

申請日期	89. 5. 2
案 號	89108276
類 別	C07D 239/00, 239/26, 239/28, 239/36, 239/42, 239/54, 239/30, 239/44, A01N 43/54

公告本

A4

C4

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	除害的嘧啶衍生物
	英 文	Pesticidal Pyrimidine-Derivatives
二、發明 人	姓 名	1.馬丁 艾貝爾 2.安德雷 尚格納 3.華納 桑貝克 4.亞瑟 史德格 5.莎林 法洛克
	國 籍	1.2.3.4.5.瑞士
	住、居所	1.瑞士 4103 波特明根,艾斯特拉格街 22 號 2.瑞士 4054 巴賽爾城,柏西格街 81 號 3.瑞士 4112 巴特維爾,雪德倫維格 35 號 4.瑞士 4144 亞爾山,布魯格維格 14 號 5.瑞士 4422 亞里斯多夫,克沙克街 27 號
	創 作	
三、申請人	姓 名 (名稱)	諾華公司
	國 籍	瑞士
	住、居所 (事務所)	瑞士 4058 巴賽爾城,黑森林大道 215 號
	代 表 人 姓 名	1.漢斯 魯道夫 豪斯 2.亨利艾特 布罕納

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
I P C分類：

A6
B6

本案已向：

瑞士 國 (地區) 申請專利，申請日期 1999.05.04. 案號： 833/99 ， ☒有 ☐無主張優先權

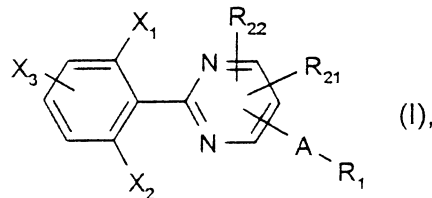
有關微生物已寄存於：，寄存日期：，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝訂線

五、發明說明(一)

本發明係關於下式之新穎嘧啶衍生物，



其中

R_1 係為未經取代的或單-至五取代之芳基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：OH，鹵素，CN， C_1 - C_6 -烷基，可選擇地經取代之 C_3 - C_8 環烷基，可選擇地經取代之 C_3 - C_8 -環烯基， C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -環烷基， C_3 - C_8 環烷基- C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基， C_3 - C_8 -鹵環烷基， C_1 - C_6 -烷氧基， C_3 - C_8 環烷氧基， C_1 - C_6 -鹵烷氧基， C_3 - C_8 -鹵環烷氧基， C_1 - C_6 -烷基硫基， C_3 - C_8 -環烷基硫基， C_1 - C_6 -鹵烷基硫基， C_3 - C_8 -鹵環烷基硫基， C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基， C_3 - C_8 -環烷基亞磺醯基， C_1 - C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_3 - C_8 -鹵環烷基亞磺醯基， C_1 - C_6 -烷基磺醯基， C_3 - C_8 -環烷基磺醯基， C_1 - C_6 -鹵烷基磺醯基， C_3 - C_8 -鹵環烷基磺醯基，可選擇地經取代之 C_2 - C_8 -烯基，可選擇地經取代之 C_2 - C_8 -炔基， C_1 - C_6 -烷基羰基， $-C(=NOR_6)-C_1-C_6$ 烷基； R_7 ；未經取代的或單-至五-取代之苯基；未經取代的或單-至五-取代之雜芳基，藉以該取代基係個別地選自下列所組成之族群中：OH，鹵素，CN， NO_2 ， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_8 -環烷基， C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_8 環烷基， C_3 - C_8 -環烷基- C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基， C_3 - C_8 -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (7)

鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基， C_3-C_8 -鹵環烷氧基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_3-C_8 環烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基， C_3-C_8 -鹵環烷基硫基， C_3-C_8 -烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_3-C_8 環烷基磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基磺醯基， C_2-C_8 -烯基， C_2-C_8 炔基， C_1-C_6 -烷基羰基， $-C(=NOR_6)-C_1-C_6$ -烷基及 R_7 ；未經取代的或單-至五-取代之苯氧基；未經取代的或單-至五-取代之苯基硫基；未經取代的或單-至五-取代之苯基胺基及未經取代的或單-至五-取代之-N(苯基)(C_1-C_6 -烷基)，藉以該取代基係個別地選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_3-C_8 環烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基及 C_3-C_8 -鹵環烷基硫基；

A 為單鍵， C_1-C_{12} -烷撐，O， $O(C_1-C_{12}$ -烷撐)， $S(O)_n$ ， $S(O)_n(C_1-C_{12}$ 烷撐)， C_2-C_8 -烯撐， C_2-C_8 -炔撐； NR_3 或 $NR_3(C_1-C_{12}$ -烷撐)；

R_3 為 H， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_2-C_8 -烯基， C_2-C_8 -炔基，芳基- C_1-C_6 -烷基， $(CH_2)_pC(O)R_4$ 或 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基；

R_4 為 H， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷氧基， $N(R_5)_2$ 或 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基；

R_5 為 H， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

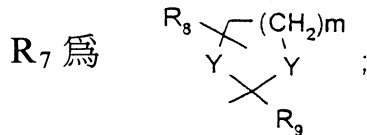
訂

線

五、發明說明 (3)

或芳基-C₁-C₆-烷基；

R₆ 為 H，C₁-C₆ 烷基或 C₃-C₈-環烷基；



R₈ 及 R₉ 彼此獨立為 H 或 C₁-C₆-烷基；

X₁ 及 X₂ 彼此獨立為 R₁₀；

X₃ 為 H 或 R₁₀；

R₁₀ 為鹵素，CN，NO₂，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₈-鹵環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，C₃-C₈-鹵環烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基，C₃-C₈-環烷基硫基，C₁-C₆-鹵烷基硫基或 C₃-C₈-鹵環烷基硫基；

R₂₁ 及 R₂₂ 彼此獨立為 H，鹵素，CN，NO₂，OH，SH，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈ 環烷基，C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-環烷基，C₃-C₈-環烷基-C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-鹵烷基，鹵 C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，鹵 C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基，C₃-C₈-環烷基硫基，C₁-C₆-鹵烷基硫基，鹵-C₃-C₈-環烷基硫基，C₁-C₆-烷基亞磺醯基，C₃-C₈-環烷基亞磺醯基，鹵 C₁-C₆-烷基亞磺醯基，C₃-C₈-鹵環烷基亞磺醯基，C₁-C₆-烷基磺醯基，C₃-C₈-環烷基磺醯基，C₁-C₆-鹵烷基磺醯基，鹵 C₃-C₈-環烷基磺醯基，

五、發明說明 (4)

$N(R_{23})R_{24}$ ， C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷氧基， C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基硫基， C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基胺基， C_2-C_8 -烯基氧基或 C_2-C_8 -炔基氧基；

R_{23} 及 R_{24} 彼此獨立為 H， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_3-C_8 -環烷基- C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基或 C_3-C_8 -鹵環烷基；

m 為 1，2，3 或 4；

n 為 0，1 或 2；且

Y 為 O 或 S；

及生理上可接受加成化合物，且其中合適地，關於 E/Z-異構物，E/Z 異構物之混合物及／或互變體，在每一例中為游離形式或農業化學上可使用鹽形式；一種生產這些化合物之方法及這些化合物之用途，除害組成物其活性成分係選自這些化合物，及一種生產及使用這些組成物之方法。

較佳的為式(I)化合物，其中

R_1 係為未經取代的或單-至五-取代之芳基，其中該取代基係選自下列所組成之族群中：OH，鹵素，CN， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -烷基- C_3-C_8 -環烷基， C_3-C_8 -環烷基- C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基， C_3-C_8 -鹵環烷氧基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_3-C_8 -環烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基， C_3-C_8 -鹵環烷基硫基， C_1-C_6 -烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (5)

亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_3-C_8 -環烷基磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基磺醯基， C_2-C_8 -烯基， C_2-C_8 -炔基， C_1-C_6 -烷基羰基， $-C(=NOR_6)-C_1-C_6$ -烷基， R_7 ；未經取代的或單-至五-取代之苯基，其中該取代基係選自下列所組成之族群中：OH，鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -烷基- C_3-C_8 -環烷基， C_3-C_8 -環烷基- C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基， C_3-C_8 -鹵環烷氧基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_3-C_8 -環烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基， C_3-C_8 -鹵環烷基硫基， C_1-C_6 -烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_3-C_8 -環烷基磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基磺醯基， C_2-C_8 -烯基， C_2-C_8 -炔基， C_1-C_6 -烷基羰基， $-C(=NOR_6)-C_1-C_6$ -烷基及 R_7 ；未經取代的或單-至五-取代之苯氧基，未經取代的或單-至五-取代之苯基硫基，未經取代的或單-至五-取代之苯基胺基及未經取代的或單-至五-取代之-N(苯基)(C_1-C_6 -烷基)，其中該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_3-C_8 -環烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基及 C_3-C_8 -鹵環烷基硫基；

R_{21} 及 R_{22} 彼此獨立為 H，鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基或 C_3-C_8 -鹵環烷基；

五、發明說明 (6)

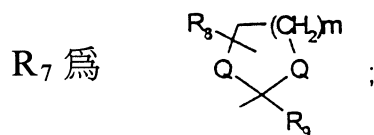
A 爲 $(CR_{11}R_{12})_p$ ， $O(CR_{11}R_{12})_p$ ， $S(O)_n(CR_{11}R_{12})_p$ ，未經取代的或經取代之 C_2 - C_8 -烯撐，未經取代的或經取代之 C_2 - C_8 -炔撐，其中該取代基係選自 R_{11} 及 R_{12} 所組成之族群中；或 $NR_3(CH_2)_p$ ；

R_3 爲 H， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_8 -環烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基， C_2 - C_8 -烯基， C_2 - C_8 -炔基，芳基- C_1 - C_6 -烷基， $(CH_2)_pC(O)R_4$ 或 C_1 - C_6 -烷氧基- C_2 - C_6 -烷基；

R_4 爲 H， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_8 -環烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基， C_1 - C_6 -烷氧基， $N(R_5)_2$ 或 C_1 - C_6 -烷氧基- C_2 - C_6 -烷基；

R_5 爲 H， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_8 -環烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基或芳基- C_1 - C_6 -烷基；

R_6 爲 H， C_1 - C_6 -烷基或 C_3 - C_8 -環烷基；



R_8 及 R_9 彼此獨立爲 H 或 C_1 - C_6 -烷基；

X_1 及 X_2 彼此獨立爲 R_{10} ；

X_3 爲 H 或 R_{10} ；

R_{10} 爲鹵素，CN， NO_2 ， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_8 -環烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基， C_3 - C_8 -鹵環烷基， C_1 - C_6 -烷氧基， C_3 - C_8 -環烷氧基， C_1 - C_6 -鹵烷氧基， C_3 - C_8 -鹵環烷氧基， C_1 - C_6 -烷基硫基， C_3 - C_8 -環烷基硫基， C_1 - C_6 -鹵烷基硫基或 C_3 - C_8 -鹵環

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (7)

烷基硫基；

R_{11} 及 R_{12} 彼此獨立為 H 或 C_1 - C_6 -烷基；

m 為 1, 2, 3 或 4；

n 為 0, 1 或 2；

p 為 0, 1, 2, 3, 4, 5 或 6；且

Q 為 O 或 S；

且其中合適地，其 E/Z 異構物，E/Z 異構物之混合物及／或互變體，在每一例中為游離形式或農業化學上可使用鹽形式。

某些嘧啶衍生物於文獻中被建議可作為控制家畜和生產家畜及栽培植物之作物的除害劑中的活性成份。然而，該等已知化合物之生物性質在害蟲控制的領域中不完全令人滿意，其係為什麼需要提供其他具有除害性質之化合物，根據本發明式(I)化合物之發展可解決該問題。

式(I)的化合物可為鹽形式或可為例如酸加成鹽形式；然而，游離形式為較佳。後者，例如，與強無機酸類，典型地為礦物酸類，例如硫酸，磷酸或氫鹵酸，或與強有機羧酸類，典型地為經取代，其中合適地為例如鹵取代，之 C_1 - C_4 烷羧酸類，例如乙酸，如可選擇地不飽和二羧酸類，例如草酸，丙二酸，順丁烯二酸，延胡索酸或酞酸，典型地為羥基羧酸類，例如抗壞血酸，乳酸，蘋果酸，酒石酸或檸檬酸，或苯甲酸，或與有機磺酸類，典型地為經取代，其中合適地為例如鹵取代，之 C_1 - C_4 烷-或芳基磺酸，例如甲烷- 或對-甲苯-磺酸而形成。在上文和下文中任何有

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明（ 8 ）

關式(I)的游離化合物或它們的鹽被了解的是同樣也包括該等式(I)的相當鹽或游離化合物。

除非有其他的定義，否則使用於上文和下文中之一般術語具有給予於下之意義。

除非有其他的定義，否則含碳基團和化合物各包含 1 最高到 6 個且包括 6 個，較佳為 1 最高到 4 個且包括 4 個，尤其是 1 或 2 個碳原子。

芳基為苯基或萘基。

雜芳基為尤其是吡啶基，嘧啶基，s-三嗪基，1,2,4-三嗪基，噻吩基，呋喃基，吡咯基，吡唑基，咪唑基，噻唑基，三唑基，噁唑基，噻二唑基，噁二唑基，苯並噻吩基，苯並呋喃基，苯並噻唑基，吡啶基或吡唑基，其較佳為藉由碳原子鍵結；噻唑基，苯並呋喃基，苯並噻唑基或吡啶基，尤其是噻唑基或吡啶基為較佳。

鹵素-呈基本身及呈其他基和化合物的結構元素，例如鹵烷基，鹵烷氧基和鹵烷基硫基-為氟，氯，溴或碘，尤其是氟，氯或溴，主要為氟或氯。

烷基-呈基本身及呈其他基和化合物的結構元素，例如鹵烷基，烷氧基及烷基硫基-在每一例中適當考慮包含在所討論之基或化合物的碳原子數目，為直鏈，即甲基，乙基，丙基，丁基，戊基，己基，庚基或辛基，或為支鏈，例如異丙基，異丁基，第二丁基，第三丁基，異戊基，新戊基或異己基。

環烷基-呈基本身及呈其他基和化合物的結構元素，例

五、發明說明 (9)

如鹵環烷基，環烷氧基和環烷基硫基-在每一例中考慮包含在所討論之基或化合物的碳原子數目，為環丙基，環丁基，環戊基，環己基，環庚基或環辛基。

烯基-呈基本身及呈其他基和化合物的結構元素-在每一例中適當考慮包含在所討論之基或化合物的碳原子的數目及共軛或隔離之雙鍵，為直鏈例如烯丙基，2-丁烯基，3-戊烯基，1-己烯基，1-庚烯基，1,3-己二烯基或1,3-辛二烯基，或為支鏈，例如異丙烯基，異丁烯基，異戊二烯基，第三戊烯基，異己烯基，異庚烯基或異辛烯基。

炔基-呈基本身及呈其他基和化合物的結構元素-在每一例中適當考慮碳原子的數目及包含在所討論之基或化合物的共軛或隔離之雙鍵-為直鏈，例如炔丙基，2-丁炔基，3-戊炔基，1-己炔基，1-庚炔基，3-己烯-1-炔基或1,5-庚二烯-3-炔基，或為支鏈，例如3-甲基丁-1-炔基，4-乙基戊-1-炔基，4-甲基己-2-炔基或2-甲基庚-3-炔基。

烷撐基，烯撐基和炔撐基為直鏈或支鏈烴橋，它們為，特別是-CH₂-，-CH₂-CH₂-，-CH(CH₃)-，-CH(CH₃)CH₂-，-CH(CH₃)CH₂-CH₂-，-CH₂C(CH₃)₂-CH₂-，-CH=CH-，-CH₂-CH=CH-，-CH₂-CH=CH-CH₂-；-C≡C-和-CH₂C≡C-；更特別是-CH₂-。

經鹵素取代之含碳基和化合物，例如鹵烷基，鹵烷氧基和鹵烷基硫基，可為部份鹵化或全鹵化，鹵素取代基在多鹵化作用之情形中為相同或不同。鹵烷基之實例-呈基本身及呈其他基和化合物的結構元素，例如鹵烷氧基和鹵烷

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(10)

基硫基-為被氟，氯及／或溴取代一至三次之甲基，例如 CHF_2 或 CF_3 ；被氟，氯及／或溴取代一至五次之乙基例如 CH_2CF_3 ， CF_2CF_3 ， CF_2CCl_3 ， CF_2CHCl_2 ， CF_2CHF_2 ， CF_2CFCl_2 ， CF_2CHBr_2 ， CF_2CHClF ， CF_2CHBrF 或 CClFCHClF ；被氟，氯及／或溴取代一至七次之丙基或異丙基例如 $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ ， $\text{CF}_2\text{CHFCF}_3$ ， $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 或 $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ ；被氟，氯及／或溴取代一至九次之丁基或其異構物，例如 $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 或 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ；被氟，氯及／或溴取代一至十一次之戊基或其異構物，例如 $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 或 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ；和被氟，氯及／或溴取代一至十三次之己基或其異構物，例如 $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ ， $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$ ， $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ 或 $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 。

可選擇地經取代的基，為例如 $\text{C}_2\text{-C}_8$ 烯基， $\text{C}_2\text{-C}_8$ 炔基， $\text{C}_3\text{-C}_8$ 環烯基或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基，係較佳地以 OH ， CN ，硝基，鹵素， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -鹵烷氧基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基硫基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -鹵烷基硫基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基亞磺醯基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ 鹵烷基亞磺醯基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基磺醯基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ 鹵烷基磺醯基，苯基，鹵素苯基，苯氧基， NHR_3 ， $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ， $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-\text{C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 及 $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 取代。

在本發明之上下文中，較佳的具體實施例為式(I)化合物，且其中合適地，其 E/Z 異構物，E/Z 異構物之混合物及／或互變體，在每一例中為游離形式或農業化學上可使用鹽形式，包括生理上可接受加成化合物，其中

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (11)

(1)R₁ 為未經取代的 或單-至三 -取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₈-鹵環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，C₃-C₈-鹵環烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基，C₃-C₈-環烷基硫基，C₁-C₆-鹵烷基硫基，C₃-C₈-鹵環烷基硫基，C₁-C₆-烷基亞磺醯基，C₃-C₈-環烷基亞磺醯基，C₁-C₆-鹵烷基亞磺醯基，C₃-C₈-鹵環烷基亞磺醯基，C₁-C₆-烷基磺醯基，C₃-C₈-環烷基磺醯基，C₁-C₆-鹵烷基磺醯基，C₃-C₈-鹵環烷基磺醯基；未經取代的 或單-至三-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN，NO₂，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₈-鹵環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，C₃-C₈-鹵環烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基，C₃-C₈-環烷基硫基，C₁-C₆-鹵烷基硫基，C₃-C₈-鹵環烷基硫基，C₁-C₆-烷基亞磺醯基，C₃-C₈-環烷基亞磺醯基，C₁-C₆-鹵烷基亞磺醯基，C₃-C₈-鹵環烷基亞磺醯基，C₁-C₆-烷基磺醯基，C₃-C₈-環烷基磺醯基，C₁-C₆-鹵烷基磺醯基及 C₃-C₈-鹵環烷基磺醯基；未經取代的 或單-至三-取代之苯氧基，未經取代的 或單-至三-取代之苯基硫基，未經取代的 或單-至三-取代之苯基胺基及未經取代的 或單-至三-取代之 -N(苯基)(C₁-C₆-烷基)，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN，NO₂，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₈-鹵環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基，C₁-C₆-鹵烷基硫基，C₁-C₆-烷基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (12)

亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基磺醯基及 C_3-C_8 -環烷氧基；

較佳地為單-或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基， C_3-C_8 -鹵環烷氧基，未經取代的或單-至三-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基及 C_3-C_8 -鹵環烷氧基；未經取代的或單-至三-取代之苯氧基及未經取代的或單-至三-取代之苯基胺基，藉以該苯氧基-，苯基胺基之基團的取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_4 -烷基， C_3-C_6 -環烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_3-C_6 -鹵環烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_3-C_6 -環烷氧基， C_1-C_4 -烷基硫基及 C_1-C_4 -鹵烷基硫基；

更佳地為單-或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素， C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_4 -鹵烷氧基，未經取代的或單-至三-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基及 C_1-C_4 -鹵烷氧基，未經取代的或單-至三-取代之苯氧基及未經取代的或單-至三-取代之苯基胺基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素， C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (17)

烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷基硫基及 C_1-C_6 -鹵烷基硫基；

更佳地為單取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：氟，氯， C_1-C_2 -烷基， C_1-C_2 -鹵烷基，及未經取代的或單-或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：氟，氯， C_1-C_2 -鹵烷基， C_1-C_2 -烷氧基， C_1-C_2 -鹵烷氧基， C_1-C_2 -烷基硫基及 C_1-C_2 -鹵烷基硫基；

非常特別是為單取代之苯基，藉以該取代基為單-或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：氟，氯， C_1-C_2 -鹵烷基， C_1-C_2 -烷氧基， C_1-C_2 -鹵烷氧基， C_1-C_2 -烷基硫基及 C_1-C_2 -鹵烷基硫基；

(2) R_{21} 及 R_{22} 彼此獨立為 H，鹵素， C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_6 -鹵烷基；較佳地為 H 或鹵素；更佳地為 H；

(3)A 為單鍵， C_1-C_6 -烷撐，O， $O(C_1-C_6$ -烷撐)， C_2-C_4 -烯撐， C_2-C_4 -炔撐或 NR_3 ；

較佳地為單鍵，O， $O-CH_2-$ ， $C \equiv C$ ， $CH=CH$ 或 NH；

更佳地為單鍵或 O；

最佳地為單鍵；

(4) R_3 為 H， C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 -鹵烷基；

較佳地為 H 或 C_1-C_6 -烷基；

更佳地為 H 或 C_1-C_2 -烷基；

(5) X_1 及 X_2 彼此獨立為鹵素， C_1-C_4 -烷基， C_3-C_6 -環烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_4 -鹵烷氧基， C_1-C_4 -烷基硫基或 C_1-C_4 -鹵烷基硫基；

五、發明說明 (4)

較佳地爲鹵素， C_1-C_2 -烷基， C_1-C_2 -鹵烷基， C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -鹵烷氧基；

尤其是爲氟，氯，甲基，三氟甲基或甲氧基；

特別是爲氯或氟；更特別是爲氟；

(6) X_3 爲 H，鹵素， C_1-C_4 -烷基， C_3-C_6 -環烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_4 -鹵烷氧基， C_1-C_4 -烷基硫基或 C_1-C_4 -鹵烷基硫基；

較佳地爲 H，鹵素， C_1-C_2 -烷基， C_1-C_2 -鹵烷基， C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -鹵烷氧基；更佳地爲 H，氟，氯，甲基，三氟甲基或 甲氧基，

特別是爲 H，氟或氯；更特別是爲 H；

(7) R_1 爲未經取代的或單-至三-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基， C_3-C_8 -鹵環烷氧基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_3-C_8 -環烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基， C_3-C_8 -鹵環烷基硫基， C_1-C_6 -烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_3-C_8 -環烷基磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基磺醯基；未經取代的或單-至三-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_3-C_8 -環烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基， C_3-C_8 -鹵環烷氧基， C_1-C_6 -烷基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (15)

硫基， C_3-C_8 -環烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基， C_3-C_8 -鹵環烷基硫基， C_1-C_6 -烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_3-C_8 -鹵環烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_3-C_8 -環烷基磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基磺醯基及 C_3-C_8 -鹵環烷基磺醯基；未經取代的或單-至三-取代之苯氧基，未經取代的或單-至三-取代之苯基硫基，未經取代的或單-至三-取代之苯基胺基及未經取代的或單-至三-取代之-N(苯基)(C_1-C_6 烷基)，藉以該苯氧基-，苯基硫基-，苯基胺基-及-N(苯基)(C_1-C_6 -烷基)基係個別地選自下列所組成之族群中：鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_3-C_8 -鹵環烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_1-C_6 -鹵烷基硫基， C_1-C_6 -烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_1-C_6 -鹵烷基磺醯基，及 C_3-C_8 -環烷氧基；

R_{21} 及 R_{22} 彼此獨立為 H，鹵素， C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_6 -鹵烷基；

A 為單鍵， C_1-C_{12} -烷撐，O，O(C_1-C_{12} -烷撐)， C_2-C_8 -烯撐， C_2-C_8 -炔撐；或 NR_3 ；

R_3 為 H， C_1-C_6 烷基 或 C_1-C_6 -鹵烷基；

X_1 及 X_2 彼此獨立為鹵素， C_1-C_4 -烷基， C_3-C_6 -環烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_4 -鹵烷氧基， C_1-C_4 -烷基硫基或 C_1-C_4 -鹵烷基硫基；且

X_3 為 H，鹵素， C_1-C_4 -烷基， C_3-C_6 -環烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_4 -鹵烷氧基， C_1-C_4 -烷基硫基或

五、發明說明 (, b)

C₁-C₄-鹵烷基硫基；

(8)R₁ 為單-或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₈-鹵環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，C₃-C₈-鹵環烷氧基，未經取代的或單-至三-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN，NO₂，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₈-鹵環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基及 C₃-C₈-鹵環烷氧基，未經取代的或單-至三-取代之苯氧基及未經取代的或單-至三-取代之苯基胺基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，CN，NO₂，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₈-鹵環烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基及 C₃-C₈-環烷氧基；

R₂₁ 及 R₂₂ 彼此獨立為 H 或鹵素；

A 為單鍵，O，C≡C，CH=CH 或 NH；

X₁ 及 X₂ 彼此獨立為鹵素，C₁-C₂-烷基，C₁-C₂-鹵烷基，C₁-C₂-烷氧基或 C₁-C₂-鹵烷氧基；且

X₃ 為 H，鹵素，C₁-C₂-烷基，C₁-C₂-鹵烷基，C₁-C₂-烷氧基或 C₁-C₂-鹵烷氧基；

(9)R₁ 為單- 或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，C₁-C₄-烷基，C₁-C₄-鹵烷基，C₁-C₄-烷氧基，C₁-C₄-鹵烷氧基；未經取代的或單-至三-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (17)

素，CN，NO₂，C₁-C₄-烷基，C₁-C₄-鹵烷基，C₁-C₄-烷氧基，C₁-C₄ 鹵烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基及 C₁-C₆-鹵烷基硫基；及未經取代的或單-至三-取代之苯氧基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，C₁-C₄-烷基，C₁-C₄-鹵烷基及 C₁-C₆-烷氧基；

R₂₁ 及 R₂₂ 為 H；

A 為單鍵；

X₁ 及 X₂ 彼此獨立為鹵素，C₁-C₂-烷基，C₁-C₂-鹵烷基，C₁-C₂-烷氧基或 C₁-C₂-鹵烷氧基；且

X₃ 為 H，鹵素，C₁-C₂-烷基，C₁-C₂-鹵烷基，C₁-C₂-烷氧基或 C₁-C₂-鹵烷氧基；

(10)R₁ 為單-或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，C₁-C₂-烷基，C₁-C₂-鹵烷基；及未經取代的或單-或二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，C₁-C₄-烷基，C₁-C₄-鹵烷基，C₁-C₄-烷氧基，C₁-C₄-鹵烷氧基，C₁-C₄-烷基硫基及 C₁-C₄-鹵烷基硫基；

R₂₁ 及 R₂₂ 為 H；

A 為單鍵；

X₁ 及 X₂ 彼此獨立為氟，氯，甲基，三氟甲基或 甲氧基；且

X₃ 為 H，氟，氯，甲基，三氟甲基或甲氧基；

(11)該 A-R 基團為在嘧啶環上之第 5-位置。

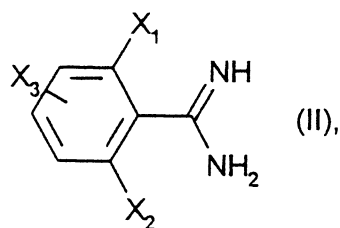
在本發明上下文內，尤其偏好表 1 到 4 中所列之式(I)

五、發明說明 (8)

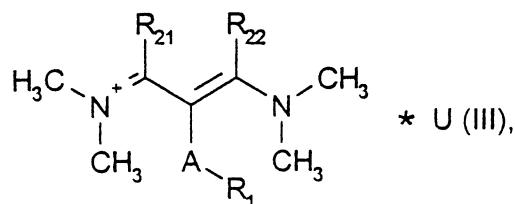
化合物和更尤其較佳是於合成實施例中所述者。

本發明之另外目的為一種式(I)化合物之製備方法，在每一例中為游離形式或鹽形式，其中，

a)為生產式(I)化合物，其中 R_{21} 及 R_{22} 不為鹵素且 AR_1 在第 5-位置，將下式(II)化合物



其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 X_1 ， X_2 及 X_3 為如式(I)所定義，為游離形式或鹽形式，與下式(III)化合物反應

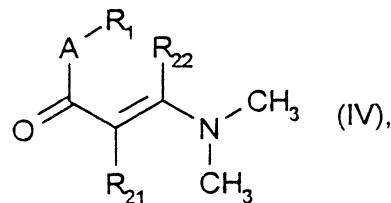


其中 U 為一陰離子如鹵化物，硫酸鹽，高氯酸鹽或硝酸鹽，且其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 A， R_1 ， R_{21} 及 R_{22} 為如式(I)所定義，可選擇地在一鹼催化劑如甲醇鈉之存在下，或

b)為生產式(I)化合物，其中 A 為烷撐， C_2 - C_8 -烯撐或 C_2 - C_8 -炔撐且 R_{22} 不為鹵素，將式(II)化合物，其係為游離

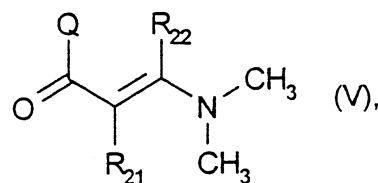
五、發明說明 (19)

形式或鹽形式，與下式(IV)化合物反應



其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 R_1 ， R_{21} 及 R_{22} 為如式(I)所定義，且 A 為烷撐， C_2 - C_8 -烯撐或 C_2 - C_8 -炔撐，可選擇地在一鹼催化劑如甲醇鈉之存在下，或

c)為生產式(I)化合物，其中 A 為 O， $O(C_1$ - C_{12} -烷撐) $S(O)_n$ 或 $S(O)_n(C_1$ - C_{12} -烷撐)且 R_{22} 不為鹵素，將式(II)化合物，其係為游離形式或鹽形式，與下式(V)化合物反應



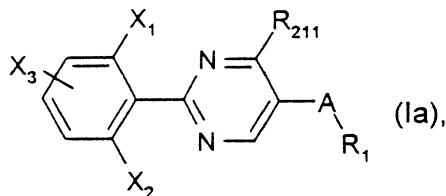
其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 R_{21} 及 R_{22} 為如式(I)所定義且 Q 為一離去基，較佳地為鹵素或 C_1 - C_6 -烷氧基，且該生成產物，可選擇地在中間物分離後，與一鹵化劑，較佳地為 PCl_5 ， $POCl_3$ 或 $(COCl)_2$ 反應，且該生成產物，可選擇地在於再次中間物分離後，與下式(VI)化合物反應

五、發明說明 (7)

HA-R₁ (VI),

其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 A 及 R₁ 為如式(I)所定義，可選擇地在一鹼催化劑之存在下，或

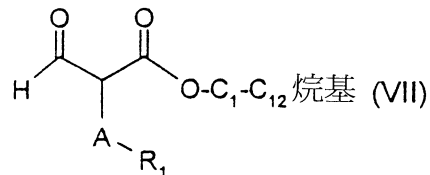
d) 為生產下式化合物



其中 X₁, X₂, X₃, A 及 R₁ 為如式(I)所定義，且 R₂₁₁ 為鹵素，OH，SH，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₈-環烷氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，C₃-C₈-鹵環烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基，C₃-C₈-環烷基硫基，C₁-C₆-鹵烷基硫基，C₃-C₈-鹵環烷基硫基，C₁-C₆-烷基亞磺醯基，C₃-C₈-環烷基亞磺醯基，C₁-C₆-鹵烷基亞磺醯基，C₃-C₈-鹵環烷基亞磺醯基，C₁-C₆-烷基磺醯基，C₃-C₈-環烷基磺醯基，C₁-C₆-鹵烷基磺醯基，C₃-C₈-鹵環烷基磺醯基，N(R₂₃)R₂₄，C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基硫基，C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基胺基，C₂-C₈-烯基氧基或 C₂-C₈-炔基氧基且 R₂₃ 及 R₂₄ 為如前述式(I)所定義，

將前述式(II)化合物與下式(VII)化合物反應

五、發明說明 (21)



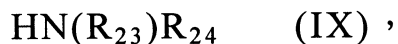
其中 A 及 R₁ 為如前述式(I)所定義，

且因此獲得式(Ia)化合物，其中 R₂₁₁ 為 OH，係可選擇地與一鹵化劑反應以形成式(Ia)化合物，其中 R₂₁₁ 為鹵素，尤其是為氯，且因此獲得式(Ia)化合物，其中 R₂₁₁ 為鹵素，係可選擇地與下式(VIII)化合物反應



其中 Z 為 O 或 S 且 R_x 為 H，C₁-C₆-烷基，C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-鹵烷基，鹵-C₃-C₈-環烷基，C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基，C₂-C₈-烯基或 C₂-C₈-炔基；

或與下式(IX)化合物反應



其中 R₂₃ 及 R₂₄ 具有如式(I)之意義，且因此獲得式(Ia)化合物，其中該取代基 R₂₁₁ 係由一 S-原子鍵結至嘧啶環，係可選擇地被氧化，或

e)為生產下式化合物

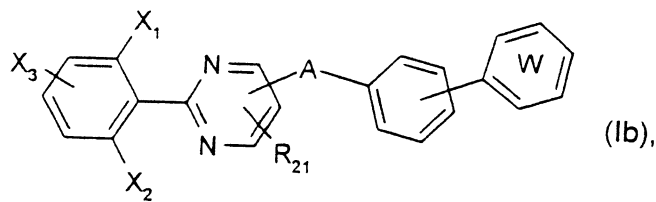
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

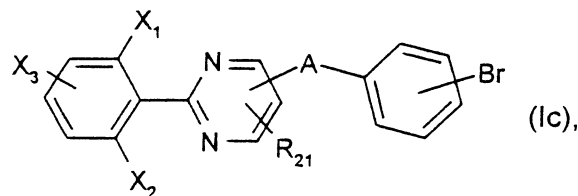
訂

線

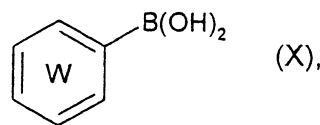
五、發明說明 (77)



其中 A, X_1 , X_2 , X_3 , R_{21} 為如前述式(I)所定義且如式(Ib)之所指示之該標示為 W 之環係經取代, 將下式(Ic)化合物



其中 X_1 , X_2 , X_3 , R_{21} 為如前述式(I)所定義, 與下式(X)化合物反應



其為可選擇地在如式(Ic)之所指示之標示為 W 之環上經取代, 且其為已知或可經由其本身已知之方法生產;

且在每一例中, 如果需要的話, 將根據該方法或藉由其他方法可獲得之式(I)化合物, 在每一例中為游離形式或鹽形式, 轉換成不

五、發明說明 (21)

同之式(I)化合物，分離根據該方法可獲得之異構物混合物及單離所欲的異構物及／或將根據該方法可獲得之式(I)的游離化合物轉化成一種式(I)化合物的鹽或將根據該方法可獲得之式(I)化合物的鹽轉換成式(I)之游離化合物或不同的鹽。

前述關於式(I)化合物之鹽類所作的建議關於其鹽類，可類似地適用於上文及下文所提及之起始物質。

在反應步驟 a 至 h)中之反應物可與彼此之一反應，也就是說，不需要添加溶劑或稀釋劑，例如，在熔化狀態中。然而，在大部分例子中，添加一惰性溶劑或稀釋劑或其混合物係為有利的。

變化 a)：

溶劑和稀釋劑的例子為：芳族，脂族及脂環烴類和鹵化烴類，例如苯，甲苯，二甲苯，三甲苯，四氫化萘，氯苯，二氯苯，溴苯，石油醚，己烷，環己烷，二氯甲烷，三氯甲烷，四氯甲烷，二氯乙烷，三氯乙烷或四氯乙烷；醚類，例如二乙醚，二丙基醚，二異丙基醚，二丁基醚，第三丁基甲基醚，乙二醇單甲基醚，乙二醇單乙基醚，乙二醇二甲基醚，二甲氧基二乙基醚，四氫呋喃或二噁烷；酮類，例如丙酮，甲基乙基酮或甲基異丁基酮；醇類，例如甲醇，乙醇，丙醇，異丙醇，丁醇，乙二醇或丙三醇；及亞砒類，例如二甲亞砒。若反應係在一鹼之存在下進行，則使用的鹼為過量，如三乙胺，吡啶，N-甲基嗎福啉，或N,N-二乙基苯胺亦可作為溶劑或稀釋劑。醇類為較佳。

反應有利地在約 0°C 到約 +150°C 溫度範圍內，較佳地

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (74)

爲約 20°C 到約 +100°C 完成。

在變化 a) 的一個較佳具體實施例中，鹽類型式之式(II)的化合物，係於約 50°C 到約 100°C，較佳地爲約 65°C，在一醇，較佳地爲甲醇中，在一鹼催化劑，較佳地爲甲醇鈉的存在下與式(III)化合物反應。

變化 b)：

溶劑和稀釋劑的例子如變化 a) 中所述。

反應有利地在約 0°C 到約 +150°C 溫度範圍內，較佳地爲約 20°C 到約 +100°C 完成。

在變化 b) 的一個較佳具體實施例中，式(II)的化合物，係於約 50°C 到約 100°C，較佳地爲約 80°C，在一醇，較佳地爲乙醇中，在一鹼催化劑，較佳地爲第三丁基鉀的存在下與式(IV)化合物反應。

變化 c)：

溶劑和稀釋劑的例子如變化 a) 中所述。

反應有利地在約 0°C 到約 +150°C 溫度範圍內，較佳地爲約 20°C 到約 +100°C 完成。

在變化 c) 的一個較佳具體實施例中，式(II)的化合物，係於約 50°C 到約 100°C，較佳地爲約 80°C，在一醇，較佳地爲乙醇中，在一鹼催化劑，較佳地爲第三丁基鉀的存在下與式(V)化合物反應，單離該生成中間物，於一惰性溶劑，較佳地爲多氯化芳族中，與 POCl_3 反應，且該生成產物係在進一步分離後與式(VI)化合物反應。

變化 d)：

五、發明說明 (ㄝ)

溶劑和稀釋劑的例子如變化 a)中所述。

反應有利地在約 0℃ 到約 +150℃ 溫度範圍內，較佳地為約 20℃ 到約 +100℃ 完成。

在變化 d)的一個較佳具體實施例中，式(II)的化合物，係於約 50℃ 到約 150℃，較佳地為約 120℃，在甲苯中，在一有機鹼如三乙胺的存在下或於一酸如甲苯磺酸的存在下與式(VII)化合物反應。因此獲得之中間物與一氯化劑如 POCl_3 反應，且進一步與式(VIII)或式(IX)化合物反應。

變化 e)：

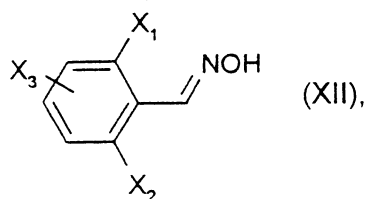
溶劑和稀釋劑的例子如變化 a)中所述。

反應有利地在約 0℃ 到約 +150℃ 溫度範圍內，較佳地為約 20℃ 到約 +100℃ 完成。

在變化 e)的一個較佳具體實施例中，式(Ic)的化合物，係於約 40℃ 到約 90℃，較佳地為約 60℃，在二甲氧基乙烷中，在鈀錯合物催化劑如 $\text{Pd}(\text{PPh})_2\text{Cl}_2$ 的存在下，及於水性 NaHCO_3 的存在下與式(X)化合物反應。

本發明的另一目的為

f)一種生產式(II)化合物之方法，其中將下式(XII)化合物



五、發明說明 (26)

其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 X_1 ， X_2 及 X_3 為如式(I)所定義，係與一烷基次氯酸鹽，較佳地為氯，第三丁基次氯酸鹽或 N-氯琥珀醯亞胺反應，該生成中間物係不經分離與氨反應，且該生成羧酸醯胺係被氫化，可選擇地在中間物分離後，在一氫化催化劑，較佳地為鎳之存在下；

且在每一例中，如果需要的話，將根據該方法或藉由其他方法可獲得之式(II)化合物，在每一例中為游離形式或鹽形式，轉換成不同之式(II)化合物，分離根據該方法可獲得之異構物混合物及單離所欲的異構物及／或將根據該方法可獲得之式(II)的游離化合物轉化成一種式(II)化合物的鹽或將根據該方法可獲得之式(II)化合物的鹽轉換成式(II)之游離化合物或不同的鹽。

步驟變化 f)之溶劑和稀釋劑的例子如變化 a)生產式(I)化合物中所述。

反應有利地在約-20℃到約+100℃溫度範圍內，較佳地為約 0℃到約+30℃完成。

在一較佳具體實施例中，式(XII)化合物係於一惰性溶劑，較佳地為二氯甲烷中，於室溫下與第三丁基次氯酸鹽反應，該產物在不需分離下進一步與一醇氨溶液反應，且在分離中間物後，使用鎳作為催化劑氫化。

本發明之另一目的為

g) 一種生產式(III)化合物之方法，例如，藉由下式化合物

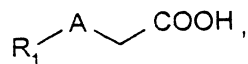
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (21)



其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 A 及 R₁ 為如式(I)所定義，與二甲基甲醯胺及 POCl₃ 之混合物反應；

且在每一例中，如果需要的話，將根據該方法或藉由其他方法可獲得之式(III)化合物，在每一例中為游離形式或鹽形式，轉換成不同之式(III)化合物，分離根據該方法可獲得之異構物混合物及單離所欲的異構物及／或將根據該方法可獲得之式(III)的游離化合物轉化成一種式(III)化合物的鹽或將根據該方法可獲得之式(III)化合物的鹽轉換成式(III)之游離化合物或不同的鹽。

步驟變化 g)之溶劑和稀釋劑的例子如變化 a)生產式(I)化合物中所述。

反應有利地在約-20℃到約+100℃溫度範圍內，較佳地為約-10℃到約+80℃完成。

在一較佳具體實施例中，式(XII)化合物係約 20℃到約 80℃，無溶劑下，與二甲基甲醯胺及 POCl₃ 之混合物反應。

本發明之另一目的為

h)一種生產式(IV)化合物之方法，例如，藉由下式(XIII)化合物

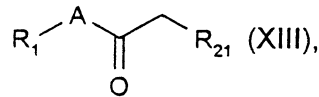
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

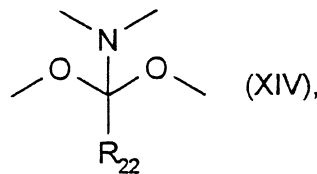
訂

線

五、發明說明 (28)



其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 A 及 R₁ 為如式(I)所定義，除了 A 不為 O，O(C₁-C₁₂-烷撐)，S(O)_n，S(O)_n(C₁-C₁₂-烷撐)，NR₃ 或 NR₃(C₁-C₁₂-烷撐)外，與下式(XIV)化合物反應



其為已知或可經由類似相對應已知化合物之方法製備，且其中 R₂₂ 為如式(I)所定義；

且在每一例中，如果需要的話，將根據該方法或藉由其他方法可獲得之式(IV)化合物，在每一例中為游離形式或鹽形式，轉換成不同之式(IV)化合物，分離根據該方法可獲得之異構物混合物及單離所欲的異構物及／或將根據該方法可獲得之式(IV)的游離化合物轉化成一種式(IV)化合物的鹽或將根據該方法可獲得之式(IV)化合物的鹽轉換成式(IV)之游離化合物或不同的鹽。

步驟變化 h)之溶劑和稀釋劑的例子如變化 a)生產式(I)化合物中所述。

反應有利地在約-20℃到約+100℃溫度範圍內，較佳地

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (29)

爲約-10℃到約+80℃完成。

在一較佳具體實施例中，式(XIII)化合物係約 20℃到 80℃，無溶劑下，與二甲基甲醯胺及 POCl_3 之混合物反應。

式(I)化合物的鹽類可以本身已知的方法製備。例如，式(I)化合物的酸加成鹽係以適當的酸或適當的離子交換試劑處理獲得和與鹼的鹽係與適當的鹼或適當的離子交換試劑處理獲得。

式(I)化合物的鹽類可在本身已知的方法中轉換成式(I)游離化合物：酸加成鹽，例如，藉由以適當鹼劑或適當的離子交換試劑處理和與鹼之鹽，例如，藉由適當的酸或適當離子交換試劑處理。

式(I)化合物的鹽類可在本身已知的方法中轉換成式(I)化合物之其他鹽；例如，酸加成鹽可轉換成其他的酸加成鹽，例如藉由無機酸的鹽(例如鹽酸鹽)之處理，以酸之適當的金屬鹽，例如鈉、鋁或銀鹽，例如以醋酸銀，在其中形成無機鹽的適當溶劑中，例如氯化銀，是不溶解的且因此從反應混合物中沈澱出來。

視方法及／或反應條件而定，具有鹽形成性質之式(I)化合物可以游離形式或以鹽形式獲得。

式(I)化合物也可以其溶劑合物形式獲得，例如它們的水合物之形式。

本發明係有關所有具體實施例之方法，其中可以起始化合物或在方法中任何階段獲得之中間產物的化合物係作

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (30)

為起始物質和所有或一些之其餘步驟進行，或起始物質以衍生物的形式或鹽或，尤其，在反應條件下形成之形式使用。

在本發明方法中，其較佳使用該等產生本文開始所描述的式(I)化合物的起始物質和中間產物是特別有價值的。

本發明特別是有關描述在製備實施例的方法。

本發明也有關一種根據本發明使用於製備式(I)化合物和它們的鹽之新穎起始物質和中間產物，在每一例中為游離形式或鹽形式，有關該等新穎起始物質和中間產物的用途和有關它們之製備方法。

在有害生物控制的區域中，根據本發明式(I)的化合物是顯示有價值的防止及／或醫療活性且具有真正有利的殺生物範圍的活性成分，甚至於低濃度下，同時對溫血動物、魚和植物具有良好耐忍受性。該等根據本發明之活性成分有效抗正常敏感動物的有害生物之所有或個別的發展階段，但是也抗動物有害生物，例如昆蟲和蟎目的代表。該等根據本發明之活性成分的殺蟲，殺卵及／或殺蟎活性可直接地以本身顯示，也就是在有害生物死亡率上，其立刻發生或只有在一些時間之後發生，例如在脫皮期間，或他們的蛋，或間接地，例如在減少產卵期及／或孵化比率，相當於至少 50 到 60% 的死亡率的良好活性。

該等動物的有害生物包括，例如，歐洲專利申請案 EP-A-736252 中所陳述者，該等列於其中之有害生物因此包括在本發明中以供參考。

五、發明說明 (31)

蟎目的代表為尤其是

粗角粉蟎 (*Acarus siro*)，桔芽癭蟎 (*Aceria sheldoni*)，蘋刺癭蟎 (*Aculus schlechtendali*)，花蜱屬 (*Amblyomma spp.*)，隱喙蜱屬 (*Argas spp.*)，牛蜱屬 (*Boophilus spp.*)，短須蟎屬 (*Brevipalpus spp.*)，苜蓿苔蟎 (*Bryobia praetiosa*)，(*Calipitrimerus spp.*)，恙蟎屬 (*Chorioptes spp.*)，雞皮刺蟎 (*Dermanyssus gallinae*)，鵝耳櫪東方葉蟎 (*Eotetranychus carpini*)，癭蟎屬 (*Eriophyes spp.*)，(*Hyalomma spp.*)，硬蜱屬 (*Ixodes spp.*)，(*Olygonychus pratensis*)，喙蜱屬 (*Ornithodoros spp.*)，紅蜘蛛屬 (*Panonychus spp.*)，橘銹蟎 (*Phyllocoptruta oleivora*)，側多食跌線蟎 (*Polyphagotarsonemus latus*)，癢蟎屬 (*Psoroptes spp.*)，頭蜱屬 (*Rhipicephalus spp.*)，根蟎屬 (*Rhizoglyphus spp.*)，疥蟎屬 (*Sarcoptes spp.*)，線蟎屬 (*Tarsonemus spp.*) 及紅葉蟎屬 (*Tetranychus spp.*)。

使用根據本發明之活性成分可用來控制，也就用於抑制或破壞，尤其發生在植物上，更特別是在農業、園藝和林產上之農作物或觀賞植物上，或在該等植物的部份上，例如水果，花，葉，莖，塊莖或根的所述種類之有害生物，而在某些情況中生長較遲的植物的部份仍可被保護以抗該等有害生物。

所談論之目標農作物包括天然農作物和已被飼育或遺傳的方法改良之農作物，尤其是穀類，例如小麥、大麥、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (42)

裸麥、燕麥、米、玉蜀黍和高粱；甜菜，例如糖甜菜和秣甜菜；水果，例如梨果，核果和漿果，例如蘋果、梨子、李子、桃子、杏仁、櫻桃和草莓類植物，例如草莓、覆盆子和黑莓；豆科植物，例如豆子、扁豆、豌豆和大豆；油脂農作物，例如油菜、芥菜、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻油、可可果和花生；葫蘆科植物，例如南瓜、黃瓜和甜瓜；纖維性植物，例如棉、亞麻、大麻和黃麻；柑橘類水果，例如橘子、檸檬、葡萄柚和桔子；蔬菜類，例如菠菜、萵苣、蘆筍、甘藍菜、紅蘿蔔、洋蔥、蕃茄、馬鈴薯和紅椒；樟科，例如鰐梨、肉桂、樟腦及如煙草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶，胡椒、蔓、蛇麻草、香蕉及天然橡膠植物，和觀賞性植物類。

根據本發明之活性成分別適合於控制昆蟲和蟎目的代表，尤其是在棉花、水果、柑橘類、玉蜀黍、大豆、油菜和蔬菜作物上之植物-毀滅性的飼育昆蟲，例如稻褐飛虱 (*Anthonomus grandis*)，黃瓜條葉甲 (*Diabrotica balteata*)，美洲菸夜蛾 (*Heliothis virescens*) 幼蟲，小夜蛾 (*Plutella xylostella*) 和斜紋夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) 幼蟲和蜘蛛，例如棉紅蜘蛛 (*Tetranychus spp.*)。

根據本發明的活性成份之進一步應用領域為貯存品及儲藏室的保護和原料物質的保護，以及在衛生區域中，尤其是在溫血動物的保護，包括農場上的動物，例如母牛、豬、羊和山羊、家禽，例如母雞、火雞和鵝，為其毛皮的飼養動物，例如貂，狐狸，栗鼠，兔子等等，以及家畜和

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (35)

寵物，例如貓和狗，和甚至人類，抗所述類型之有害生物。

家畜和寵物中的跳蚤感染及有害生物是動物擁有者仍沒有適當解決的問題。由於跳蚤之複雜生命週期，沒有任何已知控制跳蚤的方法是完全令人滿意的，尤其是因為大部份已知的方法主要目的在控制毛皮中完全生長之跳蚤且沒有考慮所有跳蚤的各種幼態階段，其不僅活在動物的外套，也活在地板上，地毯上，在動物睡覺處，在椅子上，在花園和其他被感染動物接觸的所有地方。跳蚤處理是通常貴的且必須持續延長的期間，通常僅在當不只處理被感染的動物，例如狗或貓且同時也施用至常被感染的動物經過的地方才能達到成功。

根據本發明之式(I)化合物可獨自使用或與其他殺生物劑組合使用。例如，為了增強效果，他們可與具有相同作用傾向的除害劑組合或為了增廣活性的範圍，它們可與具有相同作用傾向的物質組合。其中希望擴張活性範圍至內寄生蟲，例如蠕蟲，式(I)化合物有利地與具有殺內寄生蟲性質之物質組合。它們當然也可與抗菌劑組合使用。既然式(I)化合物為殺成體劑 (adulticides)，也就是說它們為尤其有效於對抗目標寄生蟲之完全成長期，添加更有效對抗寄生蟲之未成熟期之除害劑可為非常有利的，因為在此種方式中該寄生蟲群之整個範圍將達到且，此外，可達到一實質貢獻以避免抗性之發展。

根據本發明之式(I)化合物的良好除害活性相當於上述

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (34)

有害生物至少 50-60% 的死亡率。

根據本發明之化合物及包括它們之組成物之對抗動物有害生物之活性可被有效地擴展且適合經由添加其他殺蟲劑及/或殺蟎劑所給定之環境。合適的添加劑包括，例如，下列類別之活性成分的代表：有機磷化合物類，硝基酚類及衍生物，甲脞類，尿素類，氨基甲酸酯類，除蟲菊精，氯化烴類及蘇雲金芽孢桿菌 (*Bacillus thuringiensis*) 製劑。

將式(I)化合物以未改變形式使用或較佳和習知調配物技術的佐劑一起使用及因此可以已知方法例如調配成乳液濃縮物，可直接噴灑或可稀釋的溶液，稀釋乳液，可濕性粉劑，可溶解粉劑，粉劑，顆粒，以及包封於聚合物質中。

該等調配物，也就是該等包含式(I)活性成分之試劑、製劑或組成物，或該活性成分與其他農業化學活性成分和，如適當的話，固體或液態的佐劑的組合，係在已知的方式中製備，例如藉由均勻混合及/或研磨活性成分與填充劑，例如與溶劑，固體載體，和選擇性之表面活性化合物(表面活性劑)和本發明也與其有關。

本發明亦關於該等應用組成物之方法，也就是控制該所提及類型有害生物的方法，例如噴灑、噴霧、撒粉，塗佈、敷料、散佈或注入(依據所需要之目的和盛行的環境選擇)，及用以控制該所提及類型的有害生物之組成物的用途。活性成分之典型濃度比率在 0.1 和 1000 ppm 之間，較佳

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (35)

在 0.1 和 500 ppm 之間。應用的比率通常是每公頃為 1 到 2000 克之活性成分，尤其 10 到 1000 克／公頃，較佳 20 到 600 克／公頃。

在植物保護之範圍應用的較佳方法為應用至植物的葉子上（葉應用），應用的頻率及應用的比率視所討論之害蟲感染的強度而定。然而，經由以液體調配物充滿植物的部位或藉由施用固體形式之活性成分進入土壤，例如，以顆粒形式（土壤應用），該活性成分亦可透過根滲入植物（系統作用）。關於稻米作物，顆粒可被應用在標準量之水稻田。

本發明之農作物保護劑亦適合用來保護植物繁殖物質，例如，種子，如果實，塊莖或穀粒，或植物插條，以避免動物害蟲。該繁殖物質在種植前可以組成物處理：種子，例如，在將被播種前可被包敷。本發明之活性成分亦可應用於種子（包覆），其係經由以液體組成物充滿該種子或經由以固體組成物包覆它們。當該繁殖物質將被種植時，該組成物亦可被給予，例如，當種子被種於種子溝時。植物繁殖物質的處理方法及被處理之植物繁殖物質為本發明之另外目的。

該等調配物，也就是該等包含式(I)活性成分之試劑、製劑或組成物，或該活性成分與其他農業化學活性成分和，如適當的話，固體或液態的佐劑的組合，係在已知的方式中製備，例如藉由均勻混合及／或研磨活性成分與填充劑，例如與溶劑，固體載體，和選擇性之表面活性化合物(

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (36)

表面活性劑)和本發明也與其有關。

當做配方助劑，可使用例如，固體載體、溶劑、安定劑、“緩釋”助劑、染料和選擇性表面活性物質(表面活性劑)。適當的載體和助劑包括所有習用在植物保護組成物的物質。使用於根據本發明組成物中的適當助劑，例如溶劑、固體載體、表面活性化合物、非離子的表面活性劑、陽離子表面活性劑，陰離子表面活性劑和其他助劑，包括例如在 EP-A-736252 中所描述者；其包括於本發明中以供參考。

適當的肥皂為該等鹼金屬鹽，鹼土金屬鹽或可選擇地經取代之高級脂肪酸(C₁₀-C₂₂)的銨鹽(例如油酸或硬脂酸的鈉或鉀鹽，或天然脂肪酸混合物，其可例如從椰子油或高油獲得。也提到脂肪酸甲基牛磺酸鹽當做表面活性劑。

然而，較常使用所謂的合成表面活性劑，尤其是脂肪磺酸鹽，脂肪硫酸鹽，磺酸化苯並咪唑衍生物和烷基芳基磺酸鹽類。

該脂肪磺酸鹽或硫酸鹽通常為鹼金屬鹽，鹼土金屬鹽或未經取代的或經取代之銨鹽的形式且具有 8 至 22 個碳原子之烷基，其亦包括醯基之烷基部分，例如，木質磺酸之鈉鹽或鈣鹽，十二基硫酸鹽之鈉鹽或鈣鹽或獲得自天然脂肪酸之脂肪醇硫酸鹽之混合物之鈉鹽或鈣鹽。這些化合物亦包括硫酸酯類之鹽及脂肪醇／環氧乙烷加合物之磺酸類。該磺酸化苯並咪唑衍生物較佳地包含 2 個磺酸基團及一個含 8-22 個碳原子之脂肪酸基。烷基醯基磺酸鹽之實例為

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(2)

十二烷苯磺酸，二丁基萘磺酸之鈉鹽，鈣鹽或三乙醇胺鹽，或萘磺酸／甲醛縮合產物之鈉鹽，鈣鹽或三乙醇胺鹽。亦合適的為相對應磷酸鹽，例如，具有 4 至 14 莫耳環氧乙烷或磷脂類之對-壬基酚之加合物之磷酸酯之鹽。

式(I)化合物之特別優良係由於其對於阻抗跳蚤具有極佳的活性，其不僅可迅速地撲滅跳蚤成蟲，亦可利用循環途徑撲滅跳蚤的幼態階段。跳蚤幼蟲由跳蚤卵中孵出且主要地餵食以跳蚤成蟲的分泌物。由於根據本發明式(I)化合物可極快速地撲滅跳蚤成蟲，在缺乏所必需之分泌物後阻隔了幼態階段的營養介質，因此在達到成蟲階段之前即死亡。

因此本發明較佳地係有關於一種控制在人類、家畜、生產性家畜和寵物身上寄生蟲的方法，其中包含系統性或較佳為局部性地對溫血動物投予有效數量之包含至少一種式(I)化合物或其生理上可接受的鹽之組成物。

長時效作用可藉由不同形式地投予根據本發明式(I)化合物而達到，例如藉由經內部或外部調配形式投予活性成份至欲治療之動物。在此情況下『經調配』表示例如於粉末、錠劑或顆粒的形式，於脂質體或膠囊中、乳化液的形式、泡沫體或噴霧液、在微囊物或在傾倒式或塗抹式的形式。當然，所有可口服給藥的組成物，除了包含習用的調配物賦形劑之外，亦進一步包含可鼓勵寄主動物自願口服該組成物的添加劑，例如增味劑和調味劑和味覺物質。

經由皮給藥，例如藉由皮下或肌肉內注射或為植入物

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(38)

形式的滲入劑製劑，及局部施用，例如傾倒式或塗抹式的形式，表示本發明較佳的標的物可簡易地施用。進一步的給藥模式為口服給藥，例如為錠劑形式。經皮和局部的給藥形式為特別令人注重者且可得到極佳的結果。

經皮形式之給藥例如包括皮下，肌肉內和甚至靜脈內給藥的可注射形式。除了使用習用的針頭注射器，其亦可能使用無針頭的高壓注射器裝置。

傾倒式和塗抹式調配物為特別佳的局部給藥形式。但使用噴霧，油膏，溶液或粉末的形式給藥亦為合宜者。

藉由選擇適當調配物，其亦可能提高活性成份滲入寄主動物的活組織內及維持它的可利用性之能力。重要者為，例如當使用極難溶解活性成份時，它的低溶解度致使需要有提高溶解度的方法，因為在此種情況下動物體液一次僅能溶解少量的活性成份。

再者，為了得到活性成份之強緩釋性，根據本發明式(I)化合物可存在於基質調配物中，其可物理性地避免活性成份過早地釋出和分泌且可維持活性成份的生物利用性。此種基質調配物可例如經用肌肉內或皮下而注射至體內，而且以滲入劑形式保持於其中使活性成份由其連續地釋出。此種基質調配物係為熟於此藝者所習知者。它們通常為蠟狀、半固態物質，例如具有高分子量的植物蠟和聚乙二醇類，或為固態聚合物調配物，例如俗稱的微球。

活性成份由植入物釋出的速率且該植入物顯示出作用的時間期限的決定通常基於植入物經校準（活性成份在植

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (39)

入物中的數量)的準確度，植入物附近的周圍環境及製成植入物的聚合物調配物。

以動物食物內給藥之獸醫藥物為於動物保健的領域中已知者。通常其係先製備出一種俗稱為預混物(premix)者，其中活性成份分散於液體內或於固態載體中細分形式存在。該種預混物通常為每公斤預混物可包含大約 1 至 800 毫克的化合物，視飼料中所需要的最終濃度而定。

因為根據本發明的式(I)化合物會因為飼料的成份而水解，所以它們應在加至預混物之前調配在一個保護性基質中，例如在明膠中。

本發明依此亦有關於將已受保護免於水解的式(I)化合物與飼料一起給藥至寄主動物而控制寄生蟲的範圍。

根據本發明之式(I)化合物有利給藥於 0.01 至 800 毫克／公斤的劑量，較佳 0.1 至 200 毫克／公斤，尤其是 0.5 至 30 毫克／公斤，以寄主動物體重為基準。

可規則性給藥至寄主動物的良好劑量為由 0.5 至 100 毫克／公斤，特別是由 0.1 至 40 毫克／公斤體重。有效給藥的適當期間係依給藥模式和體重而定。

對相同活性成份的總劑量會依不同種類動物亦及在該種類動物之內而定，此係因為其特別依據寄主動物的重量，年齡和體質而定。

當根據本發明使用時，根據本發明的式(I)化合物通常並非以純形式，而較佳為組成物形式給藥，該組成物除了包含活性成份之外亦包含有助於給藥的組成，寄主動物可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明（ ψ ）

耐受的適當組成。當然，其除了根據本發明控制寄生蟲成蟲之外，亦使用於習知方法中以控制跳蚤的幼態階段，但後者並非絕對地必要。

此種欲投予的本發明組成物通常包含由 0.1 至 99 重量%，尤其由 0.1 至 95 重量%之根據本發明的式(I)化合物，及由 99.9 至 1 重量%，尤其由 99.9 至 5 重量%之固態或液態之生理上可接受載體，更包括由 0 至 25 重量%，尤其由 0.1 至 25 重量%之非毒性分散劑。

雖然商業產物較佳為調配成濃縮液，消費者仍通常使用稀釋的調配物。

該等調配物亦可能包含進一步的輔助劑，例如穩定劑，抗發泡劑，黏度調整劑，黏合劑和增黏劑，以及其他可得到特別效果的活性成份。

在獸醫醫藥實務上使用於口服，經皮和局部給藥的習用生理上可忍受性載體可使用為調配物輔助劑。一些例子將示於下文中。

適當的載體尤其為填充劑，例如糖類如乳糖，蔗糖，甘露醇或山梨糖醇，纖維素製劑及／或磷酸鈣如磷酸三鈣或磷酸氫鈣，和黏合劑，例如使用如玉蜀黍，小麥，米或馬鈴薯澱粉的澱粉糊，明膠，黃蓍膠，甲基纖維素及／或如果需要時的崩散劑，例如上述的澱粉，亦及羧基甲基澱粉，經交聯的聚乙烯基吡咯烷酮，瓊脂，藻酸或其鹽，例如藻酸鈉。佐劑尤其為流體調整劑和潤滑劑，例如矽酸，滑石，硬脂酸或其鹽，例如硬脂酸鎂或鈣，及／或聚乙二

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (ㄔ)

醇。糖衣核心可適當具有塗覆物且選擇性為腸衣式，其中所使用者特別為濃縮的糖溶液且包含阿拉伯膠，滑石，聚乙炔基吡咯烷酮，聚乙二醇及／或二氧化鈦，或具有在適當有機溶劑或溶劑混合物中的塗覆溶液，或用於製備腸衣塗覆物，適當纖維素製劑之溶液，例如為乙醯纖維素鄰苯二甲酸酯或羥基丙基甲基纖維素鄰苯二甲酸酯。染料，調味劑或顏料可加至錠劑或糖衣核心塗覆物中，例如為了識別目的或指示活性成份的不同劑量。

其他可口服給藥製劑為硬明膠膠囊及軟式密封膠囊，其等係由明膠和增塑劑，例如甘油或山梨醇製成。硬明膠膠囊可包含顆粒形式的活性成份，例如摻和填充劑，例如乳糖，黏合劑如澱粉，及／或滑動劑如滑石或硬脂酸鎂，及若需要之穩定劑。在軟膠囊中，活性成份較佳為溶解或懸浮在適當的液體中，例如脂肪基油類，石蠟油或液態聚乙二醇類，於其中同樣可加入穩定劑。較佳者特別為易於咬食或無需經由咀嚼而吞食的膠囊。

傾倒式或塗抹式方法包含將式(I)化合物施用至皮膚或毛皮的局部限定區域，有利者為在動物的頸背部或脊椎。其施用可藉由利用刷子或噴霧器將傾倒式或塗抹式調配物加至毛皮的相當小區域上，藉助於動物活動，該活性成份可於其中近似自動地作用至毛皮的較大區域造成調配物組成的擴展。

傾倒式和塗抹式調配物有利地包含之載體有助於迅速作用至寄主動物皮膚表面上和毛皮內，且通常為擴散的油

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明（42）

狀體。適當者例如為油性溶液；酒精性和異丙醇性溶液，例如 2-辛基十二烷基醇或油基醇的溶液；在單羧酸酯類中的溶液，例如異丙基肉豆蔻酸酯，異丙基棕櫚酸酯，月桂酸草酸酯，油酸油烯基酯，油酸癸基酯，己基月桂酸酯，油烯基油酸酯，癸基油酸酯，鏈長度為 C₁₂-C₁₈ 飽和脂肪醇的己酸酯類；二羧酸酯類的溶液，例如鄰苯二甲酸二丁基酯，間苯二甲酸二異丙基酯，己二酸二異丙基酯，二-正丁基己二酸酯，或脂肪酸酯類的溶液，例如二醇類。其亦可有利地存有醫藥品或化妝品工業中所習用的分散劑。例子有吡咯烷-2-酮，N-烷基吡咯烷-2-酮，丙酮，聚乙二醇和其醚類與酯類，丙二醇或合成的三甘油酯。

油性溶液包括例如植物油類如橄欖油，花生油，芝麻油，松油，亞麻子油和蓖麻油。植物油類亦可為環氧化形式。其亦可能使用石蠟和聚矽氧烷油類。

通常傾倒式或塗抹式調配物含有由 1 至 20 重量%之式 (I) 化合物，由 0.1 至 50 重量%之分散劑，及由 45 至 98.9 重量%之溶劑。

傾倒式和塗抹式方法可特別有利地使用至以口服或注射治療所有動物為不易或費時的群聚動物，例如牛群，馬匹，羊和豬。為了簡化之故，此方法當然亦可使用於所有的其他動物，包括個別的家畜和寵物，而且特別受到動物飼養者歡迎，因為該方法的施行通常無需獸醫外科醫生的專門協助。

適用為非經腸及經皮給藥者為油性注射溶液或懸浮液

五、發明說明（ㄅ）

，其係使用適當的親脂性溶劑或媒劑，例如脂肪油類如芝麻油，或合成的脂肪酸酯類如油酸乙基酯，或三甘油酯，或水性注射溶液或懸浮液，其包含增加黏度的物質如羧基甲基纖維素鈉，山梨醣醇及／或葡聚糖，及選擇性的穩定劑。

本發明組成物亦可使用本身習知的方式製備，例如利用習用的混合，粒化，成型，溶解或冷凍乾燥方法。例如，用於口服給藥的醫藥製劑可藉由合併活性成份和固態載體，再選擇性地粒化所得的混合物，且若有必要或需求時可在加入適當賦形劑之後加工該混合物或顆粒而形成錠劑或糖衣核心。

下列實施例只用以舉例說明本發明且不限於本發明。

較佳調配物尤其具有下列組成物（％＝重量百分比）：

可乳化濃縮液：

活性成分：1 到 90％，較佳 5 到 20％

表面活性劑：1 到 30％，較佳 10 到 20％

液態載體：5 到 94％，較佳 70 到 85％

粉劑：

活性成分：0.1 到 10％，較佳 0.1 到 1％

固體載體：99.9 到 90％，較佳 99.9 到 99％

懸浮濃縮液：

活性成分：5 到 75％，較佳 10 到 50％

五、發明說明 (ㄅㄅ)

水：94 到 24%，較佳 88 到 30%

表面活性劑：1 到 40%，較佳 2 到 30%

可溼性粉末：

活性成分：0.5 到 90%，較佳 1 到 80%

表面活性劑：0.5 到 20%，較佳 1 到 15%

固體載體：5 到 95%，較佳 15 到 90%

粒劑：

活性成分：0.5 到 30%，較佳 3 到 15%

固體載體：99.5 到 70%，較佳 97 到 85%

注射溶液：

活性成分：0.1 到 10%，較佳 0.5 到 5%

非離子性表面活性劑：0.1 到 30%，較佳 0.5 到 10%

乙醇和丙二醇的混合物：60 到 99%，較佳 85 到 90%

注射懸浮液(水性或油性)：

活性成分：0.1 到 20%，較佳 1 到 10%

非離子性表面活性劑：0.1 到 20%，較佳 1% 到 10%

水或植物油：60 到 99%，較佳 85 到 95%

該等組成物也可包含進一步的成分，例如安定劑，例如，其中合適的環氧化植物油類（環氧化椰子油、油菜籽油或大豆油）、抗發泡劑，典型的矽酮油、防腐劑、黏度

五、發明說明 (45)

調整劑，黏合劑及增稠劑和肥料或獲得特別效果的其他活性成分。

下列實施例舉例說明上述的本發明，但不以任何方式限制其範圍。溫度為攝氏度。

1.合成實施例

P1.2：2,6-二氟苯基-benzamidinium 氯化物

將 17.4 克第三丁基次氯酸鹽逐滴加入於 200 毫升二氯甲烷之 26.1 克 2,6-二氟苯甲醛肟溶液，以此方式溫度可保持在 20°C。在一小時後，該反應混合物被緩慢第逐滴加入 100 毫升飽和甲醇氨溶液中。在又一小時後，倒入水，在真空下濃縮，且該獲得之結晶沉澱物被過濾及乾燥。

該於 220 毫升函氫氯酸之乙醇中獲得之羥肟酸醯胺在 3 巴及 60°C，9 克 Raney 鎳下氫化。在過濾，在真空下濃縮及自乙醚再結晶後，可獲得具有熔點>250°C之標題化合物。

P1.2：2-(4-溴苯基)-1-二甲基胺基-3-二甲基 immonio 丙烯高氯酸鹽

將 32 毫升三氯氧化磷在 10-15°C 下，良好冷卻及激烈攪拌下，逐滴加入 45 毫升二甲基甲醯胺中。隨後，於-10°C 下，以數份加入 25 克醋酸 4-溴苯酯，且該反應混合物在室溫下攪拌 1 小時，然後在 60°C 下攪拌 2 小時且最後在 80°C 下攪拌 5 小時。然後該混合物在 0°C 下被小心地以 20 毫

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (46)

升水水解，且該產物藉由添加 35 毫升 70%高氯酸沉澱。在過濾及自丙酮/乙醚中再結晶後，可獲得無色結晶形式之具有熔點 160°C之標題化合物。

P1.3：5-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-嘧啶

10.0 克 2,6-二氟苯基 benzamidinium 氯化物及於 150 毫升甲醇中之 19.0 克 2-(4-溴苯基)-1-二甲基胺基-3-二甲基 immonio 丙烯高氯酸鹽之懸浮液與 9.5 毫升於甲醇中之 5.4 莫耳 NaOMe 溶液混合及在回流下加熱 16 小時。該經冷卻反應混合物隨後倒入水中且過濾該結晶無色沉澱物。在高度真空下乾燥後，可獲得具有熔點 193-194°C之標題化合物。

P1.4：2-(2,6-二氟苯基)-5-(4'-三氟甲氧基聯苯基-4-基)-嘧啶

將 0.70 克 5-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-嘧啶，0.53 克 4-三氟甲氧基苯基-硼酸及 0.07 克醋酸鈮 (II)在回流下，在氮氣下，於 20 毫升二甲氧基乙烷及 20 毫升飽和碳酸鉀水溶液之混合物中加熱 1?小時。然後將該反應混合物冷卻，以水稀釋及過濾結晶沉澱物。在於醋酸乙酯中溶解沉澱物，以硫酸鎂乾燥，過濾及濃縮後，可得到淡黃色結晶形式之具有熔點 215-216°C之標題化合物。

P1.5：4-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-嘧啶

五、發明說明 (41)

將 10.0 克 2,6-二氟苯基 benzamidinium 氯化物及於 100 毫升乙醇中之 10.4 克 1-(4-溴苯基)-3-二甲基胺基丙烯之懸浮液與 6.7 克固態第三丁基鉀混合及在回流下加熱 16 小時。該經冷卻反應混合物隨後倒入水中且過濾該結晶沉澱物。在自乙醚/己烷中再結晶後，可獲得具有熔點 130-131°C 之標題化合物。

P1.6 : 2-(2,6-二氟苯基)-4-(4'-三氟甲基聯苯基-4-基)-嘧啶

將 0.70 克 5-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-嘧啶，0.42 克 4-三氟甲氧基苯基-硼酸及 0.07 克醋酸鈮(II)在回流下，在氮氣下，於 20 毫升二甲氧基乙烷及 20 毫升飽和碳酸鉀水溶液之混合物中加熱 1 小時。然後將該反應混合物冷卻，以水稀釋及過濾結晶沉澱物。在於醋酸乙酯中溶解沉澱物，以硫酸鎂乾燥，過濾及濃縮後，可得到淡黃色結晶形式之具有熔點 141-142°C 之標題化合物。

P1.7 : 4-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-羥基嘧啶

將 750 毫升甲苯，24.0 克 2,6-二氟苯基-benzamidinium 氯化物及 31.9 克 2-(4-溴苯基)-3-羥基丙烯酸乙基酯之懸浮液與 12.6 克三乙胺及 0.5 克對-甲苯磺酸混合，且在回流下加熱 7 小時。該經冷卻反應混合物以水萃取及蒸發溶劑。在於醋酸乙酯中溶解沉澱物，以硫酸鎂乾燥，過濾及濃縮後，可得到具有熔點 >250°C 之標題化合物(

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (48)

化合物 3.356)。

P1.8 : 4-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-3-氮嘧啶

將 23.2 克 4-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-3-羥基嘧啶及 100 毫升 POCl₃ 在 100℃ 下混合及攪拌一小時。將該反應混合物緩慢地加倒入 250 克於水中 NaOH(固體)之溶液中，及過濾。在於醋酸乙酯中溶解沉澱物，以硫酸鎂乾燥，過濾及濃縮後，可得到具有熔點 146-148℃ 之標題化合物(化合物 3.354)。

P1.9 : 4-(4-溴苯基)-3-氰基-2-(2,6-二氟苯基)-嘧啶

將 6 克 4-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-3-氮嘧啶，80 毫升二甲基甲醯胺，1.53 克 KCN 及 0.93 克甲苯亞磺酸鈉一起混合，在 80℃ 下攪拌 3 小時，與冰水混合及過濾。在於醋酸乙酯中溶解沉澱物，以硫酸鎂乾燥，過濾及濃縮後，可得到具有熔點 146-148℃ 之標題化合物(化合物 3.355)。

P1.10 : 6 克 4-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基嘧啶

將 6 克 4-(4-溴苯基)-2-(2,6-二氟苯基)-3-氮嘧啶，60 毫升甲醇及 3.3 克甲醇鈉甲醇鹽溶液 (methanolic sodium methanolate solution) (30%) 在回流下沸騰 24 小時，藉由蒸發濃縮，且該殘餘物溶解於醋酸乙酯中及該有機相以水

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

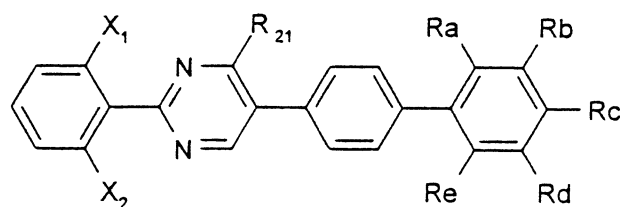
線

五、發明說明 (49)

洗滌。在以硫酸鎂乾燥後，過濾及濃縮，可得到具有熔點 104-106°C 之標題化合物(化合物 3.350)。

可以類似實施例 P1.1 至 P1.10 所描述之方法生產於下列表中所指名之物質。

表 1：下式化合物



號碼	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _b	R _c	R _d	R _e	熔點(°C)
1.1	F	F	H	H	Cl	F	H	H	218-220
1.2	F	F	H	H	H	CF ₃	H	H	252-254
1.3	Cl	Cl	H	H	H	CF ₃	H	H	207-208
1.4	Cl	Cl	H	H	H	OCF ₃	H	H	179-181
1.5	Cl	Cl	H	H	Cl	F	H	H	200-202
1.6	Cl	Cl	H	H	Cl	Cl	H	H	224-226
1.7	Cl	Cl	H	H	H	OCH ₃	H	H	242-244
1.8	Cl	Cl	H	H	H	Cl	H	H	205-220
1.9	Cl	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	>220
1.10	Cl	Cl	H	H	H	第三丁基	H	H	200-202
1.11	Cl	F	H	H	Cl	F	H	H	186-189
1.12	Cl	F	H	H	H	OCF ₃	H	H	160-163
1.13	Cl	F	H	H	Cl	Cl	H	H	196-199
1.14	Cl	F	H	H	CF ₃	H	H	H	187-190
1.15	Cl	F	H	H	H	OCH ₃	H	H	176-179
1.16	Cl	F	H	H	Cl	H	Cl	H	215-218
1.17	Cl	F	H	H	H	CF ₃	H	H	218-221
1.18	F	F	H	H	CF ₃	H	H	H	217-218

五、發明說明(5)

1.19	F	F	H	H	H	OCF ₃	H	H	215-216
1.20	F	F	H	OCH ₃	H	H	H	H	150-151
1.21	F	F	H	H	Cl	H	Cl	H	230-231
1.22	F	F	H	H	H	苯基	H	H	>260
1.23	F	F	H	H	H	F	H	H	212-213
1.24	F	F	H	CF ₃	H	H	H	H	100-102
1.25	F	F	H	H	H	Cl	H	H	220-222
1.26	F	F	CN	H	H	OCF ₃	H	H	180-182
1.27	F	F	CN	H	H	CF ₃	H	H	199-201
1.28	F	F	CN	H	Cl	H	Cl	H	244-246
1.29	F	F	OCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	158-160
1.30	F	F	OCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	176-178
1.31	F	F	OCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	171-173
1.32	F	F	NHCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	196-197
1.33	F	F	NHCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	214-216
1.34	F	F	NHCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	270-272
1.35	F	F	SCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	173-175
1.36	F	F	Cl	H	H	OCF ₃	H	H	177-179
1.37	F	F	H	H	Cl	H	H	H	178-179
1.38	F	F	CN	H	H	OCF ₃	H	H	180-182
1.39	F	F	OCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	158-160
1.40	F	F	OCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	176-178
1.41	F	F	OCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	171-173
1.42	F	F	CN	H	H	CF ₃	H	H	199-201
1.43	F	F	CN	H	Cl	H	Cl	H	244-246
1.44	F	F	NHCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	196-197
1.45	F	F	NHCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	214-216
1.46	F	F	NHCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	270-272
1.47	F	F	H	H	H	SCF ₃	H	H	
1.48	F	F	H	H	H	SOCF ₃	H	H	
1.49	F	F	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	H	
1.50	F	Cl	H	H	H	SCF ₃	H	H	
1.51	F	Cl	H	H	H	SOCF ₃	H	H	
1.52	F	Cl	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	H	
1.53	Cl	Cl	H	H	H	SCF ₃	H	H	
1.54	Cl	Cl	H	H	H	SOCF ₃	H	H	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

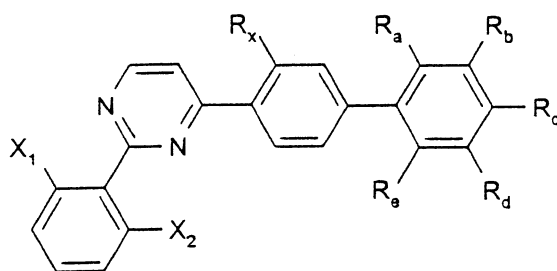
訂

線

五、發明說明(51)

1.55	Cl	Cl	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	H	
1.56	F	F	Cl	H	H	OCF ₃	H	H	177-179
1.57	F	F	-SCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	173-175
1.58	F	F	-OC ₂ H ₅	H	H	OCF ₃	H	H	146-147
1.59	F	F	-OC ₂ H ₅	H	H	CF ₃	H	H	170-172
1.60	F	F	-OC ₂ H ₅	H	Cl	H	Cl	H	154-155
1.61	F	F	-O-異丙基	H	H	OCF ₃	H	H	128-129
1.62	F	F	-NH-環丙基	H	H	OCF ₃	H	H	163-164
1.63	F	F	-O-異丙基	H	H	CF ₃	H	H	159-160
1.64	F	F	-O-異丙基	H	Cl	H	Cl	H	143-144
1.65	F	F	-NH-環丙基	H	H	CF ₃	H	H	187-188
1.66	F	F	-NH-環丙基	H	Cl	H	Cl	H	172-173
1.67	F	F	-NHC ₂ H ₅	H	H	CF ₃	H	H	189-190
1.68	F	F	-NHC ₂ H ₅	H	Cl	H	Cl	H	202-203
1.69	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	H	OCF ₃	H	H	146-147
1.70	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	H	CF ₃	H	H	166-168
1.71	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	Cl	H	Cl	H	200-202
1.72	F	F	-SC ₂ H ₅	H	H	OCF ₃	H	H	127-128
1.73	F	F	-SC ₂ H ₅	H	H	CF ₃	H	H	145-146
1.74	F	F	-SC ₂ H ₅	H	Cl	H	Cl	H	154-156

表 2：下式化合物



號碼	X ₁	X ₂	R _x	R _a	R _b	R _c	R _d	R _e	熔點(°C)
2.1	F	F	H	H	Cl	F	H	H	133-134
2.2	F	F	H	H	H	CF ₃	H	H	141-142
2.3	F	F	H	H	H	OCF ₃	H	H	102-103

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

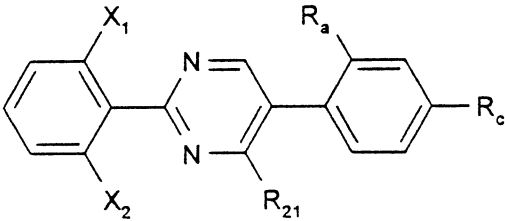
訂

線

五、發明說明 (52)

2.4	F	F	H	H	CF ₃	H	H	H	114-115
2.5	F	F	H	H	Cl	H	Cl	H	116-126
2.6	F	F	H	H	Cl	Cl	H	H	134-140
2.7	F	F	H	H	H	苯基	H	H	258-259
2.8	F	F	H	H	H	F	H	H	145-146
2.9	F	F	H	Cl	H	Cl	H	H	86-87
2.10	F	F	H	H	Cl	H	H	H	82-83
2.11	F	F	H	H	H	Cl	H	H	167-168
2.12	F	F	H	CF ₃	H	H	H	H	179-180

表 3：下式化合物



號碼	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理數據
3.1	F	F	H	CH ₃	4-F-Ph	
3.2	F	F	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
3.3	F	F	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.4	F	F	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.5	F	F	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.6	F	F	H	CH ₃	4-第三丁基-Ph	
3.7	F	F	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.8	F	F	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.9	F	F	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.10	F	F	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.11	F	F	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.12	F	F	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.13	F	F	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
3.14	F	F	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.15	F	F	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	

五、發明說明(5)

3.16	F	F	H	CH ₃	4-Br
3.17	F	F	H	OCH ₃	4-F-Ph
3.18	F	F	H	OCH ₃	4-Cl-Ph
3.19	F	F	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.20	F	F	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.21	F	F	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.22	F	F	H	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
3.23	F	F	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.24	F	F	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.25	F	F	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.26	F	F	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.27	F	F	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.28	F	F	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.29	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-Ph
3.30	F	F	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.31	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.32	F	F	H	CF ₃	4-F-Ph
3.33	F	F	H	CF ₃	4-Cl-Ph
3.34	F	F	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
3.35	F	F	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
3.36	F	F	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.37	F	F	H	CF ₃	4-第三丁基-Ph
3.38	F	F	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.39	F	F	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.40	F	F	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
3.41	F	F	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.42	F	F	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.43	F	F	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.44	F	F	H	CF ₃	3-Cl-Ph
3.45	F	F	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.46	F	F	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.47	F	F	CH ₃	H	4-F-Ph
3.48	F	F	CH ₃	H	4-Cl-Ph
3.49	F	F	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph
3.50	F	F	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph
3.51	F	F	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (54)

3.52	F	F	CH ₃	H	4-第三丁基-Ph
3.53	F	F	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph
3.54	F	F	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph
3.55	F	F	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph
3.56	F	F	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph
3.57	F	F	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph
3.58	F	F	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph
3.59	F	F	CH ₃	H	3-Cl-Ph
3.60	F	F	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph
3.61	F	F	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph
3.62	F	F	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph
3.63	F	F	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph
3.64	F	F	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.65	F	F	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.66	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.67	F	F	CH ₃	CH ₃	4-第三丁基-Ph
3.68	F	F	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.69	F	F	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.70	F	F	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.71	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.72	F	F	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.73	F	F	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.74	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph
3.75	F	F	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.76	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.77	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph
3.78	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph
3.79	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.80	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.81	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.82	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
3.83	F	F	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.84	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.85	F	F	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.86	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.87	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (5)

3.88	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.89	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph
3.90	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.91	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.92	F	F	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph
3.93	F	F	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph
3.94	F	F	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
3.95	F	F	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
3.96	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.97	F	F	CH ₃	CF ₃	4-第三丁基-Ph
3.98	F	F	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.99	F	F	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.100	F	F	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
3.101	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.102	F	F	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.103	F	F	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.104	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph
3.105	F	F	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.106	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.107	F	Cl	H	H	4-F-Ph
3.108	F	Cl	H	H	4-Cl-Ph
3.109	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph
3.110	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph
3.111	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph
3.112	F	Cl	H	H	4-第三丁基-Ph
3.113	F	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph
3.114	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph
3.115	F	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph
3.116	F	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph
3.117	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph
3.118	F	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph
3.119	F	Cl	H	H	3-Cl-Ph
3.120	F	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph
3.121	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph
3.122	F	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph
3.123	F	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (56)

3.124	F	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.125	F	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.126	F	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.127	F	Cl	H	CH ₃	4-第三丁基-Ph
3.128	F	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.129	F	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.130	F	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.131	F	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.132	F	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.133	F	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.134	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph
3.135	F	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.136	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.137	F	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph
3.138	F	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph
3.139	F	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.140	F	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.141	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.142	F	Cl	H	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
3.143	F	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.144	F	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.145	F	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.146	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.147	F	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.148	F	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.149	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph
3.150	F	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.151	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.152	F	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph
3.153	F	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph
3.154	F	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
3.155	F	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
3.156	F	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.157	F	Cl	H	CF ₃	4-第三丁基-Ph
3.158	F	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.159	F	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (51)

3.160	F	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
3.161	F	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.162	F	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.163	F	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.164	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph
3.165	F	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.166	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.167	F	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph
3.168	F	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph
3.169	F	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph
3.170	F	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph
3.171	F	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph
3.172	F	Cl	CH ₃	H	4-第三丁基-Ph
3.173	F	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph
3.174	F	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph
3.175	F	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph
3.176	F	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph
3.177	F	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph
3.178	F	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph
3.179	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph
3.180	F	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph
3.181	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph
3.182	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph
3.183	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph
3.184	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.185	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.186	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.187	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-第三丁基-Ph
3.188	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.189	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.190	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.191	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.192	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.193	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.194	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph
3.195	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(58)

3.196	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.197	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph
3.198	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph
3.199	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.200	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.201	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.202	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
3.203	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.204	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.205	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.206	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.207	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.208	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.209	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph
3.210	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.211	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.212	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph
3.213	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph
3.214	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
3.215	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
3.216	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.217	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-第三丁基-Ph
3.218	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.219	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.220	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
3.221	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.222	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.223	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.224	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph
3.225	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.226	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.227	Cl	Cl	H	H	4-F-Ph
3.228	Cl	Cl	H	H	4-Cl-Ph
3.229	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph
3.230	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph
3.231	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (59)

3.232	Cl	Cl	H	H	4-第三丁基-Ph
3.233	Cl	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph
3.234	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph
3.235	Cl	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph
3.236	Cl	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph
3.237	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph
3.238	Cl	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph
3.239	Cl	Cl	H	H	3-Cl-Ph
3.240	Cl	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph
3.241	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph
3.242	Cl	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph
3.243	Cl	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph
3.244	Cl	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.245	Cl	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.246	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.247	Cl	Cl	H	CH ₃	4-第三丁基-Ph
3.248	Cl	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.249	Cl	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.250	Cl	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.251	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.252	Cl	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.253	Cl	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.254	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph
3.255	Cl	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.256	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.257	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph
3.258	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph
3.259	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.260	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.261	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.262	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
3.263	Cl	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.264	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.265	Cl	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.266	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.267	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (60)

3.268	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.269	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph
3.270	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.271	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.272	Cl	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph
3.273	Cl	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph
3.274	Cl	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
3.275	Cl	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
3.276	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.277	Cl	Cl	H	CF ₃	4-第三丁基-Ph
3.278	Cl	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.279	Cl	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.280	Cl	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
3.281	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.282	Cl	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.283	Cl	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.284	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph
3.285	Cl	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.286	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.287	Cl	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph
3.288	Cl	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph
3.289	Cl	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph
3.290	Cl	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph
3.291	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph
3.292	Cl	Cl	CH ₃	H	4-第三丁基-Ph
3.293	Cl	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph
3.294	Cl	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph
3.295	Cl	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph
3.296	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph
3.297	Cl	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph
3.298	Cl	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph
3.299	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph
3.300	Cl	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph
3.301	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph
3.302	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph
3.303	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (61)

3.304	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.305	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.306	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.307	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-第三丁基-Ph
3.308	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.309	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.310	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.311	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.312	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.313	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.314	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph
3.315	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.316	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.317	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph
3.318	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph
3.319	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
3.320	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
3.321	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.322	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
3.323	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.324	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
3.325	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
3.326	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
3.327	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
3.328	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
3.329	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph
3.330	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
3.331	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
3.332	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph
3.333	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph
3.334	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
3.335	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
3.336	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
3.337	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-第三丁基-Ph
3.338	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
3.339	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph

五、發明說明 (62)

3.340	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.341	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.342	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.343	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.344	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
3.345	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.346	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.347	F	F	SCH ₃	H	Br	141-142°C
3.348	F	F	OCH ₃	H	Br	103-105°C
3.349	F	F	Cl	H	Br	146-148°C
3.350	F	F	CN	H	Br	148-150°C
3.351	F	F	OH	H	Br	>250°C
3.352	F	F	NH-CH ₃	H	Br	181-183°C
3.353	F	F	H	H	4-F-苯氧基	
3.354	F	F	H	H	3-CF ₃ -苯氧基	
3.355	F	F	H	H	4-CF ₃ -苯氧基	
3.356	F	F	H	H	4-OCF ₃ -苯氧基	
3.357	F	F	H	H	4-第三丁基-苯氧基	
3.358	F	F	H	H	3,5-Cl ₂ -苯氧基	
3.359	F	F	H	H	4-SCH ₃ -苯氧基	
3.360	F	F	H	H	3-Cl-4-F-苯氧基	
3.361	F	F	H	H	4-SCF ₃ -苯氧基	
3.362	F	Cl	H	H	4-F-苯氧基	
3.363	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -苯氧基	
3.364	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -苯氧基	
3.365	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -苯氧基	
3.366	F	Cl	H	H	4-第三丁基-苯氧基	
3.367	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -苯氧基	
3.368	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -苯氧基	
3.369	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-苯氧基	
3.370	F	Cl	H	H	4-SCF ₃ -苯氧基	
3.371	Cl	Cl	H	H	4-F-苯氧基	
3.372	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -苯氧基	
3.373	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -苯氧基	
3.374	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -苯氧基	
3.375	Cl	Cl	H	H	4-第三丁基-苯氧基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (67)

3.376	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -苯氧基	
3.377	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -苯氧基	
3.378	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-苯氧基	
3.379	Cl	Cl	H	H	4-SCF ₃ -苯氧基	
3.380	F	F	H	H	4-F-苯基胺基	
3.381	F	F	H	H	3-CF ₃ -苯基胺基	
3.382	F	F	H	H	4-CF ₃ -苯基胺基	
3.383	F	F	H	H	4-OCF ₃ -苯基胺基	
3.384	F	F	H	H	4-第三丁基-苯基胺基	
3.385	F	F	H	H	3,5-Cl ₂ -苯基胺基	
3.386	F	F	H	H	4-SCH ₃ -苯基胺基	
3.387	F	F	H	H	3-Cl-4-F-苯基胺基	
3.388	F	F	H	H	4-SCF ₃ -苯基胺基	
3.389	F	Cl	H	H	4-F-苯基胺基	
3.390	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -苯基胺基	
3.391	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -苯基胺基	
3.392	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -苯基胺基	
3.393	F	Cl	H	H	4-第三丁基-苯基胺基	
3.394	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -苯基胺基	
3.395	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -苯基胺基	
3.396	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-苯基胺基	
3.397	F	Cl	H	H	4-SCF ₃ -苯基胺基	
3.398	Cl	Cl	H	H	4-F-苯基胺基	
3.399	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -苯基胺基	
3.400	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -苯基胺基	
3.401	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -苯基胺基	
3.402	Cl	Cl	H	H	4-第三丁基-苯基胺基	
3.403	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -苯基胺基	
3.404	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -苯基胺基	
3.405	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-苯基胺基	
3.406	Cl	Cl	H	H	4-SCF ₃ -苯基胺基	
3.407	F	F	-OC ₂ H ₅	H	Br	111-113
3.408	F	F	-OCH ₂ CCH	H	Br	140-142
3.409	F	F	-O-異丙基	H	Br	130-132
3.410	F	F	-NH-環丙基	H	Br	136-138
3.411	F	F	-NHC ₂ H ₅	H	Br	207-209

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

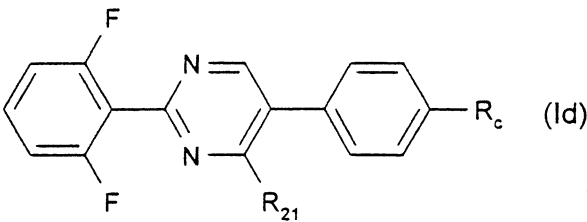
訂

線

五、發明說明 (64)

3.412	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	Br	236-238
3.413	F	F	-SCH ₃	H	Br	141-142
3.414	F	F	-NHCH ₂ CCH	H	Br	168-171
3.415	F	F	-SC ₂ H ₅	H	Br	138-140
3.416	F	F	-SH	H	Br	222-224

表 3A：下式化合物



號碼	R _c
3A.1	4-F-Ph
3A.2	4-Cl-Ph
3A.3	3-CF ₃ -Ph
3A.4	4-CF ₃ -Ph
3A.5	4-OCF ₃ -Ph
3A.6	4-第三丁基-Ph
3A.7	2,4-Cl ₂ -Ph
3A.8	3,5-Cl ₂ -Ph
3A.9	2-CF ₃ -Ph
3A.10	4-OCH ₃ -Ph
3A.11	4-SCH ₃ -Ph
3A.12	3-OCH ₃ -Ph
3A.13	3-Cl-Ph
3A.14	3,4-Cl ₂ -Ph
3A.15	3-Cl-4-F-Ph
3A.16	4-Br
3A.17	4-CH ₃ -Ph

五、發明說明 (65)

表 3.1：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-OH 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.2：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-CN 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.3：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-OCH₃ 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.4：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-NHCH₃ 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.5：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-SCH₃ 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.6：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-O-異丙基且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.7：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-O-C₂H₅ 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.8：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-S-C₂H₅ 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

五、發明說明 (66)

表 3.9：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-NH-環丙基且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.10：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-NH-CH₂-CCH且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.11：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-N(CH₃)₂且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.12：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-NH-C₂H₅且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.13：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-O-CH₂CH₂-OCH₃且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.14：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-S-CH₂CH₂-OCH₃且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 3.15：通式(Id)化合物，其中 R_{21} 係為-NH-CH₂CH₂-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

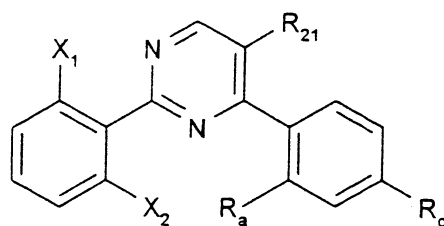
訂

線

五、發明說明 (67)

OCH₃ 且在每一例化合物中之取代基 R_c 係相對應於表 3A 中之一行。

表 4：下式化合物



號碼	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理數據
4.1	F	F	H	CH ₃	4-F-Ph	
4.2	F	F	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
4.3	F	F	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.4	F	F	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.5	F	F	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.6	F	F	H	CH ₃	4-第三丁基-Ph	
4.7	F	F	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.8	F	F	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.9	F	F	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.10	F	F	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.11	F	F	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.12	F	F	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.13	F	F	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
4.14	F	F	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.15	F	F	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.16	F	F	H	OCH ₃	4-F-Ph	
4.17	F	F	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
4.18	F	F	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.19	F	F	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.20	F	F	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.21	F	F	H	OCH ₃	4-第三丁基-Ph	

五、發明說明 (68)

4.22	F	F	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.23	F	F	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.24	F	F	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.25	F	F	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.26	F	F	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.27	F	F	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.28	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-Ph
4.29	F	F	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.30	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.31	F	F	H	OCH ₃	4-Br
4.32	F	F	H	CF ₃	4-F-Ph
4.33	F	F	H	CF ₃	4-Cl-Ph
4.34	F	F	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
4.35	F	F	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
4.36	F	F	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.37	F	F	H	CF ₃	4-第三丁基-Ph
4.38	F	F	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.39	F	F	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.40	F	F	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
4.41	F	F	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.42	F	F	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.43	F	F	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.44	F	F	H	CF ₃	3-Cl-Ph
4.45	F	F	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.46	F	F	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.47	F	F	CH ₃	H	4-F-Ph
4.48	F	F	CH ₃	H	4-Cl-Ph
4.49	F	F	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph
4.50	F	F	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph
4.51	F	F	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph
4.52	F	F	CH ₃	H	4-第三丁基-Ph
4.53	F	F	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph
4.54	F	F	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph
4.55	F	F	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph
4.56	F	F	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph
4.57	F	F	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(69)

4.58	F	F	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph
4.59	F	F	CH ₃	H	3-Cl-Ph
4.60	F	F	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph
4.61	F	F	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph
4.62	F	F	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph
4.63	F	F	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph
4.64	F	F	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.65	F	F	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.66	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.67	F	F	CH ₃	CH ₃	4-第三丁基-Ph
4.68	F	F	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.69	F	F	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.70	F	F	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.71	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.72	F	F	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.73	F	F	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.74	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph
4.75	F	F	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.76	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.77	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph
4.78	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph
4.79	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.80	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.81	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.82	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
4.83	F	F	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.84	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.85	F	F	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.86	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.87	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.88	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.89	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph
4.90	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.91	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.92	F	F	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph
4.93	F	F	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(η°)

4.94	F	F	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
4.95	F	F	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
4.96	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.97	F	F	CH ₃	CF ₃	4-第三丁基-Ph
4.98	F	F	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.99	F	F	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.100	F	F	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
4.101	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.102	F	F	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.103	F	F	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.104	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph
4.105	F	F	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.106	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.107	F	Cl	H	H	4-F-Ph
4.108	F	Cl	H	H	4-Cl-Ph
4.109	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph
4.110	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph
4.111	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph
4.112	F	Cl	H	H	4-第三丁基-Ph
4.113	F	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph
4.114	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph
4.115	F	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph
4.116	F	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph
4.117	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph
4.118	F	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph
4.119	F	Cl	H	H	3-Cl-Ph
4.120	F	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph
4.121	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph
4.122	F	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph
4.123	F	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph
4.124	F	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.125	F	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.126	F	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.127	F	Cl	H	CH ₃	4-第三丁基-Ph
4.128	F	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.129	F	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (71)

4.130	F	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.131	F	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.132	F	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.133	F	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.134	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph
4.135	F	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.136	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.137	F	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph
4.138	F	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph
4.139	F	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.140	F	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.141	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.142	F	Cl	H	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
4.143	F	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.144	F	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.145	F	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.146	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.147	F	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.148	F	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.149	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph
4.150	F	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.151	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.152	F	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph
4.153	F	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph
4.154	F	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
4.155	F	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
4.156	F	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.157	F	Cl	H	CF ₃	4-第三丁基-Ph
4.158	F	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.159	F	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.160	F	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
4.161	F	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.162	F	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.163	F	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.164	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph
4.165	F	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph

五、發明說明 (72)

4.166	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.167	F	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph
4.168	F	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph
4.169	F	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph
4.170	F	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph
4.171	F	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph
4.172	F	Cl	CH ₃	H	4-第三丁基-Ph
4.173	F	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph
4.174	F	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph
4.175	F	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph
4.176	F	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph
4.177	F	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph
4.178	F	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph
4.179	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph
4.180	F	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph
4.181	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph
4.182	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph
4.183	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph
4.184	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.185	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.186	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.187	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-第三丁基-Ph
4.188	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.189	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.190	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.191	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.192	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.193	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.194	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph
4.195	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.196	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.197	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph
4.198	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph
4.199	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.200	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.201	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(75)

4.202	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
4.203	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.204	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.205	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.206	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.207	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.208	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.209	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph
4.210	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.211	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.212	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph
4.213	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph
4.214	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
4.215	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
4.216	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.217	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-第三丁基-Ph
4.218	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.219	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.220	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
4.221	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.222	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.223	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.224	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph
4.225	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.226	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.227	Cl	Cl	H	H	4-F-Ph
4.228	Cl	Cl	H	H	4-Cl-Ph
4.229	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph
4.230	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph
4.231	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph
4.232	Cl	Cl	H	H	4-第三丁基-Ph
4.233	Cl	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph
4.234	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph
4.235	Cl	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph
4.236	Cl	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph
4.237	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (74)

4.238	Cl	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph
4.239	Cl	Cl	H	H	3-Cl-Ph
4.240	Cl	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph
4.241	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph
4.242	Cl	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph
4.243	Cl	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph
4.244	Cl	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.245	Cl	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.246	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.247	Cl	Cl	H	CH ₃	4-第三丁基-Ph
4.248	Cl	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.249	Cl	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.250	Cl	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.251	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.252	Cl	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.253	Cl	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.254	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph
4.255	Cl	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.256	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.257	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph
4.258	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph
4.259	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.260	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.261	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.262	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
4.263	Cl	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.264	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.265	Cl	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.266	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.267	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.268	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.269	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph
4.270	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.271	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.272	Cl	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph
4.273	Cl	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (75)

4.274	Cl	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
4.275	Cl	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
4.276	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.277	Cl	Cl	H	CF ₃	4-第三丁基-Ph
4.278	Cl	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.279	Cl	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.280	Cl	Cl	H	CF ₃	2-Ph
4.281	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.282	Cl	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.283	Cl	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.284	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph
4.285	Cl	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.286	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.287	Cl	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph
4.288	Cl	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph
4.289	Cl	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph
4.290	Cl	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph
4.291	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph
4.292	Cl	Cl	CH ₃	H	4-第三丁基-Ph
4.293	Cl	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph
4.294	Cl	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph
4.295	Cl	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph
4.296	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph
4.297	Cl	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph
4.298	Cl	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph
4.299	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph
4.300	Cl	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph
4.301	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph
4.302	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph
4.303	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph
4.304	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.305	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.306	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.307	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-第三丁基-Ph
4.308	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.309	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (76)

4.310	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.311	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.312	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.313	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.314	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph
4.315	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.316	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.317	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph
4.318	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph
4.319	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph
4.320	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph
4.321	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.322	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-第三丁基-Ph
4.323	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.324	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.325	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph
4.326	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.327	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.328	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.329	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph
4.330	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph
4.331	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph
4.332	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph
4.333	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph
4.334	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
4.335	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph
4.336	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph
4.337	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-第三丁基-Ph
4.338	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph
4.339	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph
4.340	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph
4.341	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph
4.342	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph
4.343	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph
4.344	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph
4.345	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

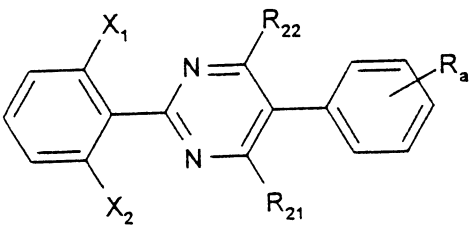
訂

線

五、發明說明 (11)

4.346 Cl Cl CH₃ CF₃ 3-Cl-4-F-Ph

表 5：下式化合物



號碼	X ₁	X ₂	R ₂₁	R ₂₂	R _a	物理數據
5.1	F	F	OH	OH	4-Br	>300
5.2	F	F	OH	H	3-Br	220-222
5.3	F	F	Cl	Cl	4-Br	221-222
5.4	F	F	Cl	H	3-Br	88-90
5.5	F	F	OCH ₃	H	3-Br	89-91
5.6	F	F	CN	H	3-Br	185-187
5.7	F	F	Cl	OCH ₃	4-Br	169-171
5.8	F	F	OCH ₃	H	3-(4-OCF ₃ -Ph)	120-122
5.9	F	F	OCH ₃	H	3-(4-CF ₃ -Ph)	154-156
5.10	F	F	OCH ₃	H	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	143-145
5.11	F	F	CN	H	3-(4-OCF ₃ -Ph)	91-93
5.12	F	F	CN	H	3-(4-CF ₃ -Ph)	114-117
5.13	F	F	CN	H	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	161-163

2.調配物實施例

2.1.乳劑濃縮液	a)	b)	c)
活性成分	25%	40%	50%
十二烷基苯磺酸鈣	5%	8%	6%
蓖麻油聚乙二醇醚			
(36 莫耳的環氧乙烷)	5%	-	-

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明 (18)

第三丁基酚聚乙二醇醚

(30 莫耳的環氧乙烷)-	-	12%	4%
環己酮	-	15%	20%
二甲苯混合物	65%	25%	20%

藉由以水稀釋，可從該濃縮物製備任何所欲濃度之乳劑。

2.2.乳劑濃縮液	a)	b)	c)
活性成分	10%	8%	60%
辛基酚聚乙二醇醚			
(4-5 莫耳的環氧乙烷)	3%	3%	2%
十二烷基苯磺酸鈣	3%	4%	4%
蓖麻油聚乙二醇醚			
(35 莫耳的環氧乙烷)	4%	5%	4%
環己酮	30%	40%	15%
二甲苯混合物	50%	40%	15%

藉由以水稀釋，可從該濃縮物製備任何所欲濃度之乳劑。

2.3.懸浮濃縮液

活性成分	40%
乙二醇	10%
壬酚聚乙二醇醚	
(15 莫耳的環氧乙烷)	6%

五、發明說明 (79)

木質素磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%
37% 甲醛水溶液	0.2%
矽酮油於 75% 水乳液	0.8%
水	32%

將磨細的活性物質與佐劑均勻混合，以此方式獲得懸浮濃縮液，藉由以水稀釋此懸浮濃縮液可獲得任何所欲濃度之懸浮液。

2.4.可分散於水中之粉末混合物	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
油酸	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
辛基酚聚乙二醇醚			
(7-8 莫耳的環氧乙烷)	-	2%	-
高分散矽酸	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

將活性成分和佐劑徹底地混合，且混合物在適當研磨機中研磨，產生可以水稀釋而產生任何所欲濃度之懸浮液的可濕潤粉末。

2.5.粉劑	a)	b)
活性成分	2%	5%

五、發明說明 (80)

高分散矽酸	1%	5%
滑石	97%	-
高嶺土	-	90%

藉由緊密混合載體與活性成分及研磨混合物獲得在備用狀態之粉劑。

2.6.粒劑	a)	b)
活性成分	5%	10%
高嶺土	94%	-
高分散矽酸	1%	5%
綠坡縷石	-	90%

將活性成分溶解在二氯甲烷中且將溶液噴塗在載體上，及隨後在真空中蒸發溶劑。該等粒劑可和動物飼料混合。

2.7.粒劑	
活性成分	10%
木質素磺酸鈉	2%
羧甲基纖維素	1%
高嶺土	87%

將活性成分與該等佐劑混合和研磨，且混合物以水溼化。擠製混合物然後在空氣流中乾燥。

2.8.粒劑

五、發明說明（ 81 ）

活性成分	3%
------	----

聚乙二醇(MW200)	
-------------	--

(MW = 分子量)	3%
------------	----

高嶺土	94%
-----	-----

於混合器中，將細研磨之活性物質均勻施用至以聚乙二醇溼化之高嶺土。在此方式獲得非粉末塗佈的粒劑。

2.9.錠劑

組成物(1000 個錠劑)：

活性成分	25.0 克
------	--------

乳糖	100.7 克
----	---------

小麥澱粉	7.5 克
------	-------

聚乙二醇 6000	5.0 克
-----------	-------

滑石	5.0 克
----	-------

硬脂酸鎂	1.8 克
------	-------

去礦質水	餘量
------	----

先強迫所有固體成分通過 0.6 毫米篩目大小之篩子。將活性成分，乳糖，滑石和一半澱粉混合在一起。將另一半澱粉懸浮在 40 毫升水中，且將懸浮液加至聚乙二醇在 100 毫升水中的沸騰溶液內。將所產生的澱粉糊劑加至混合物中，且然後將混合物製粒，其中合適的話加水。該等粒劑在 35℃ 乾燥過夜，通過 1.2 毫米網目孔大小的篩子，和硬脂酸鎂混合及壓縮以形成具有直徑 6 毫米兩側凹入的錠劑。

五、發明說明 (82)

2.10.可注射劑

A.油性賦形劑(緩慢釋放)

活性成分	0.1-1.0 克
花生油	至 100 毫升
活性成分	0.1-1.0 克
芝麻油	至 100 毫升

將活性成分溶解在部分油中並攪拌且，若需要，可溫和加熱，然後在冷卻之後使溶液到所要的體積，然後藉由經過孔徑 0.22 毫米膜濾器進行滅菌過濾。

B.水可混合溶劑(普通速率釋放)

活性成分	0.1-1.0 克
4-羥甲基-1,3-二噁烷 (甘油式)40 克	
1,2-丙二醇	至 100 毫升
活性成分	0.1-1.0 克
甘油二甲基縮酮	40 克
1,2-丙二醇	至 100 毫升

將活性成分溶解在部分溶劑中並攪拌，填充到所要的體積，且藉由經過孔徑 0.22 毫米膜濾器進行滅菌過濾。

C.水加溶物(迅速釋放)

活性成分	0.1-1.0 克
------	-----------

五、發明說明 (8)

聚乙氧基化蓖麻油	
(40 環氧乙烷單元)	10 克
1,2-丙二醇	20 克
苯甲醇	1 克
水注射	至 100 毫升
活性成分	0.1-1.0 克
聚乙氧基化山梨糖醇單油酸酯	
(20 環氧乙烷單元)	8 克
4-羥甲基-1,3-二噁烷	
(甘油式)	20 克
苯甲醇	1 克
水注射	至 100 毫升

製備：將活性成分溶解在該等溶劑和表面活性劑中，
和以水使溶液到所要的體積。然後藉由經過孔徑 0.22 毫米
之適當膜濾器進行滅菌過濾。

該等水性系統可以口服及／或非經腸道給藥之較佳方
式使用。

2.11.傾倒式

A.	
活性成分	10%
聚乙氧基化大豆油	5%
油醇	85%
B	

五、發明說明（84）

活性成分	20%
吡咯啉-2-酮	15%
肉豆蔻酸異丙基酯	65%

可將另外生物活性物質或具有趨向式(I)化合物性質且對宿主動物沒有副作用的添加劑，以及礦物鹽或維生素加到所述組成物中。

3.生物實施例：

A.殺蟲活性

3.1 抗豆蚜（*Aphis craccivora*）之活性

以豆蚜（*Aphis craccivora*）感染豌豆苗，隨後噴灑含 100ppm 活性成分之噴霧混合物，且然後在 20℃ 下培養。3 及 6 天後，經由比較在經處理之植物及未經處理之植物上之死亡蚜蟲的總數目測定蟲群減少百分比（%反應）。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效。

3.2.抗黃瓜條葉甲（*Diabrotica baleata*）之活性

玉蜀黍苗被噴灑含 100 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物。在噴灑包覆物乾燥後，該玉蜀黍苗被飼育十隻第二期之黃瓜條葉甲（*Diabrotica baleata*）之幼蟲且然後被置於塑膠容器中。6 天後，經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之死亡幼蟲的總數目測定蟲群減少百分比（%反應）。

在此試驗中，表 1 至 4 中之化合物顯示良好功效；尤

五、發明說明（85）

其是化合物 1.1 及 2.4 顯示超過 80% 之功效。

3.3. 抗美洲菸夜蛾（*Heliothis virescens*）之活性

大豆幼苗被噴灑含 100 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物，在噴灑包覆物乾燥後，該幼苗被飼育十隻第一期之美洲菸夜蛾（*Heliothis virescens*）之毛蟲且然後被置於塑膠容器中。6 天後，經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之死亡毛蟲的總數目及飼養損壞的程度測定蟲群減少百分比及飼養損壞減少百分比（%反應）。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效；尤其是化合物 1.17 顯示超過 80% 之功效。

3.4. 抗埃及棉捲蟲（*Spodoptera littoralis*）之活性

大豆幼苗被噴灑含 100 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物，在噴灑包覆物乾燥後，該幼苗被飼育十隻第三期之埃及棉捲蟲（*Spodoptera littoralis*）之毛蟲且然後被置於塑膠容器中。3 天後，經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之死亡毛蟲的總數目及飼養損壞程度測定蟲群減少百分比及飼養損壞減少百分比（%反應）。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效；尤其是化合物 1.1 至 1.6，1.8 至 1.14，1.16，1.16 至 1.25 及 2.4 顯示超過 80% 之功效。

3.5. 抗稻褐飛虱（*Nilaparvata lugens*）之活性

五、發明說明（86）

稻米植物被噴灑含 400 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物。在噴灑包覆物乾燥後，該稻米植物被飼育第二及三期之蟬幼蟲。21 天後進行評估。經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之存活的蟬的數目測定蟲群減少百分比（%反應）。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效。

3.6. 抗 *Crocicidolomia binotalis* 之活性

捲心菜幼苗被噴灑含 400 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物。在噴灑包覆物乾燥後，該捲心菜幼苗被飼育十隻第三期之（*Crocicidolomia binotalis*）之毛蟲且然後被置於塑膠容器中。3 天後進行評估。經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之死亡毛蟲的總數目及飼養損壞程度測定蟲群減少百分比及飼養損壞減少百分比（%反應）。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效。

3.7. 抗棉鈴象甲（*Anthonomus grandis*）之活性

棉花幼苗被噴灑含 400 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物。在噴灑包覆物乾燥後，該棉花幼苗被飼育十隻棉鈴象甲（*Anthonomus grandis*）成蟲且然後被置於塑膠容器中。3 天後進行評估。經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之死亡毛蟲的總數目及飼養損壞程度測定蟲群減少百分比及飼養損壞減少百分比（%反應）。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效。

五、發明說明 (8)

3.8.抗紅圓介 (*Aonidiella aurantii*) 之活性

馬鈴薯塊莖被飼育紅圓介 (*Aonidiella aurantii*) 之爬蟲。在約 2 週後，該塊莖被浸漬於含 400 ppm 活性成分之水性乳劑或懸浮劑噴霧混合物中。在塊莖乾燥後，其被置於塑膠容器中培養。爲了評估，10 至 12 週後比較在經處理之蟲群及未經處理之控制組之第一代爬蟲的存活率。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效。

3.9.抗甘薯粉虱(*Bemisia tabaci*)之活性

矮豆子幼苗被放置在薄紗籠中且被飼育甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*) 的成蟲。產卵之後，移除所有的成蟲。10 天之後該等植物和該等位於其上之活動蛹被噴灑含 400 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物。在另外 14 天之後，評估已經孵化蛋的百分比，與被未處理的控制組比較。

在此試驗中，表 1 至 4 之化合物顯示良好功效。

B.殺蟎活性

3.10.抗棉紅蜘蛛 (*Tetranychus urticae*) 之活性

豆類幼苗被飼育棉紅蜘蛛 (*Tetranychus urticae*) 之混合族群且在 1 天後噴灑含 100 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物。然後將該植物在 25°C 培養 6 天且隨後評估。經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之死亡卵，幼蟲及成蟲的總數目測定蟲群減少百分比 (%反應)。

在這個測試中，表 1 至 4 之化合物呈現的良好功效；

五、發明說明 (88)

尤其是化合物 1.1, 1.5, 1.11 至 1.19 及 1.21 顯示超過 80 % 之功效。

3.11. 抗蘋果紅蜘蛛(*Panonychus ulmi*)活性(抗有機磷酸鹽和甲氨甲醯氧萘)

蘋果幼苗被飼育蘋果紅蜘蛛(*Panonychus ulmi*)雌成蟲。在七天之後感染幼苗噴灑含 400 ppm 活性成分之水性乳劑噴霧混合物至滴點且在室溫培養。在 14 天之後進行評估。經由比較在經處理之幼苗及未經處理之幼苗上之死亡蜘蛛數測定蟲群減少百分比 (%反應)。

在這個測試中，表 1 至 4 之化合物呈現的良好功效。

C. 殺外寄生蟲(Ectoparasiticide)活性

3.12. 藉由傾倒式施用控制貓的跳蚤成蟲

爲了檢測測試物質阻抗成熟跳蚤的有效性，使用每組兩隻貓共四組進行測試。每隻貓以 100 隻貓跳蚤[貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)(布契爾, Bouche)]感染，及每公斤體重使用 20 毫克活性物質治療。該治療係施用調配物至貓頸部上的特定區域。其中一組受跳蚤感染，但僅使用安慰劑處理，亦即未含有活性成份的調配物，且作爲控制組，另一組則使用做爲比較物質的乃庭必倫(nitenpyram)治療；其餘二組則接受測試物質治療。每個情形中的評估係藉由由動物皮毛梳理出存活的跳蚤且計算並比較在控制組和以乃庭必倫治療組別中的跳蚤數目。一般而言：每隻貓在第 0

五、發明說明 (89)

天處理後立即以 100 隻跳蚤感染。在第+1 天時，梳理每隻動物且計算存活跳蚤的數目；將存活的跳蚤重新放置至相同的貓上且在 24 h 之後重複梳毛且評估。在 24 h 之後仍存活的跳蚤並不放回貓身上。上述之步驟再在第+3，+7，+9，+14，+21，+28，+35，+42 和+49 天重複，依此方式測定該作用的有效性和期限。每天梳出存活的跳蚤後從每隻貓取出約 2.7 毫升之血液樣品-除了控制組之外-及測量活性成份之含量。有效性係依據下式測定：

$$\text{有效性(\%)} = \frac{\text{在控制組動物身上存活跳蚤數} - \text{在測試組動物身上存活跳蚤數}}{\text{在控制組動物身上存活跳蚤數目}} \times 100\%$$

其顯示：與乃庭必倫比較，根據本發明式(I)化合物可達到極佳的長效作用。

以完全類似的方式在狗身上進行測試。當該等物質並非以傾倒式形式而是以注射溶液形式給藥時亦可觀察到相同的效果。

3.13.藉由皮下注射控制貓的跳蚤成蟲

爲了決定測試物質抗完全成長跳蚤的有效性，使用每組兩隻貓共四組進行測試，貓齡爲 1.5 至 4 歲。每隻貓以 100 隻貓跳蚤感染[貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)(布契爾, Bouche)]，及每公斤體重使用 20 毫克活性物質治療。該治

五、發明說明 (90)

療係為皮下注射活性成份溶液至左肩胛骨。其中一組受跳蚤感染，但僅使用安慰劑處理，亦即未含有活性成份的調配物且作為控制組，另一組則使用做為比較物質的乃庭必倫治療；其餘二組以測試化合物治療。在各情況中係類似於前述實施例進行評估。

其顯示：與乃庭必倫比較，皮下注射根據本發明表 1 至 4 之物質可達到極佳的長效作用。

以狗進行類似之測試產生可比較之結果。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

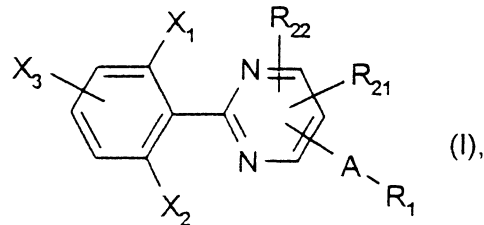
線

四、中文發明摘要 (發明之名稱：

)

除害的嘧啶衍生物

本發明係關於一種下列通式之化合物，

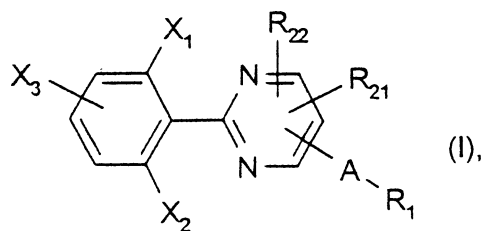


其中

R_1 係為未經取代的或單-至五取代之芳基，藉以該取代基係選自，例如，下列所組成之族群中：OH，鹵素，CN， C_1 - C_6 烷基，可選擇地經取代之 C_3 - C_8 環烷基及可選

英文發明摘要 (發明之名稱： Pesticidal Pyrimidine-Derivatives)

The invention relates to compounds of the general formula



wherein

R_1 is unsubstituted or mono- to penta-substituted aryl, whereby the substituents are selected from the group consisting for instance of OH, Halogen, CN, C_1 - C_6 -alkyl, optionally substituted C_3 - C_8 -cycloalkyl and optionally substituted C_3 - C_8 -cycloalkenyl;

A is for instance a single bond, C_1 - C_{12} -alkylene or O;

X_1 and X_2 , independently of one another, are R_{10} ; X_3 is H or R_{10} ;

R_{10} is for instance halogen, CN, NO_2 , C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl or C_1 - C_6 -haloalkyl;

四、中文發明摘要 (發明之名稱：)

擇地經取代之 C_3-C_8 環烷基；

A 爲，例如，單鍵， C_1-C_{12} 烷撐或 O；

X_1 及 X_2 彼此獨立爲 R_{10} ； X_3 爲 H 或 R_{10} ；

R_{10} 爲，例如，鹵素，CN， NO_2 ， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基或 C_1-C_6 -鹵烷基；

R_{21} 及 R_{22} 彼此獨立爲，例如，H，鹵素，CN， NO_2 ，OH，SH， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 環烷基， C_1-C_6 -烷基- C_3-C_8 -環烷基或 C_3-C_8 -環烷基- C_1-C_6 -烷基；

R_{23} 及 R_{24} 彼此獨立爲，例如，H， C_1-C_6 -烷基， C_3-C_8 -環烷基， C_3-C_8 -環烷基- C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基或 C_3-C_8 -鹵環烷基；

英文發明摘要 (發明之名稱：)

R_{21} and R_{22} , independently of one another are for instance H, halogen, CN, NO_2 , OH, SH, C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_8 cycloalkyl, C_1-C_6 -alkyl- C_3-C_8 -cycloalkyl or C_3-C_8 -cycloalkyl- C_1-C_6 -alkyl;
 R_{23} and R_{24} , independently of one another, are for instance H, C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_8 -cycloalkyl, C_3-C_8 -cycloalkyl- C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -haloalkyl or C_3-C_8 -halocycloalkyl;

m is 1, 2, 3 or 4; and

n is 0, 1 or 2;

as well as the physiologically acceptable addition compounds, a method of producing these compounds and the usage of these compounds, pesticide compositions whose active ingredient is chosen from these compounds, each in free form or in agrochemically employable salt form, and a method of producing and using these compositions. The active ingredients, in free form or in agrochemically employable salt form, have advantageous pesticidal properties. They are especially suitable for the control of pests in agriculture and in storage, as well as in the care of domestic animals.

四、中文發明摘要（發明之名稱：

m 爲 1，2，3 或 4；且

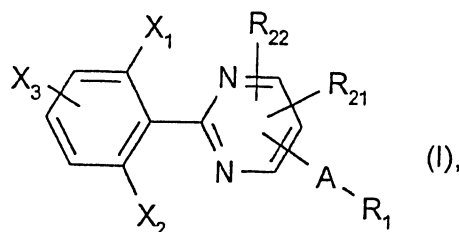
n 爲 0，1 或 2，

及其生理上可接受之加成化合物，一種生產這些化合物之方法及這些化合物之用途，除害組成物其活性成分係選自這些化合物，在每一例中爲游離形式或農業化學上可使用鹽形式，及一種生產及使用這些組成物之方法。該等活性成分，爲游離形式或農業化學上可使用鹽形式，具有有利的除害性質。它們尤其適合於控制在農業及貯存物中及亦於家畜之照顧中之有害生物。

英文發明摘要（發明之名稱：

六、申請專利範圍

1、一種下式化合物，



其中

R₁ 係為未經取代的或單-至二取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素及未經取代的或單-至二-取代之苯基，藉以該取代基係選自下列所組成之族群中：鹵素，C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₁-C₆-烷氧基及 C₁-C₆-鹵烷氧基；

A 為單鍵；

X₁ 及 X₂ 為鹵素；

X₃ 為 H 或鹵素；及

R₂₁ 及 R₂₂ 彼此獨立為 H，鹵素，CN，OH，SH，C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₆-烷基硫基或 C₂-C₈-炔基氧基；

及生理上可接受加成化合物，且其中合適地，關於 E/Z-異構物，E/Z 異構物之混合物及／或互變體，在每一例中為游離形式或農業化學上可使用鹽形式。

2、根據申請專利範圍第 1 項之式(I)化合物，其為游離形式。

3、一種控制有害生物的組成物，其包括當作活性成份

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

之至少一種根據申請專利範圍第 1 項中所述的式(I)化合物，及至少一種佐劑。

4、一種控制有害生物的方法，其包括使用除害有效量之至少一種根據申請專利範圍第 1 項中所述的式(I)化合物至該有害生物或其處所。

5、根據申請專利範圍第 1 項的式(I)化合物，其係用於控制有害生物。

6、根據申請專利範圍第 1 項的式(I)化合物，其係用於控制在植物及溫血動物上之寄生蟲之方法。

7、根據申請專利範圍第 4 項之方法，其係用於保護植物繁殖物質，其包括處理該繁殖物質或該繁殖物質之栽培區域。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線