-C₁-C₆-烷基、C₁-C₈-烷基、具
有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-
烷胺基、二-(C₁-C₈-烷基)胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原
子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₂-C₈-烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₈-
鹵烯氧基、C₃-C₈-炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵炔氧
基、C₃-C₈-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵環烷基、C₁-C₈-
烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₈-
烷基)、-CON(C₁-C₈-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₈-烷基)、-CON(OC₁-C₈-
烷基)(C₁-C₈-烷基)、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-
鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵
烷羰氧基、C₁-C₈-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷
羰胺基、-OCONH(C₁-C₈-烷基)、-OCON(C₁-C₈-烷基)₂、
-OCONH(OC₁-C₈-烷基)、-OCO(OC₁-C₈-烷基)、-S-C₁-C₈-烷基、具有
1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至
5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至
5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、(C₁-C₆-烷氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷
基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₆-
烷基、(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺基、苄
氧基、-S-苯基和苯胺基，

Q 表示含有一至四個選自 N、S 和 O 之雜原子及帶有取代基 Y_m的芳
族 5-員雜環，且
m 為 0、1、2、3 或 4，受限於取代基 Y 可連接至其之 Q 中的可
用位置數，及

各 Y 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：氫、側氧基、鹵素、硝基、氰基、羥基、胺基、-SH、-SF₅、-CHO、-OCHO、-NHCHO、-COOH、-CONH₂、-CONH(OH)、-OCONH₂、(羥亞胺基)-C₁-C₆-烷基、C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷胺基、二-(C₁-C₈-烷基)胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₂-C₈-烯氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₂-C₈-鹵烯氧基、C₃-C₈-炔氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵炔氧基、C₃-C₈-環烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₃-C₈-鹵環烷基、C₁-C₈-烷羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰基、-CONH(C₁-C₈-烷基)、-CON(C₁-C₈-烷基)₂、-CONH(OC₁-C₈-烷基)、-CON(OC₁-C₈-烷基)(C₁-C₈-烷基)、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、C₁-C₈-烷羰胺基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰胺基、-OCONH(C₁-C₈-烷基)、-OCON(C₁-C₈-烷基)₂、-OCONH(OC₁-C₈-烷基)、-OCO(OC₁-C₈-烷基)、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、-CH₂-S-C₁-C₈-烷基、-CH₂-S(O)-C₁-C₈-烷基、-CH₂-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、(C₁-C₆-烷氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₂-C₆-烯氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(C₃-C₆-炔氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆-烷基、苄氧基、-S-苄基、苄胺基、苯氧基、-S-苯基和苯胺基，

A 表示式(A1)之苯基



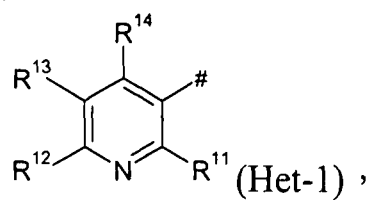
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

o 為 0、1、2、3、4 或 5，及

各 R 係彼此獨立地選自由下列所組成之群組：鹵素、硝基、-OH、NH₂、SH、SF₅、CHO、OCHO、NHCHO、COOH、氰基、C₁-C₈-烷基、具有 1 至 9 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₃-C₆-環烷基、-S-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷氧基-C₂-C₈-烯基、C₁-C₈-烷氧羰基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷氧羰基、C₁-C₈-烷羰氧基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C₁-C₈-鹵烷羰氧基、-S(O)-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)-C₁-C₈-鹵烷基、-S(O)₂-C₁-C₈-烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之-S(O)₂-C₁-C₈-鹵烷基、C₁-C₈-烷基磺醯胺、-NH(C₁-C₈-烷基)、N(C₁-C₈-烷基)₂、苯基(視需要地經 C₁-C₆-烷氧基取代)和苯氧基，或鍵結至相鄰碳原子的二個 R 一起表示-O(CH₂)_pO-，其中 p 表示 1 或 2，或

A 表示式(Het-1)之雜環



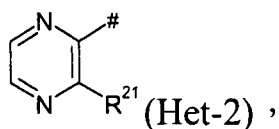
其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，

R^{11} 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 $-S$ - C_1 - C_5 -烷基、 $S(O)$ - C_1 - C_4 -烷基、 $-S(O)_2$ - C_1 - C_4 -烷基、 $-S$ - C_2 - C_5 -烯基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 $-S$ - C_1 - C_4 -鹵烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷氧基、苯氧基(視需要地經鹵素或 C_1 - C_4 -烷基取代)和 $-S$ -苯基(視需要地經鹵素或 C_1 - C_4 -烷基取代)，及

R^{12} 、 R^{13} 和 R^{14} ，其可為相同或不同，係選自由下列所組成之群組：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 -鹵烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 $-S$ - C_1 - C_4 -烷基、具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷氧基、 $-S(O)$ - C_1 - C_4 -烷基、 $-S(O)_2$ - C_1 - C_4 -烷基，或

A 表示式(Het-2)之雜環



其中

描述將 A 連接至分子其餘部分之鍵，及

R^{21} 係選自由下列所組成之群組：氫、鹵素、 C_1 - C_4 -烷基和具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵烷基，

或其醫藥上可接受的鹽、N-氧化物、金屬錯合物或類金屬錯合物。

10. 一種醫藥組成物，其包含至少一種根據申請專利範圍第 1 至 7 項或第 9 項中任一項之式(I)化合物。

11. 一種用於控制、治療及/或預防動物和人類中蠕蟲感染之醫藥組成物，其包含至少一種根據申請專利範圍第 1 至 7 項或第 9 項中任一項之式(I)化

合物。

12. 一種根據申請專利範圍第 1 至 7 項或第 9 項中任一項之式(I)化合物之用途，其用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染。
13. 一種根據申請專利範圍第 10 項之醫藥組成物之用途，其用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染。
14. 一種根據申請專利範圍第 1 至 7 項或第 9 項中任一項之式(I)化合物之用途，其用於製造供控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之藥物。
15. 一種用於控制、治療及/或預防動物和人類中的蠕蟲感染之方法，其包括將治療有效量的申請專利範圍第 1 至 7 項或第 9 項中任一項之式(I)化合物或申請專利範圍第 10 項之醫藥組成物投予至需要其之動物或人類的步驟。