發明專利說明書

（本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫）

※ 申請案號： 92113550

※ 申請日期：92 5 20 ※IPC 分類：C07C 45/28

壹、發明名稱：（中文/英文）

有機化合物 ／ Organic compounds

貳、申 請 人：（共 1 人）

姓名或名稱：（中文/英文）

諾華公司 ／ Novartis AG

代表人：（中文/英文）

1.漢斯 魯道夫 豪斯 ／ HAUS, Hans Rudolf

2.亨利艾特 布罕納 ／ BRUNNER, Henriette

住居所或營業所地址：（中文/英文）

瑞士，4056 巴賽爾城，光明街 35 號

Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Switzerland

國 籍：（中文/英文）

瑞士 ／ SWITZERLAND

參、發明人：（共 4 人）

發明人1：

姓 名：（中文/英文）

皮耶．杜克瑞 ／ DUCRAY, Pierre

住居所地址：（中文/英文）

法國 68128 紐夫村市 盟國路 8 號

8 rue des alliés, 68128 Village-Neuf, France

國 籍：（中文/英文）

法國 ／ France

發明人2：

姓　名：(中文/英文)
湯瑪斯・高貝爾 ／ GOEBEL, Thomas

住居所地址：(中文/英文)
德國 79539 羅瑞克市 雷登路 28B 號
Lettenweg 28B, 79539 Lörrach, Germany

國　籍：(中文/英文)
德國 ／ Germany

發明人3：

姓　名：(中文/英文)
賈魁斯・包威爾 ／ BOUVIER, Jacques

住居所地址：(中文/英文)
瑞士 2000 紐洽特爾城 帕克斯路 2 號
Rue des Parcs 2, 2000 Neuchatel, Switzerland

國　籍：(中文/英文)
瑞士 ／ Switzerland

發明人4：

姓　名：(中文/英文)
寇林・杜瑞諾 ／ DURANO, Corinne

住居所地址：(中文/英文)
法國 68680 凱巴斯市 莎夫瑞路 20 號
20, Rue Safran, 68680 Kembs, France

國　籍：(中文/英文)
法國 ／ France

肆、聲明事項：

☐ 本案係符合專利法第二十條第一項☐第一款但書或☐第二款但書規定之期間，其日期為： 年 月 日。

◎本案申請前已向下列國家（地區）申請專利

☑ 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1.瑞士；2002.05.22；2002 0856/02

2.

3.

4.

5.

☐ 主張國內優先權(專利法第二十五條之一)：

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

1.

2.

☐ 主張專利法第二十六條微生物：

☐ 國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

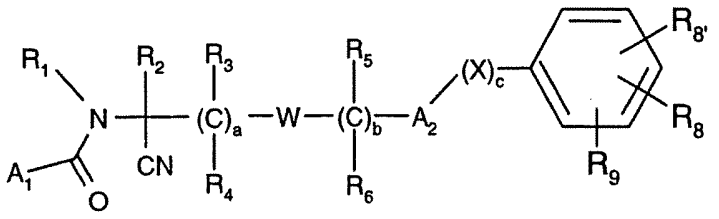
☐ 國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

☐ 熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

玖、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於下式之新穎醯胺基乙腈化合物：



I,

其中

A_1 與 A_2 係各自獨立地表示未經取代之芳基或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 與 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_2-C_6-烯基、鹵基-C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯氧基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_2-C_6-烯硫基、鹵基-C_2-C_6-烯硫基、C_2-C_6-烯基亞磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基亞磺醯基、C_2-C_6-烯基磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷基磺醯胺基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷氧羰基、C_1-C_6-烷胺羰基、二-C_1-C_6-烷胺羰基；未經取代之苯基胺基或經取代一次或多次之苯基胺基；未經取代之苯基羰基或經取代一次或多次之苯基

羰基；未經取代之苯基甲氧基亞胺基或經取代一次或多次之苯基甲氧基亞胺基；未經取代之苯基羥基甲基或經取代一次或多次之苯基羥基甲基；未經取代之 1-苯基-1-羥基乙基或經取代一次或多次之 1-苯基-1-羥基乙基；未經取代之苯基氟甲基或經取代一次或多次之苯基氟甲基；未經取代之苯基氰基甲基或經取代一次或多次之苯基氰基甲基；未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基；未經取代之苯氧基或經取代一次或多次之苯氧基；未經取代之苯乙炔基或經取代一次或多次之苯乙炔基；及未經取代之吡啶氧基或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於 R_9；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於 R_9；

R_1 表示氫、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、烯丙基或 C_1-C_6-烷氧基甲基；

R_2、R_3、R_4、R_5 和 R_6 可各自獨立地為氫、鹵素、未經取代之 C_1-C_6-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_6-烷基、未經取代之 C_2-C_6-烯基或經取代一次或多次之 C_2-C_6-烯基、未經取代之 C_2-C_6-炔基或經取代一次或多次之 C_2-C_6-炔基、未經取代之 C_1-C_6-烷氧基或經取代一次或多次之 C_1-C_6-烷氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、C_1-C_6-烷氧基和鹵基-C_1-C_6-烷氧基所組成之群組；未經取代之 C_3-C_6-環烷基或經取代一次或多次之 C_3-C_6-環烷基，其中

取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_6-烷基所組成之群組；或未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基或二-C_1-C_6-烷胺基所組成之群組；

或者，R_2與R_3一起表示 C_2-C_6-伸烷基；

R_7表示氫或 C_1-C_6-烷基；

R_8表示 C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_3-C_8-環烷基、鹵基-C_3-C_8-環烷基、C_3-C_8-環烷胺基、鹵基-C_3-C_8-環烷胺基、C_3-C_8-環烷氧基、鹵基-C_3-C_8-環烷氧基或 C_3-C_8-環烷硫基；而 R_8,表示氫或 R_9；

或者 R_8和 R_8,一起表示未經取代或經 R_9取代之 C_3-C_5-伸烷基，其中一或多個碳原子可被 O、N 或 S 置換；

R_9表示鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_2-C_6-烯基、鹵基-C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯氧基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_2-C_6-烯硫基、鹵基-C_2-C_6-烯硫基、C_2-C_6-烯基亞磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基亞磺醯基、

C_2-C_6-烯基磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷基磺醯胺基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷氧羰基、C_1-C_6-烷胺羰基及二-C_1-C_6-烷胺羰基；

W 表示 O、S、$S(O)_2$ 或 $N(R_7)$；

X 表示 O、S 或 $N(R_7)$；

a 表示 1、2、3 或 4；

b 表示 1、2、3 或 4；以及

c 表示 0 或 1；

需要時，還關於其非對應異構體、E/Z-異構體、E/Z-異構體混合物及／或互變異構體，各別呈游離形式或鹽形式者，關於其製備方法及在控制溫血動物，特別是生產用牲畜和馴養動物體內及身上以及植物上之體內與體外寄生蟲（尤其是蠕蟲）的用途，此外還關於包含這些化合物中至少一者的殺蟲劑。

【先前技術】

舉例來說，具有殺蟲作用之經取代醯胺基乙腈化合物係揭示於 EP-0.953.565 A2 中。然而，其中所具體揭示之活性成分可能無法總是符合有關效力和活性範圍的需求。因此有著對於具有改良殺蟲性質之活性成分的需求。現在已經發現，式 I 之醯胺基乙腈化合物具有出色的殺蟲性質，特別是在對抗溫血動物及植物體內和身上的體內與體外寄生蟲方面。

烷基，本身即為基團，並且為其他基團及化合物如鹵

代-烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亞磺醯基及烷基磺醯基等的結構單元，在各個適當考慮到相關基團或化合物中特定碳原子數的情況中，其或可為直鏈者，亦即甲基、乙基、丙基、丁基、戊基或己基，或為支鏈者，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。

烯基，本身即為基團，並且為其他基團及化合物的結構單元，在各個適當考慮到相關基團或化合物中特定碳原子數與共軛或孤立雙鍵數的情況中，其或可為直鏈者，例如：烯丙基、2-丁烯基、3-戊烯基、1-己烯基或 1,3-己二烯基，或為支鏈者，例如：異丙烯基、異丁烯基、異戊二烯基、第三戊烯基或異己烯基。

炔基，本身即為基團，並且為其他基團及化合物的結構單元，在各個適當考慮到相關基團或化合物中特定碳原子數與共軛或孤立參鍵數的情況中，其或可為直鏈者，例如：炔丙基、2-丁炔基、3-戊炔基、1-己炔基、1-庚炔基或3-己烯-1-炔基，或為支鏈者，例如：3-甲基丁-1-炔基、4-乙基戊-1-炔基或 4-甲基己-2-炔基。

環烷基，本身即為基團，並且為其他基團及化合物如鹵代環烷基、環烷氧基或環烷硫基等的結構單元，在各個適當考慮到相關基團或化合物中特定碳原子數的情況中，其為環丙基、環丁基、環戊基或環己基。

芳基為苯基或萘基。

雜芳基為吡啶基、嘧啶基、對稱-三吩基、1,2,4-三吩

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、苯并噻吩基、苯并呋喃基、苯并噻唑基、吲哚基、吲唑基或喹啉基。

鹵素，本身即為基團，並且為其他基團及化合物如鹵代烷基、鹵代烷氧基、鹵代烷硫基、鹵代烷基亞磺醯基和鹵代烷基磺醯基等的結構單元，為氟、氯、溴或碘，特別是氟、氯或溴，尤其是氟或氯。

經鹵素取代之含碳基團及化合物，如鹵代烷基、鹵代烷氧基、鹵代烷硫基、鹵代烷基亞磺醯基和鹵代烷基磺醯基等，可為經部分鹵代或為全鹵代者，其中在多鹵代的情況中，鹵素取代基可相同或不同。鹵代烷基，本身即為基團，並且為其他基團及化合物如鹵代烷氧基或鹵代烷硫基等的結構單元，其實例有：被氟、氯及/或溴單至三取代的甲基，例如 CHF_2 或 CF_3；被氟、氯及/或溴單至五取代的乙基，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/或溴單至七取代的丙基或異丙基，例如：$CH_2CHBrCH_2Br$、CF_2CHFCF_3、$CH_2CF_2CF_3$ 或 $CH(CF_3)_2$；被氟、氯及/或溴單至九取代的丁基或其異構體之一，例如 $CF(CF_3)CHFCF_3$ 或 $CH_2(CF_2)_2CF_3$；被氟、氯及/或溴取代一至十一次的戊基或其異構體之一，例如 $CF(CF_3)(CHF)_2CF_3$ 或 $CH_2(CF_2)_3CF_3$；被氟、氯及/或溴取代一至十三次的己基或其異構體之一，例如：$(CH_2)_4CHBrCH_2Br$、$CF_2(CHF)_4CF_3$、$CH_2(CF_2)_4CF_3$ 或

$C(CF_3)_2(CHF)_2CF_3$。

烷氧基較佳具有 1 至 6 個碳原子的鏈長。舉例來說，烷氧基有：甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基及第三丁氧基，以及異構體戊氧基與己氧基；較佳為甲氧基和乙氧基。鹵代烷氧基較佳具有 1 至 6 個碳原子的鏈長。鹵代烷氧基有例如：氟代甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2,2-二氟乙氧基和 2,2,2-三氯乙氧基；較佳為二氟甲氧基、2-氯乙氧基和三氟甲氧基。

【發明內容】

在本發明範疇內之較佳具體實例有：

(1) 式 I 之化合物，其中 A_1 與 A_2 係各自獨立地表示未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 與 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷氧羰基，未經取代之苯基胺基或經取代一次或多次之苯基胺基；未經取代或經取代一次或多次之苯基羰基；未經取代或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次

或多次之苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基和 C_1-C_6-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基及 C_1-C_6-烷氧羰基；

特別是各自獨立地為未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基，未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次或多次之

苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及C_1-C_4-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基A_1和A_2可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及C_1-C_4-烷氧羰基；

特別是各自獨立地為未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基A_1和A_2係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基、C_1-C_2-烷氧羰基，及未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基，其中取代基在各情況中可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷

基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_3-C_4-環烷硫基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-烷胺基、二-C_1-C_2-烷胺基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基及 C_1-C_2-烷氧羰基所組成之群組；

(2) 式 I 之化合物，其中 R_1 表示氫、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基或 C_1-C_4-烷氧基甲基；

特別是氫、C_1-C_2-烷基或鹵基-C_1-C_2-烷基；

最特別是氫或 C_1-C_2-烷基；

(3) 式 I 之化合物，其中 R_2、R_3、R_4、R_5和 R_6係各自獨立地表示氫、鹵素、未經取代之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_4-烷氧基所組成之群組；C_3-C_5-環烷基或未經取代或經取代一次或多次之苯基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基及鹵基-C_1-C_4-烷氧基所組成之群組；

特別是各自獨立地表示氫、未經取代之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_2-烷氧基所組成之群組；或 C_3-C_5-環烷基；

最特別是各自獨立地表示氫、C_1-C_2-烷基或 C_3-C_5-環烷基；

(4) 式 I 之化合物，其中 R_7為 C_1-C_6-烷基；

特別是 C_1-C_4烷基；

最特別是 C_1-C_2-烷基；

(5) 式 I 之化合物，其中 R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_3-C_6-環烷基或 C_3-C_6-環烷氧基；而 $R_{8'}$ 表示氫；

或者 R_8 和 $R_{8'}$ 一起表示未經取代或經 R_9 取代之 C_3-C_4-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 或 N 置換；

特別是 R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基；而 $R_{8'}$ 表示氫；

或者 R_8 和 $R_{8'}$ 一起表示未經取代或經 R_9 取代之 C_3-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 置換；

最特別是或可 R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基或二-C_1-C_4-烷胺基；而 $R_{8'}$ 表示氫；

(6) 式 I 之化合物，其中 R_9 表示鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_2-C_5-烯基、鹵基-C_2-C_5-烯基、C_2-C_5-炔基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_2-C_5-烯氧基、鹵基-C_2-C_5-烯氧基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯氧基、C_1-C_4-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基、C_1-C_4-烷胺羰基或二-C_1-C_4-烷胺羰基；

特別是鹵素、氰基、C_1-C_3-烷基、鹵基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_3-烷氧基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_1-C_3-烷硫基、鹵基-C_1-C_3-烷硫基、C_1-C_3-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_3-烷基磺醯基、C_1-C_3-

烷胺基、二-C_1-C_3-烷胺基、C_1-C_3-烷羰基、鹵基-C_1-C_3-烷羰基或C_1-C_3-烷氧羰基；

最特別是鹵素、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_1-C_2-烷硫基或鹵基-C_1-C_2-烷硫基；

(7) 式I之化合物，其中W是O或S；

尤其是O；

(8) 式I之化合物，其中X是O或N(R_7)；

尤其是O；

(9) 式I之化合物，其中a是1、2或3；

尤其是1或2；

更特別是1；

(10) 式I之化合物，其中b是0、1或2；

尤其是0或1；

更特別是0；

(11) 式I之化合物，其中c表示0；

(12) 式I之化合物，其中A_1與A_2係各自獨立地為未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基A_1與A_2係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷

氧羰基，未經取代之苯基胺基或經取代一次或多次之苯基胺基；未經取代或經取代一次或多次之苯基羰基；未經取代或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次或多次之苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基和C_1-C_6-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基及C_1-C_6-烷氧羰基；

R_1 表示氫、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基或 C_1-C_4-烷氧基甲基；

R_2、R_3、R_4、R_5和 R_6係各自獨立地表示氫、鹵素、未經取代之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，

其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_4-烷氧基所組成之群組；C_3-C_5-環烷基或未經取代或經取代一次或多次之苯基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基及鹵基-C_1-C_4-烷氧基所組成之群組；

R_7 為 C_1-C_6-烷基；

R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_3-C_6-環烷基或 C_3-C_6-環烷氧基；而 $R_{8'}$ 表示氫；

或者 R_8 和 $R_{8'}$ 一起表示未經取代或經 R_9 取代之 C_3-C_4-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 或 N 置換；

R_9 表示鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_2-C_5-烯基、鹵基-C_2-C_5-烯基、C_2-C_5-炔基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_2-C_5-烯氧基、鹵基-C_2-C_5-烯氧基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯氧基、C_1-C_4-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基、C_1-C_4-烷胺羰基或二-C_1-C_4-烷胺羰基；

W 表示 O 或 S；

X 表示 O 或 N(R_7)；

a 表示 1、2 或 3；

b 表示 0、1 或 2；以及

c 表示 0；

(13) 式 I 之化合物，其中 A_1 與 A_2 係各自獨立地表示未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基，未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次或多次之苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及 C_1-C_4-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及 C_1-C_4-烷氧羰基；

R_1 表示氫、C_1-C_2-烷基或鹵基-C_1-C_2-烷基；

R_2、R_3、R_4、R_5 和 R_6 係各自獨立地表示氫、未經取代

之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_2-烷氧基所組成之群組；或 C_3-C_5-環烷基；

R_7 為 C_1-C_4 烷基；

R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基；而 $R_{8'}$ 表示氫；

或者 R_8 和 $R_{8'}$ 一起表示未經取代或經 R_9 取代之 C_3-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 置換；

R_9 表示鹵素、氰基、C_1-C_3-烷基、鹵基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_3-烷氧基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_1-C_3-烷硫基、鹵基-C_1-C_3-烷硫基、C_1-C_3-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_3-烷基磺醯基、C_1-C_3-烷胺基、二-C_1-C_3-烷胺基、C_1-C_3-烷羰基、鹵基-C_1-C_3-烷羰基或 C_1-C_3-烷氧羰基；

W 和 X 表示 O；

a 表示 1 或 2；

b 表示 0 或 1；以及

c 表示 0；

(14) 式 I 之化合物，其中 A_1 與 A_2 係各自獨立地表示未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基、C_1-C_2-烷氧羰基及未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基，

其中取代基在各情況中可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_3-C_4-環烷硫基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-烷胺基、二-C_1-C_2-烷胺基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基及C_1-C_2-烷氧羰基所組成之群組；

R_1表示氫或C_1-C_2-烷基；

R_2、R_3、R_4、R_5和R_6係各自獨立地表示氫、C_1-C_2-烷基或C_3-C_5-環烷基；

R_7為C_1-C_2-烷基；

R_8表示C_1-C_4-烷胺基或二-C_1-C_4-烷胺基；

$R_{8'}$表示氫；

R_9表示鹵素、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_1-C_2-烷硫基或鹵基-C_1-C_2-烷硫基；

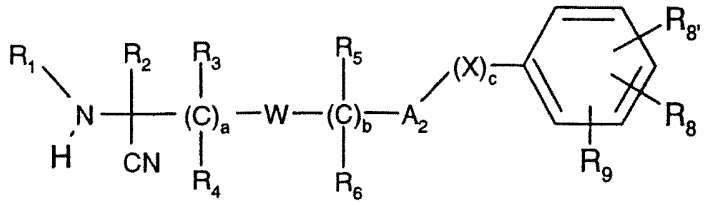
W和X表示O；

a表示1；以及

b和c表示0。

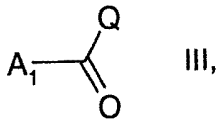
在本發明上下文中，特佳者為列於表1中之式I化合物，而最為特別的是在合成實施例中所提及者。

本發明之進一步標的是製備分別呈游離形式或呈鹽形式之式I化合物之方法，舉例來說，本方法特徵在於使下式II化合物與下式III化合物反應：



II,

其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，且其中 R_1、R_2、R_3、R_4、R_5、R_6、R_8、$R_{8'}$、R_9、W、X、A_2、a、b 及 c 係如在式 I 中所定義者，



III,

其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，且其中 A_1 係如在式 I 中所定義者，而 Q 是離去基，視需要在鹼性催化劑存在下進行，

以及若須要，將可根據本方法或其他方式得到之分別呈游離形式或鹽形式之式 I 化合物轉化成另一種式 I 化合物，將可根據本方法獲得之異構體混合物分離及將所欲之異構體離析，及/或將可根據本方法獲得之式 I 游離化合物轉化成鹽，或將可根據本方法獲得之式 I 化合物鹽轉化成式 I 游離化合物或另一種鹽。

以上已經就式 I 鹽類所述者可類推適用於前文及後文所列之起始物之鹽類。

這些反應搭配物可以原樣彼此反應，亦即無添加溶劑或稀釋劑，例如以熔融形式。然而，在大部分情況中，有利的是添加惰性溶劑或稀釋劑或其混合物。此類溶劑或稀

釋劑的實例有：芳族、脂族及脂環族烴類及鹵化烴類，例如苯、甲苯、二甲苯、均三甲基苯、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、二丙醚、二異丙醚、二丁醚、第三丁甲醚、乙二醇單甲醚、乙二醇單乙醚、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；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二乙基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基吡咯酮或六甲基磷醯胺；腈類，例如乙腈或丙腈；以及亞碸類，例如二甲亞碸。

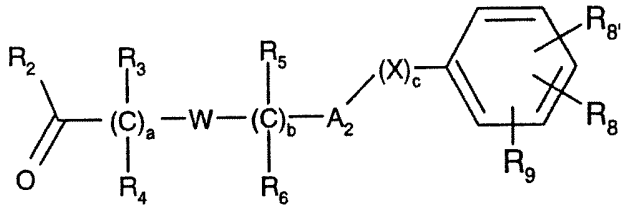
較佳的離去基 Q 是鹵素、甲苯磺酸酯、甲磺酸酯及三氟甲磺酸酯，特佳是鹵素，尤其是氯。

適合幫助反應的鹼有例如：鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物、氫化物、醯胺類、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽、二烷基醯胺類或烷基甲矽烷基醯胺；烷基胺類、伸烷基二胺類，視需要經 N-烷基化、視需要不飽和的環烷胺類，鹼性雜環物，銨氫氧化物，以及碳環族胺類。可提及作為實例者有：氫氧化鈉、氫化鈉、胺基化鈉、甲醇鈉、乙酸鈉、碳酸鈉、正丁醇鉀、氫氧化鉀、碳酸鉀、氫化鉀、二異丙基醯胺化鋰、雙(三甲基甲矽烷基)醯胺化鉀、氫化鈣、三乙基胺、二異丙基乙基胺、三伸乙基二胺、環己基胺、N-環己基-N,N-二甲基胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲基胺基)吡啶、奎寧環酮、N-甲基嗎啉、氫氧化苄基三甲基銨及

1,5-二氮雜二環[5.4.0]十一-5-烯（DBU）。較佳者為二異丙基乙基胺和 4-(N,N-二甲基胺基)吡啶。

此反應最好係在大約 0°C 至大約 100°C，較佳從大約 10°C 至大約 40°C 的溫度下進行。

本發明之進一步標的是製備分別呈游離形式或呈鹽形式之式 II 化合物的方法，舉例來說，本方法特徵在於使式 IV 化合物



IV,

（其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，其中 R_2、R_3、R_4、R_5、R_6、R_8、$R_{8'}$、R_9、W、X、A_2、a、b 及 c 係如在式 I 中所定義者）與無機或有機氟化物及式 R_1-NH_2 化合物（其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，且其中 R_1 係如在式 I 中所定義者）反應，且若須要，將可根據本方法或其他方式得到之分別呈游離形式或鹽形式之式 II 化合物轉化成另一種式 II 化合物，將可根據本方法獲得之異構體混合物分離及將所欲異構體離析，及/或將可根據本方法獲得之式 II 游離化合物轉化成鹽，或將可根據本方法獲得之式 II 化合物鹽轉化成式 II 游離化合物或另一種鹽。

適當的氟化物是氟化鈉、氟化鉀、氟化三甲基甲矽-烷及丙酮合氟化氫。

使羰基化合物（如具有式 IV 者）與氰化物和胺類（如具有分子式 R_6-NH_2 者）反應之一般方法為 Strecker 反應，例如得知於 Organic Synthesis coll. Vol. 3, 88 (1973)中者。

化合物 I 的鹽可以本身已知的方式製備。舉例來說，化合物 I 的酸加成鹽可經由用適當酸或適當離子交換試劑處理而獲得，而鹼加成鹽則是經由用適當鹼或適當離子交換試劑處理而獲得。

化合物 I 的鹽類可以平常方式轉化成游離化合物 I，例如經由用適當鹼性試劑或適當離子交換試劑處理而轉化成酸加成鹽，以及例如經由用適當酸或適當離子交換試劑處理而轉化成鹼加成鹽。

化合物 I 的鹽可以本身已知的方式轉化成化合物 I 的其他鹽；舉例來說，酸加成鹽可被轉化成其他的酸加成鹽，例如經由在適當溶劑中用酸的適當金屬鹽如鈉、鋇或銀鹽，例如用乙酸銀來處理無機酸的鹽如鹽酸鹽，在該溶劑中所形成之無機鹽（如氯化銀）是不溶的，因此會從反應混合物中沈澱出來。

根據方法或反應條件而定，化合物 I 與鹽形成特徵可以游離形式或鹽形式獲得。

化合物 I 亦可以其水合物形式獲得及/或可包含其他溶劑，舉例來說，其係在以固體形式存在之化合物結晶作用中有需要時使用。

化合物 I 可視需要以光學及/或幾何異構體或其混合物

存在。本發明同時關於純的異構體及所有可能的異構體混合物，因而在前後文的各情況中應瞭解此點，即使在每一個情況中並未具體指明立體化學細節亦然。

可根據本方法或其他方式獲得之化合物 I 的非對映異構體混合物，可根據其成分之物化差異而以已知的方式分離成純的非對映異構體，例如藉由分級結晶、蒸餾及/或層析法。

可依此獲得之對映異構體混合物之分離為純的異構體，可藉已知方法達成，例如藉由從光學活性溶劑中再結晶，藉由在手性吸附劑上層析，例如在乙醯基纖維素上之高效能液相層析（HPLC），並藉助於適當的微生物，藉由用特異性固定化酶裂解，經由例如使用手性冠醚類而形成包合錯合物，其中只有一種對映異構體會被錯合。

根據本發明，除了對應異構體混合物的分離之外，非對映異構體或對映異構體合成的周知方法亦可用來獲得純的非對映異構體或對應異構體，例如經由使用具有相對應適當立體化學的離析物來進行本發明之方法。

有利的是離析或合成生物學上更有活性的異構體，例如對映異構體，前提是個別成分具有不同的生物學功效。

在本發明之方法中，所使用之起始物和中間物較佳是可得到一開始所敘述為特別有用之化合物 I 者。

本發明係特別關於在實施例中所說明之製備方法。

根據本發明所使用來製備化合物 I 的新穎起始物和中間物，以及其用途及其製備方法同樣地構成本發明之標的。

根據本發明之化合物 I 在它們廣大的活性範圍方面是值得注意的，並且是用於害蟲控制中的有價值活性成分，特別包括控制溫血動物，特別是牲畜和馴養動物體內和身上及植物上的體內和體外寄生蟲，尤其是蠕蟲，同時又可為溫血動物、魚和植物等所充分耐受。

在本發明之上下文中，應瞭解"體外寄生蟲"一詞係特別意謂昆蟲、蟎類及蜱類。這些包括下列各目的昆蟲：鱗翅目（*Lepidoptera*）、鞘翅目（*Coleoptera*）、同翅目（*Homoptera*）、異翅目（*Heteroptera*）、雙翅目（*Diptera*）、纓翅目（*Thysanoptera*）、直翅目（*Orthoptera*）、蝨目（*Anoplura*）、蚤目（*Siphonaptera*）、食毛目（*Mallophaga*）、纓尾目（*Thysanura*）、等翅目（*Isoptera*）、嚙蟲目（*Psocoptera*）及膜翅目（*Hymenoptera*）。然而，特別可提及的體外寄生蟲是滋擾人類或動物並傳染病原者，如蠅類，例如普通家蠅（*Musca domestica*）、澳洲灌蠅（*Musca vetustissima*）、秋家蠅（*Musca autumnalis*）、夏廁蠅（*Fannia canicularis*）、肉蠅（*Sarcophaga carnaria*）、銅綠蠅（*Lucilia cuprina*）、牛皮蠅（*Hypoderma bovis*）、紋皮蠅（*Hypoderma lineatum*）、綠臀金蠅（*Chrysomyia chloropyga*）、人皮蠅（*Dermatobia hominis*）、螺旋蛆蠅（*Cochliomyia hominivorax*）、普通馬蠅（*Gasterophilus intestinalis*）、羊狂蠅（*Oestrus ovis*）、螯蠅（*Stomoxys calcitrans*）、擾血蠅（*Haematobia irritans*），及蚊類（長角亞目(*Nematocera*)），例如蚊科

（*Culicidae*）、蚋科（*Simuliidae*）、蛾蚋科（*Psychodidae*），以及吸血寄生蟲，例如跳蚤，如貓櫛頭蚤（*Ctenocephalides felis*）和犬櫛頭蚤（*Ctenocephalides canis*）（貓和狗跳蚤）、印度鼠蚤（*Xenopsylla cheopis*）、人蚤（*Pulex irritans*）、穿皮潛蚤（*Dermatophilus penetrans*），蝨子，例如羊蝨（*Damalina ovis*）、人蝨（*Pediculus humanis*），馬廄蠅和馬蠅，（虻科(*Tabanidae*)），血虻屬（*Haematopota*）亞種，如雨生血虻（*Haematopota pluvialis*），虻屬（*Tabanidea*）亞種，如黑條馬虻（*Tabanus nigrovittatus*），斑虻屬（*Chrysopsinae*）亞種，如盲斑虻（*Chrysops caecutiens*），嗤嗤蠅，如舌蠅種（*Glossinia*），嚙咬昆蟲，特別是蟑螂，例如德國蜚蠊（*Blatella germanica*）、東方蜚蠊（*Blatta orientalis*）、美洲蜚蠊（*Periplaneta americana*），蜱類，如雞皮刺蜱（*Dermanyssus gallinae*）、疥蜱（*Sarcoptes scabiei*）、羊痒蜱（*Psoroptes ovis*）及瘡蜱屬（*Psorergates*）亞種，最後同樣重要的是，蜱類。後者屬於蛛形綱蜱目（*Acarina*）。已知的蜱代表有，例如：牛蜱屬（*Boophilus*）、鈍眼蜱屬（*Amblyomma*）、暗眼蜱屬（*Anocentor*）、革蜱屬（*Dermacentor*）、血蜱屬（*Haemaphysalis*）、璃眼蜱屬（*Hyalomma*）、硬蜱屬（*Ixodes*）、扇革蜱屬（*Rhipicentor*）、巨肢蜱屬（*Margaropus*）、扇頭蜱屬（*Rhipicephalus*）、銳緣蜱屬（*Argas*）、耳蜱屬（*Otobius*）、銳緣蜱屬（*Ornithodoros*）及諸如此類，這些偏好侵

擾溫血動物，包括農場動物，如牛、豬、綿羊及山羊，家禽，如雞、火雞和雁，長毛動物，如貂、狐狸、栗鼠、兔子及諸如此類，以及寵物，例如貓和狗，還有人類。

根據本發明之化合物 I 亦可有效對抗顯示常態敏感性以及有抵抗力之動物害蟲（如蛛形綱蜱目昆蟲和代表物）的所有或個別發育階段。根據本發明之活性成分的殺蟲、殺卵及/或殺蟎的作用可在過程中直接表現，亦即立刻或在一段時間之後例如在蛻變期間殺死害蟲，或摧毀其卵，或是間接地表現，例如在降低產卵及/或降低孵化率方面，其中良好的作用相當於至少 50 至 60% 的致死率（死亡率）。

化合物 I 亦可用來對抗衛生害蟲，特別是雙翅目的麻蠅科（*Sarcophagidae*）、按蚊科（*Anophilidae*）及蚊科；直翅目、網翅目（*Dictyoptera*）（例如蜚蠊科（*Blattidae*））及膜翅目（例如蟻科（*Formicidae*））。

化合物 I 在寄生植物之蟎及昆蟲的情況中亦具有持續的活性。在蛛形綱蜱目的蜘蛛蟎情況中，它們可有效對抗葉蟎科（*Tetranychidae*）（葉蟎屬（*Tetranychus*）亞種和全爪蟎屬（*Panonychus*）亞種）的卵、幼蟲及成蟲。

它們具有高活性對抗同翅目之吸血昆蟲，特別是對抗蚜科（*Aphididae*）、飛蝨科（*Delphacidae*）、葉蟬科（*Cicadellidae*）、木蝨科（*Psyllidae*）、*Loccidae*、盾介殼蟲科（*Diaspididae*）及癭蟎科（*Eriophydidae*）（例如柑橘銹蜱）；半翅目（*Hemiptera*）、異翅目及纓翅目等目的害蟲，以及鱗翅目、鞘翅目、雙翅目及直翅目等食植物昆蟲。

它們亦同樣適合作為對抗土壤中害蟲的土壤殺昆蟲劑。

式 I 化合物因此可有效對抗在農作物，如穀類、棉、米、玉蜀黍、大豆、馬鈴薯、蔬菜、水果、煙草、啤酒花、柑橘水果、酪梨及其他作物上吸食與吃食昆蟲的所有發育階段。

式 I 化合物亦可有效對抗根瘤線蟲屬（*Meloidogyne*）、包囊線蟲屬（*Heterodera*）、根腐線蟲屬（*Pratylenchus*）、莖線蟲屬（*Ditylenchus*）、穿孔線蟲屬（*Radopholus*）、里茶線蟲屬（*Rizoglyphus*）等屬的植物線蟲。

特別言之，這些化合物可有效對抗蠕蟲，其中體內寄生線蟲和吸蟲可為哺乳動物和家禽，如綿羊、豬、山羊、牛、馬、驢、狗、貓、天竺鼠及奇異鳥類等之嚴重疾病的成因。這種指標的典型線蟲有：血線蟲屬（*Haemonchus*）、毛樣線蟲屬（*Trichostrongylus*）、牛胃絲蟲屬（*Ostertagia*）、線蟲屬（*Nematodirus*）、古巴毛樣線蟲屬（*Cooperia*）、蛔蟲屬（*Ascaris*）、仰口線蟲屬（*Bunostonum*）、管口線蟲屬（*Oesophagostonum*）、炭伯特條蟲屬（*Charbertia*）、鞭蟲屬（*Trichuris*）、圓蟲屬（*Stronglus*）、滴蟲屬（*Trichonema*）、有絲狀肺蟲屬（*Dictyocaulus*）、毛細線蟲屬（*Capillaria*）、盲腸蟲屬（*Heterakis*）、毒蛔蟲屬（*Toxocara*）、蛔蟲屬（*Ascaridia*）、蟯蟲屬（*Oxyuris*）、鉤蟲屬（*Ancylostoma*）、鉤蟲屬（*Uncinaria*）、犬蛔蟲屬（*Toxascaris*）及副蛔蟲屬（

Parascaris）。吸蟲特別包括片吸蟲科（*Fasciolideae*），特別是肝片吸蟲（*Fasciola hepatica*）。亦令人驚訝且意外地顯示，式 I 化合物具有對抗對許多活性物質有耐藥性之線蟲的超高活性。這點可經由 LDA 試驗在活體外證實，以及在活體內，例如在蒙古種沙鼠和綿羊體內證實。亦可證明的是，活性物質用來殺死扭旋血線蟲或柱桿狀毛樣線蟲中敏感種系的量，亦可充分有效地控制對苯并咪唑、左旋咪唑（levamisole）及大環內酯（例如愛滅蟲(ivermectin)）有耐藥性的對應種系。

線蟲屬、古巴毛樣線蟲屬及管口線蟲屬之某些種會侵染宿主動物的腸道，其他血線蟲屬和牛胃絲蟲屬之其他種係寄生於胃中，而有絲狀肺蟲屬之其他種則寄生於肺組織中。絲蟲科（*Filariidae*）和剛毛蟲科（*Setariidae*）之寄生蟲可見於內部細胞組織和器官如心臟、血管、淋巴管及皮下組織之中。特別值得注意的寄生蟲是狗的心蟲，即犬心絲蟲（*Dirofilaria immitis*）。式 I 化合物對抗這些寄生蟲是高度有效的。

可用式 I 化合物控制的害蟲亦包括來自條蟲綱（*Cestoda*）（帶蟲）者，例如中孔條蟲科（*Mesocestoidae*），特別是中殖孔條蟲屬（*Mesocestoides*）者，尤其是線紋中殖孔條蟲（*M. Lineatus*）；囊宮科（*Dilepididae*），特別是犬複孔條蟲（*Dipylidium caninum*），複孔條蟲屬（*Joyeuxiella*）亞種，尤其是帕氏複孔條蟲（*Joyeuxiella pasquali*），及複孔條蟲屬（*Diplopylidum*）亞種；及條蟲

科（*Taeniidae*），特別是豆狀條蟲（*Taenia pisiformis*）、獐條蟲（*Taenia cervi*）、羊條蟲（*Taenia ovis*）、水泡條蟲（*Taneia hydatigena*）、多頭條蟲（*Taenia multiceps*）、巨頸條蟲（*Taenia taeniaeformis*）、鏈形條蟲（*Taenia serialis*）及刺球屬（*Echinocuccus*）亞種，特佳者為水泡條蟲、羊條蟲、多頭條蟲、鏈形條蟲；細粒刺球條蟲（*Echinocuccus granulosus*）和多房刺球條蟲（*Echinococcus multilocularis*），以及多頭條蟲（*Multiceps multiceps*）。

最特別的是，水泡條蟲、豆狀條蟲、羊條蟲、巨頸條蟲、多頭條蟲（*Multiceps multiceps*）、帕氏複孔條蟲、犬複孔條蟲、中殖孔條蟲屬亞種、細粒刺球條蟲及多房刺球條蟲係同時與狗貓身上或體內的犬心絲蟲、鉤蟲屬亞種、弓蛔蟲屬（*Toxocara*）亞種及/或犬鞭蟲（*Trichuris vulpis*）及上述線蟲和條蟲一起受控制。

此外，式 I 化合物適合控制對人類致病的寄生蟲。其中，出現在消化道中的典型代表為鉤蟲屬、美洲鉤蟲屬（*Necator*）、蛔蟲屬（*Ascaris*）、類圓蟲屬（*Strongyloides*）、旋毛蟲屬（*Trichinella*）、毛細線蟲屬（*Capillaria*）、鞭蟲屬（*Trichuris*）及蟯蟲屬（*Enterobius*）者。本發明之化合物亦可有效對抗來自絲蟲科之伍氏絲蟲屬（*Wuchereria*）、布氏絲蟲屬（*Brugia*）、蟠尾絲蟲屬（*Onchocerca*）及羅阿絲蟲屬（*Loa*）等的寄生蟲，其係出現在血液、組織及各種器官之中，另可對抗龍線蟲屬（*Dracunculus*）及類圓蟲屬和旋毛蟲屬之寄生蟲，其尤其會感染胃腸道。

除此之外，式 I 化合物亦可有效對抗對植物、人類和動物有害且致病的真菌。

根據本發明之式 I 化合物的良好殺蟲活性，相當於所提及害蟲之至少 50-60% 死亡率。特定言之，式 I 化合物在格外長期的功效持續時間方面是值得注意的。

【實施方式】

式 I 化合物較佳係以原始形式使用，或較佳係與習用於調配技藝之佐藥一起使用，並因此可以已知方式處理而得到例如可乳化之濃縮物、可直接稀釋之溶液、稀乳化液、可溶性粉劑、顆粒或包封於聚合物質中的微囊。如同組成物，施用方法係根據所欲目的和現行情況做選擇。

調配物，亦即包含式 I 活性成分之藥劑、製劑或組成物，或這些活性成分與其他活性成分及選用固體或液體添加劑之組合，都是以本身已知之方式製得，例如經由將活性成分與增量劑，例如與溶劑、固體載劑及選用的界面活性化合物（界面活性劑）等均勻地混合及/或研磨而製得。

所討論之溶劑可為：醇類，如乙醇、丙醇或丁醇，及二醇類，以及其醚類和酯類，如丙二醇、二丙二醇醚、乙二醇、乙二醇單甲醚或乙二醇單乙醚，酮類，如環己酮、異佛爾酮或二丙酮醇，強極性溶劑，如 N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲亞碸或二甲基甲醯胺或水，植物油，如菜油、蓖麻油、椰子油或大豆油，若適當時還有矽油。

用於溫血動物來控制蠕蟲的較佳施用形式包括：溶液、乳化液、懸浮液（浸敷劑）、飼料添加劑、粉劑、片劑

（包括泡騰片劑）、大丸劑、膠囊、微膠囊及潑灑劑（pour-on）等調配物，其中調配物賦形劑之生理相容性必須列入考慮。

適合片劑和大丸劑之黏合劑可為可溶於水或醇之經化學改性聚合天然物，如澱粉、纖維素或蛋白質衍生物（例如甲基纖維素、羧甲基纖維素、乙基羥乙基纖維素、蛋白質，如玉米醇溶蛋白、明膠及諸如此類），以及合成聚合物，如聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮及諸如此類。片劑亦包含填充劑（例如澱粉、微晶纖維素、糖、乳糖及諸如此類）、潤滑劑及崩解劑。

如果驅蟲藥係以飼料濃縮物形式存在，則所使用載體為例如高性能飼料、飼料穀粒或蛋白質濃縮物。此等飼料濃縮物或組成物除了活性成分之外，還可包含添加劑、維生素、抗生素、化學療藥或其他殺蟲劑，主要是抑菌劑、抑真菌劑、抑球菌劑，或甚至是激素製劑、具有組成作用之物質或促進生長、影響屠宰動物肉質或以其他方式有益於生物的物質。如果組成物或被包含於其中之式 I 活性成分係直接被添加至飼料或飲水槽中，則所調配飼料或飲水包含最好濃度在大約 0.0005 至 0.02 重量%（5-200 ppm）之活性成分。

根據本發明之式 I 化合物可單獨使用或與其他殺生物劑組合使用。它們可與具有相同活性範圍之殺蟲劑結合以例如增強活性，或者與具有其他活性範圍之物質結合以例如增廣活性範圍。添加所謂的拒斥劑亦為合理的。如果想

要將活性範圍擴展至體內寄生蟲，例如蠕蟲類方面，則式I化合物適合與具有殺體內寄生蟲性質之物質組合。當然，它們亦可與抗菌組成物組合使用。由於式I化合物代表殺成蟲劑，亦即，由於它們對抗目標寄生蟲之成蟲階段特別有效，故添加另外攻擊目標寄生蟲幼蟲階段的殺蟲劑可非常有利。以這種方式，即可含括大多數造成重大經濟損害的寄生蟲。此外，此作用對於避免耐藥性之生成亦有實質的貢獻。許多組合亦可導致協同效應，亦即可降低活性成分的總量，這從經濟觀點來看是合乎理想的。幾組較佳的組合配對物及特佳的組合配對物係提述於后，該組合除了式I化合物之外，還可包含此等配對物中之一或多者。

混合物中適當的配對物可為殺生物劑，例如具有不同作用機制之殺昆蟲劑和殺蟎劑，其係提述於后且已為熟諳此技藝者充分瞭解很長的時間，例如幾丁質合成抑制劑、生長調節劑；充作幼蟲激素之活性成分；充作殺成蟲劑之活性成分；廣效殺昆蟲劑、廣效殺蟎劑和殺線蟲劑；以及熟知的驅蟲藥及止蟲和/或止蛛形綱蜱目成員的物質，該拒斥劑或剝除劑。

適當殺昆蟲劑和殺蟎劑之非限制性實例有：

1. 阿巴汀（Abamectin）	8. 納得亞滅寧（Alphamethrin）	13. 谷速松（Azinphos M）
2. AC 303 630	9. 三亞蟎（Amitraz）	14. 亞環錫（Azocyclotin）
3. 毆殺松（Acephat）	10. 阿維菌素B1（Avermectin B1）	15. 枯草桿菌毒素（*Bacillus subtil.* toxin）
4. 阿納寧（Acrinathrin）	11. AZ 60541	16. 免敵克（Bendiocarb）
5. 棉鈴威（Alanycarb）	12. 谷速松A（Azinphos A）	17. 免扶克（Benfuracarb
6. 得滅克（Aldicarb）		
7. 亞滅寧（α-Cypermethrin）		

）
18. 免速達（Bensultap）
19. 貝他-賽扶寧（β-Cyfluthrin）
20. 畢芬寧（Bifenthrin）
21. 丁基滅必蝨（BPMC）
22. 布芬寧（Brofenprox）
23. 溴磷松（Bromophos A）
24. 必克蝨（Bufencarb）
25. 布芬淨（Buprofezin）
26. 佈嘉信（Butocarboxin）
27. 丁基畢達本（Butylpyridaben）
28. 硫線磷（Cadusafos）
29. 加保利（Carbaryl）
30. 加保扶（Carbofuran）
31. 加芬松（Carbophenthion）
32. 培丹（Cartap）
33. 氯乙克（Chloethocarb）
34. 氯乙殺松（Chlorethoxyfos）
35. 克凡派（Chlorfenapyr）
36. 克福隆（Chlorfluazuron）
37. 氯甲磷（Chlormephos）
38. 陶斯松（Chlorpyrifos）
39. 列滅寧（Cis-Resmethrin）
40. 克賽寧（Clocythrin）
41. 克芬蜡（Clofentezin）
42. 氰乃松（Cyanophos）
43. 乙氰菊酯（Cycloprothrin）
44. 賽扶寧（Cyfluthrin）
45. 三環錫（Cyhexatin）
46. D 2341
47. 第滅寧（Deltamethrin）

48. 亞滅松（Demeton M）
49. 滅賜松（Demeton S）
50. 滅賜松（Demeton-S-methyl）
51. 除線磷（Dichlofenthion）
52. 雙利松（Dicliphos）
53. 乙硫磷（Diethion）
54. 二福隆（Diflubenzuron）
55. 大滅松（Dimethoat）
56. 樂果（Dimethylvinphos）
57. 大克松（Dioxathion）
58. DPX-MP062
59. 護粒松（Edifenphos）
60. 因滅汀（Emamectin）
61. 安殺番（Endosulfan）
62. 益化利（Esfenvalerat）
63. 乙硫苯威（Ethiofencarb）
64. 愛殺松（Ethion）
65. 依芬寧（Ethofenprox）
66. 普伏松（Ethoprophos ）
67. 益多松（Etrimphos）
68. 芬滅松（Fenamiphos）
69. 芬殺醌（Fenazaquin）
70. 芬佈賜（Fenbutatin oxide）
71. 撲滅松（Fenitrothion）
72. 丁苯威（Fenobucarb）
73. 芬硫克（Fenothiocarb）
74. 芬諾克（Fenoxycarb）
75. 芬普寧（Fenpropathrin）
76. 芬比（Fenpyrad）
77. 芬普蜡（Fenpyroximate）
78. 芬殺松（Fenthion）

79. 芬化利（Fenvalerate）
80. 芬普尼（Fipronil）
81. 扶吉胺（Fluazinam）
82. 氟啶蜱脲（Fluazuron）
83. 氟蜡脲（Flucycloxuron）
84. 護賽寧（Flucythrinat）
85. 氟芬隆（Flufenoxuron）
86. 氟芬寧（Flufenprox）
87. 大福松（Fonophos）
88. 福木松（Formothion）
89. 福賽絕（Fosthiazat）
90. 扶芬寧（Fubfenprox）
91. HCH
92. 飛達松（Heptenophos）
93. 六伏隆（Hexaflumuron）
94. 合賽多（Hexythiazox）
95. 羥平（Hydroprene）
96. 益達胺（Imidacloprid）
97. 對蟲有效之真菌
98. 對蟲有效之線蟲
99. 對蟲有效之病毒
100. 丙基喜樂松（Iprobenfos）
101. 亞芬松（Isofenphos）
102. 滅必蝨（Isoprocarb）
103. 加福松（Isoxathion）
104. 愛滅蟲（Ivermectin）
105. 賽洛寧（λ-Cyhalothrin）
106. 祿芬隆（Lufenuron）
107. 馬拉松（Malathion）
108. 滅加松（Mecarbam）
109. 甲亞碸磷（Mesulfenphos）

110. 聚乙醛（Metaldehyde）
111. 達馬松（Methamidophos）
112. 滅賜克（Methiocarb））
113. 納乃得（Methomyl）
114. 美賜平（Methoprene）
115. 速滅威（Metolcarb）
116. 美文松（Mevinphos）
117. 密滅汀（Milbemectin）
118. 氰滿素（Moxidectin）
119. 乃力松（Naled）
120. NC 184
121. NI-25，亞滅培（Acetamiprid）
122. 耐田吡胺（Nitenpyram）
123. 歐滅松（Omethoat）
124. 毆殺滅（Oxamyl）
125. 滅多松（Oxydemethon M）
126. 異碘磷（Oxydeprofos）
127. 巴拉松（Parathion）
128. 甲基巴拉松（Parathion-methyl）
129. 百滅寧（Permethrin）
130. 賽達松（Phenthoate）
131. 福瑞松（Phorate）
132. 裕必松（Phosalone）
133. 益滅松（Phosmet）
134. 巴賽松（Phoxim

135. 比加普（Pirimicarb）
136. 亞特松 A（Pirimiphos A）
137. 亞特松 M（Pirimiphos M）
138. 普滅克（Promecarb）
139. 加護松（Propaphos）
140. 安丹（Propoxur）
141. 普硫松（Prothiofos）
142. 飛克松（Prothoate）
143. 白克松（Pyrachlophos）
144. 必芬松（Pyradaphenthion）
145. 必滅寧（Pyresmethrin）
146. 必列寧（Pyrethrum）
147. 畢達本（Pyridaben）
148. 畢汰芬（Pyrimidifen）
149. 百利普芬（Pyriproxyfen）
150. RH 5992
151. 甲氧基醯肼（RH-2485）
152. 殺力松（Salithion）
153. 西布松（Sebufos）
154. 矽護芬（Silafluofen）
155. 賜諾殺（Spinosad）
156. 硫特普（Sulfotep）
157. 硫普松（Sulprofos）
158. 得芬諾（Tebufenozide）
159. 吡蟎胺（Tebufenpyrad）
160. 特必林松（Tebupirimfos）
161. 得福隆

（Teflubenzuron）
162. 七氟菊酯（Tefluthrin）
163. 亞培松（Temephos）
164. 特安（Terbam）
165. 托福松（Terbufos）
166. 四氯文松（Tetrachlorvinphos）
167. 噻芬殺（Thiafenox）
168. 硫敵克（Thiodicarb）
169. 硫伐隆（Thiofanox）
170. 磷化鋅（Thionazin）
171. 蘇力菌素（Thuringiensin）
172. 泰滅寧（Tralomethrin）
173. 三亞辛（Triarthene）
174. 唑蚜威（Triazamate）
175. 三落松（Triazophos）
176. 三速隆（Triazuron）
177. 三氯松（Trichlorfon
178. 三福隆（Triflumuron）
179. 三滅克（Trimethacarb）
180. 繁米松（Vamidothion）
181. 滅克蝨（XMC (3,5,-二甲苯基甲基胺基甲酸酯)）
182. 滅殺威（Xylylcarb）
183. YI 5301/5302
184. 傑他賽滅寧（ζ-Cypermethrin）
185. 傑他滅寧（Zetamethrin）

適當驅蟲藥之非限制性實例係提述於后，除了驅蟲活性外，其中一些代表例還具有殺昆蟲與殺蜱活性，且部分已經包含在上述列表中。

(A1) 吡喹酮（Praziquantel）= 2 環己羰基-4-酮基-1,2,3,6,7,11b-六氫-4H-吡啉并[2,1-α]異喹啉

(A2) 氯散特（Closantel）= 3,5-二碘-N-[5-氯-2-甲基-4-(a-氰基-4-氯苄基)苯基]-水楊醯胺

(A3) 三氯苯唑（Triclabendazole）= 5-氯-6-(2,3-二氯苯氧基)-2-甲硫基-1H-苯并咪唑

(A4) 左美素（Levamisol）= L-(-)-2,3,5,6-四氫-6-苯基咪唑并[2,1b]噻唑

(A5) 甲苯咪唑（Mebendazole）= (5-苯甲醯基-1H-苯并咪唑-2-基)胺基甲酸甲酯

(A6) 發光膾菇素（Omphalotin）= WO 97/20857 中所揭示之真菌發光膾菇（*Omphalotus olearius*）之大環發酵產物

(A7) 阿巴汀 = 阿維菌素 B1

(A8) 愛滅蟲 = 22,23-二氫阿維菌素 B1

(A9) 氧滿素（Moxidectin）= 5-O-去甲基-28-去氧-25-(1,3-二甲基-1-丁-烯基)-6,28 環氧-23-(甲氧基亞胺基)-米貝黴素 B

(A10) 多滅蟲（Doramectin）= 25 環己基-5-O-去甲基-25-去(1-甲基丙基)-阿維菌素 A1a

(A11) 密滅汀 = 米貝黴素 A3 與米貝黴素 A4 之混合物

(A12) 密滅汀肟（Mibemycinoxim） = 密滅汀之 5-肟

適當拒斥劑和剝除劑之非限制性實例有：

(R1) DEET (N,N-二乙基-間甲苯甲醯胺)

(R2) KBR 3023 N-丁基-2-氧羰基-(2-羥基)-哌啶

(R3) 賽滅唑（Cymiazole） = N,-2,3-二氫-3-甲基-1,3-噻唑-2-亞基-2,4-二甲苯胺

該混合物中之配對物是此領域專家所熟知者。大多數係說明於各種版本的農藥手冊（Pesticide Manual, The British C rop Protection Council, London）中，而其他則在各種版本的默克索引（The Merck Index, Merck&Co., Inc., Rahway, New Jersey, USA）或專利文獻中有所說明。因此，下列表單係限於可發現彼等作為實例的一些地方。

(I)2-甲基-2-(甲硫基)丙醛-O-甲基胺基甲醯肟（得滅克），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 26 頁；

(II)S-(3,4-二氫-4-酮基苯并[d]-[1,2,3]-三呾-3-基甲基)O,O-二甲基-二硫代磷酸酯（谷速松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 67 頁；

(III)乙基-N-[2,3-二氫-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基氧羰基-(甲基)胺基硫]-N-異丙基-β-胺基丙酸酯（免扶克），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 96 頁；

(IV)2-甲基聯苯基-3-基甲基-(Z)-(1RS)-順-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙-1-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯（畢芬寧），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 118 頁；

(V)2-第三丁亞胺基-3-異丙基-5-苯基-1,3,5-噻二啡-4-酮（布芬淨），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 157 頁；

(VI)2,3-二氫-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基-甲基胺基甲酸酯（加保扶），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 186 頁；

(VII)2,3-二氫-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基-(二丁基胺基硫)甲基胺基甲酸酯（好年冬(Carbosulfan)），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 188 頁；

(VIII)S,S'-(2-二甲胺基三亞甲基)-雙(硫代胺基甲酸酯)（培丹），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 193 頁；

(IX)1-[3,5-二氯-4-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶氧基)苯基]-3-(2,6-二氟苯甲醯基)-脲（克福隆），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 213 頁；

(X)O,O-二乙基-O-3,5,6-三氯-2-吡啶基-硫代磷酸酯（陶斯松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 235 頁；

(XI)(RS)-α-氰基-4-氟-3-苯氧基苄基-(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-二氯乙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯（賽扶寧），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 293 頁；

(XII)(S)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(Z)-(1R,3R)-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯與(R)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(Z)-(1R,3R)-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯之混合物（賽洛寧），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 300 頁；

(XIII)由(S)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(Z)-(1R,3R)-3-(2,2-二氯乙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯與(R)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(1S,3S)-3-(2,2-二氯乙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯所組成之外消旋物（亞滅寧），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 308 頁；

(XIV)(S)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(1RS,3RS,1RS,3RS)-3-(2,2-二氯乙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯之立體異構體混合物（傑他賽滅寧），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 314 頁；

(XV)(S)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(1R,3R)-3-(2,2-二溴乙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯（第滅寧），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 344 頁；

(XVI)1-(4-氯苯基)-3-(2,6-二氟苯甲醯基)脲（二福隆），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 395 頁；

(XVII)(1,4,5,6,7,7-六氯-8,9,10-三降冰片-5-烯-2,3-亞基雙亞甲基)-亞硫酸酯（安殺番），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 459 頁；

(XVIII)α-乙硫基-對甲苯基-甲基胺基甲酸酯（乙硫苯威），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 479 頁；

(XIX)O,O-二甲基-O-4-硝基-間甲苯基-硫代磷酸酯（撲滅松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 514 頁；

(XX)2-第二丁基苯基-甲基胺基甲酸酯（丁苯威），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 516 頁；

(XXI)(RS)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(RS)-2-(4-氯苯基)-3-甲基丁酸酯（芬化利），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 539 頁；

(XXII)S-[甲醯基(甲基)胺基甲醯基甲基]-O,O-二甲基-二硫代磷酸酯（福木松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 625 頁；

(XXIII)4-甲硫基-3,5-二甲苯基-甲基胺基甲酸酯（滅賜克），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 813 頁；

(XXIV)7-氯二環[3.2.0]庚-2,6-二-烯-6-基-二甲基磷酸酯（飛達松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 670 頁；

(XXV)1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-N-硝基亞咪唑-烷-2-基胺（益達胺），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 706 頁；

(XXVI)2-異丙基苯基-甲基胺基甲酸酯（滅必蝨），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 729 頁；

(XXVII)O,S-二甲基-胺基硫代磷酸酯（達馬松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 808 頁；

(XXVIII)S-甲基-N-(甲胺基甲醯氧基)硫代乙醯亞胺酯（納乃得），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 815 頁；

(XXIX)3-(二甲氧基膦醯氧基)丁-2-烯酸甲酯（美文松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 844 頁；

(XXX)O,O-二乙基-O-4-硝基苯基-硫代磷酸酯（巴拉松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 926 頁；

(XXXI)O,O-二甲基-O-4-硝基苯基-硫代磷酸酯（甲基巴拉松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 928 頁；

(XXXII)S-6-氯-2,3-二氫-2-酮基-1,3-苯并噁唑-3-基甲基-O,O-二乙基-二硫代硫酸酯（裕必松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 963 頁；

(XXXIII)2-二甲胺基-5,6-二甲基嘧啶-4-基-二甲基胺基甲酸酯（比加普），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 985 頁；

(XXXIV)2-異丙氧基苯基-甲基胺基甲酸酯（安丹），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1036 頁；

(XXXV)1-(3,5-二氯-2,4-二氟苯基)-3-(2,6-二氟苯甲醯基)脲（得福隆），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1158 頁；

(XXXVI)S-第三丁基硫甲基-O,O-二甲基-二硫代磷酸酯（托福松），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1165 頁；

(XXXVII)(3-第三丁基-1-二甲基胺基甲醯-1H-1,2,4-三唑-5-基硫)-乙酸乙酯（唑蚜威），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1224 頁；

(XXXVIII)阿巴汀，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The

British Crop Protection Council, London），第 3 頁；

(XXXIX)2-第二丁基苯基-甲基胺基甲酸酯（丁苯威），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 516 頁；

(XL)N-第三丁基-N-(4-乙基苯甲醯基)-3,5-二甲基苯并醯肼（得芬諾），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1147 頁；

(XLI)(±)-5-胺基-1-(2,6-二氯-α,α,α-三氟-對甲苯基)-4-三氟甲基-亞磺醯基吡唑-3-腈（芬普尼），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 545 頁；

(XLII)(RS)-α-氰基-4-氟-3-苯氧基苄基-(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-二氯乙-烯基)-2,2-二甲基環丙-烷羧酸酯（貝他-賽扶寧）之混合物，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 295 頁；

(XLIII)(4-乙氧基苯基)-[3-(4-氟-3-苯氧基苯基)丙基](二甲基)矽-烷（矽護芬），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1105 頁；

(XLIV)(E)-α-(1,3-二甲基-5-苯氧基吡唑-4-基-亞甲基胺基氧)-對甲苯甲酸第三丁酯（芬普蟎），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 530 頁；

(XLV)2-第三丁基-5-(4-第三丁基苄硫基)-4-氯噠哄-3(2H)-酮（畢達本），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1161 頁；

(XLVI)4-[[4-(1,1-二甲基苯基)苯基]乙氧基]-喹唑啉（芬殺醌），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 507 頁；

(XLVII)4-苯氧基苯基-(RS)-2-(吡啶氧基)丙基-醚（百利普芬），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1073 頁；

(XLVIII)5-氯-N-{2-[4-(2-乙氧基乙基)-2,3-二甲基苯氧基]乙基}-6-乙基嘧啶-4-胺（畢汰芬），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1070 頁；

(XLIX)(E)-N-(6-氯-3-吡啶基甲基)-N-乙基-N-甲基-2-硝基亞乙-烯基二胺（耐田吡胺），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 880 頁；

(L)(E)-N^1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-N^2-氰基-N^1-甲基乙脒（NI-25，亞滅培），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 9 頁；

(LI)阿維菌素 B_1，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 3 頁；

(LII)取自植物對蟲有效之提取物，尤指(2R,6aS,12aS)-1,2,6,6a,12,12a-六氫-2-異丙-烯基-8,9-二甲氧基-色-烯并

[3,4-b]呋[2,3-h]色-烯-6-酮（魚藤精(Rotenone)），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1097 頁；及取自印度苦楝樹皮（*Azadirachta indica*）之提取物，尤指印楝素（azadirachtin），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 59 頁；

(LIII)含有對蟲有效之線蟲的製劑，較佳係含有細菌蚤蠅異小桿線蟲（*Heterorhabditis bacteriophora*）與蟾蜍異小桿線蟲（*Heterorhabditis megidis*），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 671 頁；褐夜蛾線蟲（*Steinernema feltiae*），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1115 頁，及螻蛄線蟲（*Steinernema scapterisci*），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1116 頁；

(LIV)可得自枯草桿菌之製劑，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 72 頁；或得自蘇力菌菌株之製劑，但分離自 GC91 或 NCTC11821 之化合物除外，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 73 頁；

(LV)含有對蟲有效之真菌的製劑，較佳係含有蠟蚧輪枝孢菌（*Verticillium lecanii*），出自農藥手冊第 11 版

(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1266 頁；卵孢白殭菌（*Beauveria brogniartii*），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 85 頁，及白殭菌（*Beauveria bassiana*），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 83 頁；

(LVI)含有對蟲有效之病毒的製劑，較佳係含有松黃葉蜂（*Neodipridon Sertifer*）NPV，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1342 頁；甘藍夜蛾（*Mamestra brassicae*）NPV，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 759 頁，及蘋果蠹蛾顆粒體（*Cydia pomonella granulosis*）病毒，出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 291 頁；

(CLXXXI) 7-氯-2,3,4a,5-四氫-2-[甲氧基羰基(4-三氟甲氧基苯基)-胺基甲醯基]吲哚[1,2e]噁唑啉-4a-羧酸甲酯（DPX-MP062，吲哚氧克(Indoxycarb)），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 453 頁；

(CLXXXII) N'-第三丁基-N'-(3,5-二甲基苯甲醯基)-3-甲氧基-2-甲基苯并醯肼（RH-2485，甲氧基醯肼（Methoxyfenozide）），出自農藥手冊第 11 版(1997)（The British Crop Protection Council, London），第 1094 頁；

(CLXXXIII) N'-[4-甲氧基-聯苯基-3-基]-肼羧酸異丙酯（D 2341），出自英國農作物保護會議（Brighton Crop Protention Conference, 1996）487-493；及

(R2) 摘要全書（Book of Abstracts, 212th ACS National Meeting Orlando, FL, August 25-29 (1995), AGRO-020）。出版商：American Chemical Society, Washington, D.C. CONEN: 63BFAF。

作為上述細節的結果，本發明之進一步必要方面係關於用以控制溫血動物身上寄生蟲的組合製劑，其除了式 I 化合物之外，還包含至少一種具有相同或不同活性範圍之其他活性成分和至少一種生理上可接受之載劑。本發明並不限於二倍的組合。

一般而言，根據本發明之驅蟲組成物包含 0.1 至 99 重量%，特別是 0.1 至 95 重量%之式 I 活性成分或其混合物，以及 99.9 至 1 重量%，特別是 99.8 至 5 重量%之固體或液體添加劑，包括 0 至 25 重量%，特別是 0.1 至 25 重量%之界面活性劑。

根據本發明之組成物於待治療動物之施用可以局部、經口、非經腸胃或皮下等方式進行，組成物則係以溶液、乳化液、懸浮液（浸敷劑）、粉劑、片劑、大丸劑、膠囊及潑灑劑調配物等形式存在。

潑灑或點敷（spot-on）方法包括將式 I 化合物施用於

動物皮膚或皮毛的特定部位，最好是施用於頸部或脊骨。此係經由例如將潑灑或點敷調配物拭抹或噴霧至皮毛上相當小的區域上來進行，活性物質則由於調配物成分之擴散本性並藉助於動物的運動，而自該處幾乎自動地分散於毛皮的寬廣區域上。

潑灑或點敷調配物宜含有載劑，其促進於宿主動物之皮膚表面上或皮毛中的迅速分散，且其一般係被稱為鋪展油。舉例而言，適當載劑有：油狀溶液；酒精和異丙醇溶液，如 2-辛基十二-烷醇或油醇之溶液；單羧酸酯類之溶液，如肉豆蔻酸異丙酯、棕櫚酸異丙酯、月桂酸草酯、油酸油酯、油酸癸酯、月桂酸己酯、鏈長 C_{12}-C_{18} 之飽和脂肪醇的癸酸酯類；二羧酸酯類之溶液，如鄰苯二甲酸二丁酯、間苯二甲酸二異丙酯、己二酸二異丙酯或己二酸二正丁酯，以及脂肪酸酯類之溶液，如甘醇類。若另外存在得知於製藥或化妝品工業之分散劑，可以是有利的。實例有：2-吡咯-烷酮、2-(N-烷基)吡咯-烷酮、丙酮、聚乙二醇及其醚類和酯類、丙二醇或合成甘油三酯。

油狀溶液包括例如：植物油，如橄欖油、花生油、芝麻油、松油、亞麻子油或蓖麻油。植物油亦可以環氧化形式存在。亦可使用石蠟油和矽油。

潑灑或點敷調配物一般包含 1 至 20 重量%之式 I 化合物、0.1 至 50 重量%之分散劑及 45 至 98.9 重量%之溶劑。

潑灑或點敷方法尤其有利於用在群居動物上，如牛、

馬、綿羊或豬等，其中要藉口服或注射方式來治療所有動物是很困難或很花時間的。由於此方法之簡易性，故其當然也可用於所有其他動物上，包括個別的馴養動物或寵物，且廣受動物主人喜好，因為其通常可不需獸醫師的專業幫助便可進行。

雖然濃縮組成物較受偏好作為市售產品，但最終使用者一般係使用稀釋調配物。

此等組成物可含有另外的添加劑，例如安定劑、消泡劑、黏度調節劑、黏合劑、增黏劑及其他活性成分，以獲得特定效果。

這類由最終使用者所使用的驅蟲組成物，同樣構成本發明之部分。

在根據本發明用於害蟲控制之各個方法中，或在根據本發明之各害蟲控制組成物中，式 I 活性成分可以其所有的立體構形或其混合物來使用。

本發明亦包括一種預防性保護溫血動物，尤其是生產用牲畜、馴養動物和寵物，來抵抗寄生蠕蟲之方法，其特徵在於將式 I 活性成分或由其所製得之活性成分調配物以飼料添加劑或飲水添加劑或者亦可以固體或液體形式，藉口服、注射或非經腸胃方式來投予動物。本發明亦包括供使用於該方法之一的根據本發明之式 I 化合物。

下列實施例僅供說明本發明而非限制之，"活性成分"一詞表示列於表 1 中之物質。

詳細言之，較佳調配物係配製如下：

（%＝重量%）

調配物實例

1. 粒劑	a)	b)
活性成分	5%	10%
高嶺土	94%	-
高度分散之矽酸	1%	-
厄帖浦石（attapulgite）	-	90%

將活性成分溶於二氯甲烷中，噴霧至載劑上，接著藉由減壓下蒸發來濃縮溶劑。這類粒劑可與動物飼料混合。

2. 粒劑

活性成分	3%
聚乙二醇（MW 200）	3%
高嶺土	94%

（MW＝分子量）

在混合機中將磨細的活性成分平均地施用至已經被聚乙二醇潤濕的高嶺土上。以這種方式，得到了無塵經塗覆顆粒。

3. 片劑或大丸劑

I	活性成分	33.00%
	甲基纖維素	0.80%
	經高度分散之矽酸	0.80%
	玉米澱粉	8.40%
II	結晶乳糖	22.50%
	玉米澱粉	17.00%
	微晶纖維素	16.50%
	硬脂酸鎂	1.00%

I 將甲基纖維素攪入水中。在物質已經溶脹後，將矽酸攪入並使混合物均勻地懸浮。將活性成分與玉米澱粉混合。將水性懸浮液摻入此混合物中，並揉捏成一個麵團。使所得團塊通過 12 M 篩子成粒並乾燥。

II 將全部的 4 種賦形劑徹底混合。

III 將根據 I 和 II 得到之初步混合物混合，並壓製成片劑或大丸劑。

4. 注射劑

A. 油狀媒劑（緩慢釋放）

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

製備：將活性成分伴隨攪拌溶於一部份油中，若需要，並伴隨溫和加熱，在冷卻之後配製至所需體積，並經過具有 0.22 微米孔隙大小之適當薄膜過濾器做無菌過濾。

B. 水混溶性溶劑（中等釋放速率）

1.	活性成分	0.1-1.0 克
	4-羥甲基-1,3-二氧戊環（甘油縮甲醛）	40 克
	1,2-丙二醇	至 100 毫升
2.	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

製備：將活性成分伴隨攪拌溶於一部份油中，配製至所需體積，並經過具有 0.22 微米孔隙大小之適當薄膜過濾器做無菌過濾。

C. 水性加溶物（迅速釋放）

1. 活性成分	0.1-1.0 克
聚乙氧基化蓖麻油（40 個氧化乙-烯單元）	10 克
1,2-丙二醇	20 克
苄醇	1 克
注射用水	至 100 毫升
2. 活性成分	0.1-1.0 克
聚單油酸乙氧基化脫水山梨醇酯（20 個氧化乙-烯單元）	8 克
4-羥甲基-1,3-二氧戊環（甘油縮甲醛）	20 克
苄醇	1 克
注射用水	至 100 毫升

製備：將活性成分溶於溶劑和界面活性劑中，並用水配製至所需體積。經過 0.22 微米孔隙大小之適當薄膜過濾器做無菌過濾。

5. 潑灑劑

A.

活性成分	5 克
肉豆蔻酸異丙酯	10 克
異丙醇	至 100 毫升

B.

活性成分	2 克
月桂酸己酯	5 克
中鏈長甘油三酯	15 克
乙醇	至 100 毫升

C.

活性成分	2 克
油酸油酯	5 克
N-甲基吡咯-烷酮	40 克
異丙醇	至 100 毫升

此水性系統較佳亦可用於口服及/或瘤胃內施用。

這些組成物亦可包含另外的添加劑，如安定劑，例如適當時，環氧化植物油（環氧化椰子油、菜子油或大豆油），消泡劑，例如矽油，保存劑、黏度調節劑、黏合劑、增黏劑及肥料或其他活性成分，以達成特殊效果。

其他對式 I 化合物為中性且不會對所欲治療之宿主動物有不利效應的生物活性物質或添加劑，以及無機鹽類或維生素，亦可添加至所說明之組成物中。

下列實施例係用來闡明本發明。它們並不限制本發明。字母"h"表示小時。

製備實施例

實施例 1：N-[2-氰基-1-(4,5-二氟-4'-二甲胺基-2-聯苯氧基)-2-丙基]-4-三氟甲氧基苯甲醯胺

a) 將 2.5 克氯丙酮、3 克碳酸鉀及 0.3 克碘化鉀添加至 4 克 2-溴-4,5-二氟苯酚於 40 毫升丙酮之溶液中，並於室溫下攪拌 3 h。在過濾之後，將溶液蒸發濃縮，於是獲得粗產物 1-(2-溴-4,5-二氟苯氧基)-丙-2-酮，其未經進一步的純化即做進一步的處理。

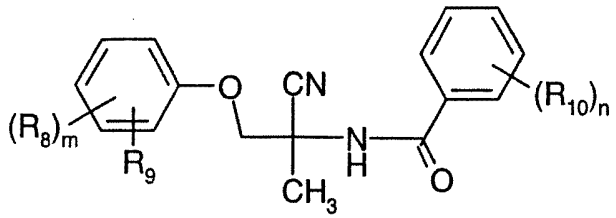
b) 將 5.1 克 1-(2-溴-4,5-二氟苯氧基)-丙-2-酮、1.1 克氰化鈉及 1.5 克氯化銨添加至 19 毫升的 25% 氨水溶液中，並於室溫下攪拌過夜。之後，用乙酸乙酯萃取反應混合物，將有機相用水和食鹽水洗滌及用硫酸鎂乾燥。在過濾及在真空下蒸發濃縮之後，獲得粗產物 2-胺基-3-(2-溴-4,5-二氟苯氧基)-2-甲基丙腈，其未經進一步的純化即做進一步的處理。

c) 將 300 毫克 2-胺基-3-(2-溴-4,5-二氟苯氧基)-2-甲基丙腈、129 毫克 Hünig 氏鹼、270 毫克 4-三氟甲氧基-苯甲醯氯及 12 毫克 4-二甲胺基吡啶之混合物於室溫下在 10 毫升二氯甲烷中攪拌 12 h。之後，添加乙酸乙酯來稀釋反應混合物，並用飽和碳酸氫鈉溶液、1N 氫氯酸水溶液及最後用食鹽水各洗滌二次，然後在過濾之後將有機相蒸發濃縮，以及利用急驟式層析純化殘餘物，於是獲得 N-[2-氰基-1-(2-溴-4,5-二氟苯氧基)-2-丙基]-4-三氟甲氧基苯甲醯胺。

d) 將 200 毫克 N-[2-氰基-1-(2-溴-4,5-二氟苯氧基)-2-丙基]-4-三氟甲氧基苯甲醯胺、309 毫克 4-二甲胺基苯基硼酸及 6 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液在 8 毫升甲苯中混合，利用氮氣漂洗 15 分鐘，接著在添加 66 毫克肆(三苯膦)鈀之後，於回流下沸騰 2 天。之後，將有機相分離，用乙酸乙酯萃取水相三次，將有機相合併，用硫酸鎂乾燥，過濾及在真空下蒸發濃縮。在利用急驟層析純化殘餘物之後，獲得標題化合物，熔點 60-61°C。

在下表中提及之物質亦可類似上述方法製得。熔點數值係以°C表示。

表1



編號	$(R_8)_m$	R_9	$(R_{10})_n$	物理數據
1.1	4-F	2-(3-環丙基苯基)	4-F	
1.2	4-F	2-(3-環丙基苯基)	4-CF_3	
1.3	4-F	2-(3-環丙基苯基)	4-OCF_3	
1.4	4-F	2-(3-環丙基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.5	4-F	2-(3-環丙基苯氧基)	4-F	
1.6	4-F	2-(3-環丙基苯氧基)	4-CF_3	
1.7	4-F	2-(3-環丙基苯氧基)	4-OCF_3	
1.8	4-F	2-(3-環丙基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.9	4-F	2-(3-環丙氧基苯基)	4-F	
1.10	4-F	2-(3-環丙氧基苯基)	4-CF_3	
1.11	4-F	2-(3-環丙氧基苯基)	4-OCF_3	
1.12	4-F	2-(3-環丙氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.13	4-F	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-F	
1.14	4-F	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-CF_3	
1.15	4-F	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-OCF_3	
1.16	4-F	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.17	4-F	2-(4-環丙基苯基)	4-F	
1.18	4-F	2-(4-環丙基苯基)	4-CF_3	
1.19	4-F	2-(4-環丙基苯基)	4-OCF_3	
1.20	4-F	2-(4-環丙基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.21	4-F	2-(4-環丙基苯氧基)	4-F	
1.22	4-F	2-(4-環丙基苯氧基)	4-CF_3	
1.23	4-F	2-(4-環丙基苯氧基)	4-OCF_3	
1.24	4-F	2-(4-環丙基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.25	4-F	2-(4-環丙氧基苯基)	4-F	
1.26	4-F	2-(4-環丙氧基苯基)	4-CF_3	
1.27	4-F	2-(4-環丙氧基苯基)	4-OCF_3	
1.28	4-F	2-(4-環丙氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.29	4-F	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-F	
1.30	4-F	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-CF_3	
1.31	4-F	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-OCF_3	
1.32	4-F	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.33	4-F	2-(3-環丁基苯基)	4-F	
1.34	4-F	2-(3-環丁基苯基)	4-CF_3	
1.35	4-F	2-(3-環丁基苯基)	4-OCF_3	
1.36	4-F	2-(3-環丁基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	

1.37	4-F	2-(3-環丁基苯氧基)	4-F
1.38	4-F	2-(3-環丁基苯氧基)	4-CF_3
1.39	4-F	2-(3-環丁基苯氧基)	4-OCF_3
1.40	4-F	2-(3-環丁基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.41	4-F	2-(3-環丁氧基苯基)	4-F
1.42	4-F	2-(3-環丁氧基苯基)	4-CF_3
1.43	4-F	2-(3-環丁氧基苯基)	4-OCF_3
1.44	4-F	2-(3-環丁氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.45	4-F	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-F
1.46	4-F	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-CF_3
1.47	4-F	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.48	4-F	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.49	4-F	2-(4-環丁基苯基)	4-F
1.50	4-F	2-(4-環丁基苯基)	4-CF_3
1.51	4-F	2-(4-環丁基苯基)	4-OCF_3
1.52	4-F	2-(4-環丁基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.53	4-F	2-(4-環丁基苯氧基)	4-F
1.54	4-F	2-(4-環丁基苯氧基)	4-CF_3
1.55	4-F	2-(4-環丁基苯氧基)	4-OCF_3
1.56	4-F	2-(4-環丁基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.57	4-F	2-(4-環丁氧基苯基)	4-F
1.58	4-F	2-(4-環丁氧基苯基)	4-CF_3
1.59	4-F	2-(4-環丁氧基苯基)	4-OCF_3
1.60	4-F	2-(4-環丁氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.61	4-F	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-F
1.62	4-F	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-CF_3
1.63	4-F	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.64	4-F	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.65	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-F
1.66	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-CF_3
1.67	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-OCF_3
1.68	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.69	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F
1.70	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3
1.71	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3
1.72	4-F	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.73	4-F	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F
1.74	4-F	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3
1.75	4-F	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3
1.76	4-F	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.77	4-F	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F
1.78	4-F	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3
1.79	4-F	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3
1.80	4-F	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.81	4-F	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-F

1.82	4-F	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-CF_3
1.83	4-F	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-OCF_3
1.84	4-F	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-$C(O)C_6H_5$
1.85	5-Cl	2-(3-環丙基苯基)	4-F
1.86	5-Cl	2-(3-環丙基苯基)	4-CF_3
1.87	5-Cl	2-(3-環丙基苯基)	4-OCF_3
1.88	5-Cl	2-(3-環丙基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.89	5-Cl	2-(3-環丙基苯氧基)	4-F
1.90	5-Cl	2-(3-環丙基苯氧基)	4-CF_3
1.91	5-Cl	2-(3-環丙基苯氧基)	4-OCF_3
1.92	5-Cl	2-(3-環丙基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.93	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯基)	4-F
1.94	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯基)	4-CF_3
1.95	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯基)	4-OCF_3
1.96	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.97	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-F
1.98	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-CF_3
1.99	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.100	5-Cl	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.101	5-Cl	2-(4-環丙基苯基)	4-F
1.102	5-Cl	2-(4-環丙基苯基)	4-CF_3
1.103	5-Cl	2-(4-環丙基苯基)	4-OCF_3
1.104	5-Cl	2-(4-環丙基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.105	5-Cl	2-(4-環丙基苯氧基)	4-F
1.106	5-Cl	2-(4-環丙基苯氧基)	4-CF_3
1.107	5-Cl	2-(4-環丙基苯氧基)	4-OCF_3
1.108	5-Cl	2-(4-環丙基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.109	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯基)	4-F
1.110	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯基)	4-CF_3
1.111	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯基)	4-OCF_3
1.112	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.113	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-F
1.114	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-CF_3
1.115	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.116	5-Cl	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.117	5-Cl	2-(3-環丁基苯基)	4-F
1.118	5-Cl	2-(3-環丁基苯基)	4-CF_3
1.119	5-Cl	2-(3-環丁基苯基)	4-OCF_3
1.120	5-Cl	2-(3-環丁基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.121	5-Cl	2-(3-環丁基苯氧基)	4-F
1.122	5-Cl	2-(3-環丁基苯氧基)	4-CF_3
1.123	5-Cl	2-(3-環丁基苯氧基)	4-OCF_3
1.124	5-Cl	2-(3-環丁基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.125	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯基)	4-F
1.126	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯基)	4-CF_3

1.127	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯基)	4-OCF_3
1.128	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.129	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-F
1.130	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-CF_3
1.131	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.132	5-Cl	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.133	5-Cl	2-(4-環丁基苯基)	4-F
1.134	5-Cl	2-(4-環丁基苯基)	4-CF_3
1.135	5-Cl	2-(4-環丁基苯基)	4-OCF_3
1.136	5-Cl	2-(4-環丁基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.137	5-Cl	2-(4-環丁基苯氧基)	4-F
1.138	5-Cl	2-(4-環丁基苯氧基)	4-CF_3
1.139	5-Cl	2-(4-環丁基苯氧基)	4-OCF_3
1.140	5-Cl	2-(4-環丁基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.141	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯基)	4-F
1.142	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯基)	4-CF_3
1.143	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯基)	4-OCF_3
1.144	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.145	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-F
1.146	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-CF_3
1.147	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.148	5-Cl	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.149	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-F
1.150	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-CF_3
1.151	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-OCF_3
1.152	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.153	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F
1.154	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3
1.155	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3
1.156	5-Cl	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.157	5-Cl	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F
1.158	5-Cl	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3
1.159	5-Cl	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3
1.160	5-Cl	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.161	5-Cl	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F
1.162	5-Cl	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3
1.163	5-Cl	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3
1.164	5-Cl	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.165	5-Cl	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-F
1.166	5-Cl	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-CF_3
1.167	5-Cl	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-OCF_3
1.168	5-Cl	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-$C(O)C_6H_5$
1.169	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯基)	4-F
1.170	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯基)	4-CF_3
1.171	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯基)	4-OCF_3

1.172	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.173	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯氧基)	4-F
1.174	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯氧基)	4-CF_3
1.175	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯氧基)	4-OCF_3
1.176	4,5-F_2	2-(3-環丙基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.177	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯基)	4-F
1.178	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯基)	4-CF_3
1.179	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯基)	4-OCF_3
1.180	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.181	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-F
1.182	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-CF_3
1.183	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.184	4,5-F_2	2-(3-環丙氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.185	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯基)	4-F
1.186	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯基)	4-CF_3
1.187	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯基)	4-OCF_3
1.188	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.189	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯氧基)	4-F
1.190	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯氧基)	4-CF_3
1.191	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯氧基)	4-OCF_3
1.192	4,5-F_2	2-(4-環丙基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.193	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯基)	4-F
1.194	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯基)	4-CF_3
1.195	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯基)	4-OCF_3
1.196	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.197	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-F
1.198	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-CF_3
1.199	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.200	4,5-F_2	2-(4-環丙氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.201	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯基)	4-F
1.202	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯基)	4-CF_3
1.203	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯基)	4-OCF_3
1.204	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.205	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯氧基)	4-F
1.206	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯氧基)	4-CF_3
1.207	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯氧基)	4-OCF_3
1.208	4,5-F_2	2-(3-環丁基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.209	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯基)	4-F
1.210	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯基)	4-CF_3
1.211	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯基)	4-OCF_3
1.212	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.213	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-F
1.214	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-CF_3
1.215	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-OCF_3
1.216	4,5-F_2	2-(3-環丁氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$
1.217	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯基)	4-F

1.218	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯基)	4-CF_3	
1.219	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯基)	4-OCF_3	
1.220	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.221	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯氧基)	4-F	
1.222	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯氧基)	4-CF_3	
1.223	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯氧基)	4-OCF_3	
1.224	4,5-F_2	2-(4-環丁基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.225	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯基)	4-F	
1.226	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯基)	4-CF_3	
1.227	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯基)	4-OCF_3	
1.228	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.229	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-F	
1.230	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-CF_3	
1.231	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-OCF_3	
1.232	4,5-F_2	2-(4-環丁氧基苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.233	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-F	
1.234	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-CF_3	
1.235	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-OCF_3	
1.236	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯基)	4-$C(O)C_6H_5$	m.p. 60-1°
1.237	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F	
1.238	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3	
1.239	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3	
1.240	4,5-F_2	2-(4-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.241	4,5-F_2	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F	
1.242	4,5-F_2	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3	
1.243	4,5-F_2	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3	
1.244	4,5-F_2	2-(3-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.245	4,5-F_2	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-F	
1.246	4,5-F_2	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-CF_3	
1.247	4,5-F_2	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-OCF_3	
1.248	4,5-F_2	2-(2-$N(CH_3)_2$-苯氧基)	4-$C(O)C_6H_5$	
1.249	4,5-F_2	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-F	
1.250	4,5-F_2	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-CF_3	
1.251	4,5-F_2	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-OCF_3	m.p. 172-3°
1.252	4,5-F_2	2-((3,4-OCH_2O)苯基	4-$C(O)C_6H_5$	

生物學實施例：

1. 利用經口投藥對蒙古種沙鼠（長爪沙鼠(*Meriones unguiculatus*)）中柱桿狀毛樣線蟲（*Trichostrongylus colubriformis*）和扭旋血線蟲（*Haemonchus contortus*）之活體內試驗

利用含有大約2000隻柱桿狀毛樣線蟲與扭旋血線蟲第三齡仔蟲之人工飼料，使六至八週大之蒙古種沙鼠受感染。在感染6天之後，用N_2O將沙鼠稍微麻醉，並藉經口施予試驗化合物來治療之，該試驗化合物係溶於2份DMSO與1份聚乙二醇（PEG 300）之混合物中，用量為100、32及10-0.1毫克/公斤。在第9天（治療後三天），當大部分仍然存活之扭旋血線蟲為第四齡後期仔蟲且大部分柱桿狀毛樣線蟲為未成熟成蟲時，將沙鼠殺死以計算蟲隻。功效係計算為每隻沙鼠內蟲隻數目的減少%，此係與由8隻受感染且未受治療之沙鼠所得蟲隻數目幾何平均值做比較。

在此試驗中，用式I化合物達到在線蟲侵染方面的大量減少。

為檢驗式I化合物對動物和植物的殺昆蟲及/或殺蟎作用，可使用下列試驗方法。

2. 對絲光綠蠅L_1仔蟲的作用

於大約50°C下，將1毫升受試活性物質之水性懸浮液與3毫升特製仔蟲生長培養基混合，如此便獲得具有活性成分含量為250或125 ppm的組織均漿。在各試管樣品中使用大約30隻綠蠅仔蟲（L_1）。在4天之後，測定死亡率。

3. 對微小牛蜱（拜亞拉（Biarra）種系）的殺蟎作用

將一片黏性膠帶水平地貼附於PVC板上，如此10隻

已經飽脹的雌微小牛蜱（拜亞拉種系）可經由它們的背部彼此靠著成列黏著地貼附於膠帶上。利用注射針頭，對每隻蜱注入 1 微升的液體，該液體是聚乙二醇與丙酮的 1：1 混合物且其中含有溶解於其中之選自每隻蜱 1、0.1 或 0.01 微克之一定量活性成分。對照動物則接受不含活性成分之注射。在治療之後，將動物關在昆蟲館中，保持在大約 28°C 與 80%相對濕度的標準條件下，直到出現產卵且有仔蟲從對照動物的卵中孵化出來。受試物質的活性係利用 IR_{90} 來測定，亦即在 30 天之後，10 隻雌蜱中有 9 隻（＝90%）產下無法孵化卵的活性成分劑量的評估。

4. 對飽脹微小牛蜱雌蟲（拜亞拉）之活體外活性：

將 4 x 10 飽脹的 OP-抗性拜亞拉種系的雌蜱貼附於黏性膠帶上，並用一團浸漬於試驗化合物乳化液或懸浮液的棉毛球覆蓋 1 小時，試驗化合物濃度為 500、125、31 及 8 ppm。在 28 天後根據死亡率、產卵及孵化的仔蟲做評估。

試驗化合物活性的指標係以有下列情況之雌蟲數目表示：

-在產卵之前快速死亡，

-存活一段時間，沒有產卵，

-產卵，其中並無胚胎發育，

-產卵，其中有胚胎發育，但沒有幼蟲從中孵化，及

-產卵，其中有胚胎發育且在 26 至 27 天有幼蟲正常地孵化。

5. 對希伯來鈍眼蜱幼蟲的活體外活性

將大約 5 隻飢餓的幼蟲放入含有 2 毫升試驗化合物溶液、懸浮液或乳化液的聚苯乙烯試管中。

在浸漬 10 分鐘並在渦流混合器上震盪 2 x 10 秒鐘之後，將試管用一團厚棉花塞起來並旋轉。一見所有液體已經被棉毛球吸收，便將其半途推入仍然旋轉的試管，如此大部分的液體便從棉毛球被擠出並流入下方的培養皿中。

然後，直到評估之前，將試管保存在室溫下有日光照射的室內。在 14 天之後，將試管浸入一個沸水燒杯中。如果，在對熱的反應下有蜱開始運動，則試驗物質在該試驗濃度下是無效的；否則，蜱便被認為是死亡且試驗物質被認為在該試驗濃度下是有效的。所有物質是在從 0.1 至 100 ppm 的濃度範圍下受試驗。

6. 對抗雞皮刺蟎的作用

將 2 至 3 毫升含有 10 ppm 活性成分之溶液及大約 200 隻在各種發育階段的蟎（雞皮刺蟎）添加至一個開口在上方的玻璃容器中。然後將該容器用一團棉花塞起來，震盪 10 分鐘，直到蟎已經完全被潤濕為止，然後稍事倒置，如此剩下的試驗溶液便可被棉花吸收。在 3 天之後，計算死亡個體數來確定蟎的死亡率，並以百分比表示。

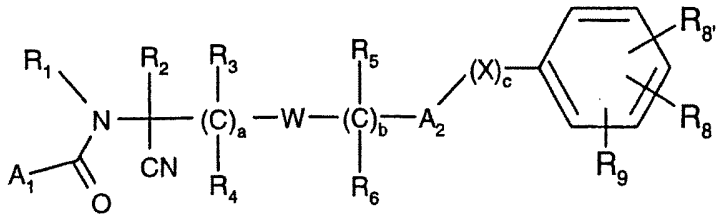
7. 對抗普通家蠅的作用

用試驗物質的溶液處理方糖，使得在乾燥過夜之後試

驗物質在糖裡面的濃度為 250 ppm。將經這種方式處理的方糖與濕棉花和 10 隻成年 OP-抗性種系普通家蠅一起放在鋁皿上，用燒杯蓋起來並於 25°C 下培育。在 24 小時之後測定死亡率。

伍、中文發明摘要：

本發明係關於下通式之化合物：

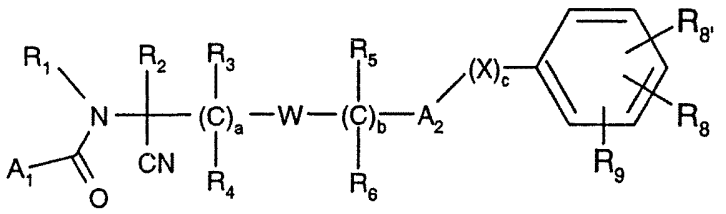


I,

其中 R_1、R_2、R_3、R_4、R_5、R_6、R_8、$R_{8'}$、R_9、W、X、A_1、A_2、a、b 和 c 具有申請專利範圍第 1 項中所給之定義，及視情況關於其對映異構體。這些活性成分具有有利的殺蟲性質。它們特別適於控制溫血動物身上的寄生蟲。

陸、英文發明摘要：

The invention relates to compounds of the general formula

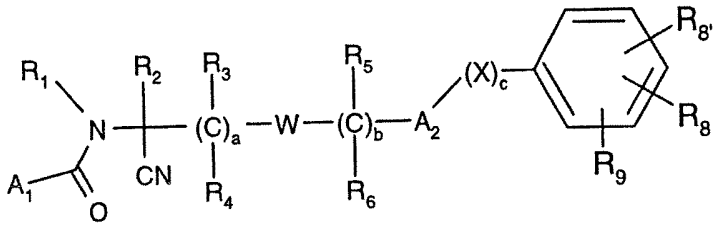


I,

in which R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_8, $R_{8'}$, R_9, W, X, A_1, A_2, a, b and c have the significances given in claim 1, and optionally the enantiomers thereof. The active ingredients have advantageous pesticidal properties. They are particularly suitable for controlling parasites on warm-blooded animals.

拾、申請專利範圍：

1.一種式I之化合物，



I,

其中

A_1與A_2係各自獨立地表示未經取代之芳基或經取代一次或多次之芳基，其中取代基A_1與A_2係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_2-C_6-烯基、鹵基-C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯氧基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_2-C_6-烯硫基、鹵基-C_2-C_6-烯硫基、C_2-C_6-烯基亞磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基亞磺醯基、C_2-C_6-烯基磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷基磺醯胺基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷氧羰基、C_1-C_6-烷胺羰基、二-C_1-C_6-烷胺羰基；未經取代之苯基胺基或經取代一次或多次之苯基胺基；未經取代之苯基羰基或經取代一次或多次之苯基羰基；未經取代之苯基甲氧基亞胺基或經取代一次或多次

之苯基甲氧基亞胺基；未經取代之苯基羥基甲基或經取代一次或多次之苯基羥基甲基；未經取代之 1-苯基-1-羥基乙基或經取代一次或多次之 1-苯基-1-羥基乙基；未經取代之苯基氟甲基或經取代一次或多次之苯基氟甲基；未經取代之苯基氰基甲基或經取代一次或多次之苯基氰基甲基；未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基；未經取代之苯氧基或經取代一次或多次之苯氧基；未經取代之苯乙炔基或經取代一次或多次之苯乙炔基；及未經取代之吡啶氧基或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於 R_9；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於 R_9；

R_1 表示氫、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、烯丙基或 C_1-C_6-烷氧基甲基；

R_2、R_3、R_4、R_5 和 R_6 可各自獨立地為氫、鹵素、未經取代之 C_1-C_6-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_6-烷基、未經取代之 C_2-C_6-烯基或經取代一次或多次之 C_2-C_6-烯基、未經取代之 C_2-C_6-炔基或經取代一次或多次之 C_2-C_6-炔基、未經取代之 C_1-C_6-烷氧基或經取代一次或多次之 C_1-C_6-烷氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、C_1-C_6-烷氧基和鹵基-C_1-C_6-烷氧基所組成之群組；未經取代之 C_3-C_6-環烷基或經取代一次或多次之 C_3-C_6-環烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_6-烷基所組成之

群組；或未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基或二-C_1-C_6-烷胺基所組成之群組；

或者，R_2與R_3一起表示C_2-C_6-伸烷基；

R_7表示氫或C_1-C_6-烷基；

R_8表示C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_3-C_8-環烷基、鹵基-C_3-C_8-環烷基、C_3-C_8-環烷胺基、鹵基-C_3-C_8-環烷胺基、C_3-C_8-環烷氧基、鹵基-C_3-C_8-環烷氧基或C_3-C_8-環烷硫基；而R_8,表示氫或R_9；

或者R_8和R_8,一起表示未經取代或經R_9取代之C_3-C_5-伸烷基，其中一或多個碳原子可被O、N或S置換；

R_9表示鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_2-C_6-烯基、鹵基-C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯氧基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_2-C_6-烯硫基、鹵基-C_2-C_6-烯硫基、C_2-C_6-烯基亞磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基亞磺醯基、

C_2-C_6-烯基磺醯基、鹵基-C_2-C_6-烯基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷基磺醯胺基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷氧羰基、C_1-C_6-烷胺羰基及二-C_1-C_6-烷胺羰基；

W 表示 O、S、$S(O)_2$ 或 $N(R_7)$；

X 表示 O、S 或 $N(R_7)$；

a 表示 1、2、3 或 4；

b 表示 1、2、3 或 4；以及

c 表示 0 或 1。

2.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，A_1 與 A_2 係各自獨立地表示未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 與 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷氧羰基，未經取代之苯基胺基或經取代一次或多次之苯基胺基；未經取代或經取代一次或多次之苯基羰基；未經取代或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次或多次之苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷

氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基和 C_1-C_6-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基及 C_1-C_6-烷氧羰基。

3.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中取代基 A_1 和 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基，未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次或多次之苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、

鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及 C_1-C_4-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及 C_1-C_4-烷氧羰基。

4.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 A_1 和 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基、C_1-C_2-烷氧羰基，及未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基，其中取代基在各情況中可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_3-C_4-環烷硫基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-

烷胺基、二-C_1-C_2-烷胺基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基及C_1-C_2-烷氧羰基所組成之群組。

5.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_1 為氫、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基或 C_1-C_4-烷氧基甲基。

6.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_1 為氫、C_1-C_2-烷基或鹵基-C_1-C_2-烷基。

7.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_1 為氫或 C_1-C_2-烷基。

8.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_2、R_3、R_4、R_5 和 R_6 係各自獨立地表示氫、鹵素、未經取代之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_4-烷氧基所組成之群組；C_3-C_5-環烷基或未經取代或經取代一次或多次之苯基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基及鹵基-C_1-C_4-烷氧基所組成之群組。

9.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_2、R_3、R_4、R_5 和 R_6 各自獨立地表示氫、未經取代之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_2-烷氧基所組成之群組；或 C_3-C_5-環烷基。

10.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_2、R_3、R_4、R_5 和 R_6 各自獨

立地為氫、C_1-C_2-烷基或 C_3-C_5-環烷基。

11.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_7 為 C_1-C_6-烷基。

12.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_7 為 C_1-C_4 烷基。

13.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_7 為 C_1-C_2 烷基。

14.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_3-C_6-環烷基或 C_3-C_6-環烷氧基；而 $R_{8'}$ 表示氫，

或者 R_8 和 $R_{8'}$ 一起表示未經取代或經 R_9 取代之 C_3-C_4-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 或 N 置換。

15.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基；而 $R_{8'}$ 表示氫，

或者 R_8 和 $R_{8'}$ 一起表示未經取代或經 R_9 取代之 C_3-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 置換。

16.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基或二-C_1-C_4-烷胺基；而 $R_{8'}$ 表示氫。

17.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_9 表示鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-

C_4-烷氧基、C_2-C_5-烯基、鹵基-C_2-C_5-烯基、C_2-C_5-炔基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_2-C_5-烯氧基、鹵基-C_2-C_5-烯氧基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯氧基、C_1-C_4-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基、C_1-C_4-烷胺羰基或二-C_1-C_4-烷胺羰基。

18.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_9 表示鹵素、氰基、C_1-C_3-烷基、鹵基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_3-烷氧基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_1-C_3-烷硫基、鹵基-C_1-C_3-烷硫基、C_1-C_3-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_3-烷基磺醯基、C_1-C_3-烷胺基、二-C_1-C_3-烷胺基、C_1-C_3-烷羰基、鹵基-C_1-C_3-烷羰基或 C_1-C_3-烷氧羰基。

19.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 R_9 表示鹵素、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_1-C_2-烷硫基或鹵基-C_1-C_2-烷硫基。

20.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 W 是 O 或 S。

21.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 W 是 O。

22.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 X 是 O 或 $N(R_7)$。

23.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 X 是 O。

24.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 a 是 1、2 或 3。

25.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 a 是 1 或 2。

26.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 a 是 1。

27.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 b 是 0、1 或 2。

28.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 b 是 0 或 1。

29.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 b 是 0。

30.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 c 是 0。

31.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 A_1 與 A_2 係各自獨立地為未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 與 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_2-C_6-烯氧基、鹵基-C_2-C_6-烯氧基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷

基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基、C_1-C_6-烷氧羰基，未經取代之苯基胺基或經取代一次或多次之苯基胺基；未經取代或經取代一次或多次之苯基羰基；未經取代或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次或多次之苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基和C_1-C_6-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_6-烷基、鹵基-C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵基-C_1-C_6-烷氧基、C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷氧基、C_3-C_6-環烷胺基、C_3-C_6-環烷硫基、C_1-C_6-烷硫基、鹵基-C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷胺基、二-C_1-C_6-烷胺基、C_1-C_6-烷羰基、鹵基-C_1-C_6-烷羰基及C_1-C_6-烷氧羰基；

R_1 表示氫、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基或 C_1-C_4-烷氧基甲基；

R_2、R_3、R_4、R_5和R_6各自獨立地表示氫、鹵素、未經取代之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_4-烷氧基所組成之群組；C_3-C_5-環烷基或未經取代或經取代一次或多次之苯基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基及鹵基-C_1-C_4-烷氧基所組成之群組；

R_7表示 C_1-C_6-烷基；

R_8表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_3-C_6-環烷基或 C_3-C_6-環烷氧基；而 $R_{8'}$表示氫；

或者 R_8和 $R_{8'}$一起表示未經取代或經 R_9取代之 C_3-C_4-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 或 N 置換；

R_9表示鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_2-C_5-烯基、鹵基-C_2-C_5-烯基、C_2-C_5-炔基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_2-C_5-烯氧基、鹵基-C_2-C_5-烯氧基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基磺醯氧基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯氧基、C_1-C_4-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基、C_1-C_4-烷胺羰基或二-C_1-C_4-烷胺羰基；

W 是 O 或 S；

X 表示 O 或 N(R_7)；

a 表示 1、2 或 3；

b 表示 0、1 或 2；以及

c 表示 0。

32.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 A_1 與 A_2 係各自獨立地表示未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基、C_1-C_4-烷氧羰基，未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基；未經取代或經取代一次或多次之苯氧基；及未經取代或經取代一次或多次之吡啶氧基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及 C_1-C_4-烷氧羰基所組成之群組；或

未經取代之雜芳基或經取代一次或多次且係經由一個環碳原子鍵結之雜芳基，其中取代基 A_1 和 A_2 可各自獨立且係選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_3-C_5-環烷氧基、C_3-C_5-環烷胺基、C_3-C_5-環烷硫基、C_1-C_4-烷硫基、鹵基-C_1-C_4-烷硫基、

C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基、C_1-C_4-烷羰基、鹵基-C_1-C_4-烷羰基及 C_1-C_4-烷氧羰基；R_1 表示氫、C_1-C_2-烷基或鹵基-C_1-C_2-烷基；

R_2、R_3、R_4、R_5和 R_6各自獨立地表示氫、未經取代之 C_1-C_4-烷基或經取代一次或多次之 C_1-C_4-烷基，其中取代基可各自獨立且係選自於鹵素和 C_1-C_2-烷氧基所組成之群組；或 C_3-C_5-環烷基；

R_7為 C_1-C_4烷基；

R_8表示 C_1-C_4-烷胺基、二-C_1-C_4-烷胺基；而 $R_{8'}$表示氫；

或者 R_8和 $R_{8'}$一起表示未經取代或經 R_9取代之 C_3-伸烷基，其中一或二個碳原子可被 O 置換；

R_9表示鹵素、氰基、C_1-C_3-烷基、鹵基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_3-烷氧基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_1-C_3-烷硫基、鹵基-C_1-C_3-烷硫基、C_1-C_3-烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_3-烷基磺醯基、C_1-C_3-烷胺基、二-C_1-C_3-烷胺基、C_1-C_3-烷羰基、鹵基-C_1-C_3-烷羰基或 C_1-C_3-烷氧羰基；

W 和 X 表示 O；

a 表示 1 或 2；

b 表示 0 或 1；以及

c 表示 0。

33.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中 A_1與 A_2係各自獨立地表示未經取代或經取代一次或多次之芳基，其中取代基 A_1和 A_2

係各自獨立地選自於下列各基所組成之群組：鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、C_3-C_5-環烷基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基、C_1-C_2-烷氧羰基及未經取代之苯基或經取代一次或多次之苯基，其中取代基在各情況中可各自獨立且係選自於鹵素、硝基、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烷胺基、C_3-C_4-環烷硫基、C_1-C_2-烷硫基、鹵基-C_1-C_2-烷硫基、C_1-C_2-烷胺基、二-C_1-C_2-烷胺基、C_1-C_2-烷羰基、鹵基-C_1-C_2-烷羰基及 C_1-C_2-烷氧羰基所組成之群組；

R_1 表示氫或 C_1-C_2-烷基；

R_2、R_3、R_4、R_5 和 R_6 係各自獨立地表示氫、C_1-C_2-烷基或 C_3-C_5-環烷基；

R_7 為 C_1-C_2-烷基；

R_8 表示 C_1-C_4-烷胺基或二-C_1-C_4-烷胺基；

R_8, 表示氫；

R_9 表示鹵素、氰基、C_1-C_2-烷基、鹵基-C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、鹵基-C_1-C_2-烷氧基、C_3-C_4-環烷基、C_3-C_4-環烷氧基、C_1-C_2-烷硫基或鹵基-C_1-C_2-烷硫基；

W 和 X 表示 O；W 和 X 表示 O；

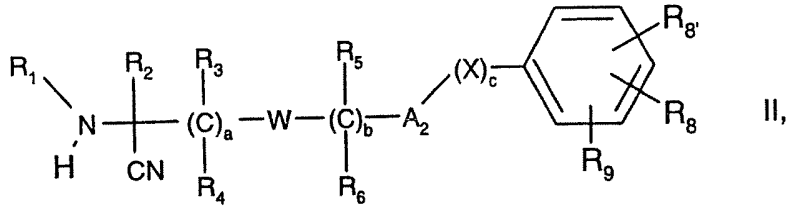
a 表示 1；以及

b 和 c 為 0。

34.根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，分別呈游

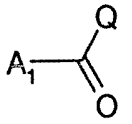
離形式或呈鹽形式者，其名稱是 N-(2-氰基-1-(4,5-二氟-4'-二甲胺基-2-聯苯氧基)-2-丙基)-4-三氟甲氧基苯甲醯胺。

35.一種製備根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物的方法，式 I 化合物分別呈游離形式或呈鹽形式者，其中係使下式 II 化合物與下式 III 化合物反應：



II,

其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，且其中 R_1、R_2、R_3、R_4、R_5、R_6、R_8、$R_{8'}$、R_9、W、X、A_2、a、b 及 c 係如在式 I 中所定義者，

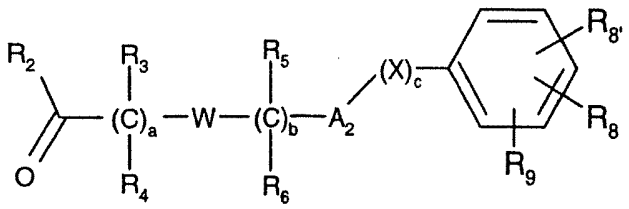


III,

其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，且其中 A_1 係如在式 I 中所定義者，而 Q 是離去基，視需要在鹼性催化劑存在下進行，

以及若須要，將可根據本方法或其他方式得到之分別呈游離形式或鹽形式之式 I 化合物轉化成另一種式 I 化合物，將可根據本方法獲得之異構體混合物分離及將所欲之異構體離析，及/或將可根據本方法獲得之式 I 游離化合物轉化成鹽，或將可根據本方法獲得之式 I 化合物鹽轉化成式 I 游離化合物或另一種鹽。

36.一種製備式 II 化合物之方法，式 II 化合物分別呈游離形式或呈鹽形式者，該方法特徵在於使式 IV 化合物



IV,

（其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，其中 R_2、R_3、R_4、R_5、R_6、R_8、$R_{8'}$、R_9、W、X、A_2、a、b 及 c 係如在式 I 中所定義者）與無機或有機氰化物及式 R_1-NH_2 化合物（其為已知者或可類似對應的已知化合物製得，且其中 R_1 係如在式 I 中所定義者）反應，且若須要，將可根據本方法或其他方式得到之分別呈游離形式或鹽形式之式 II 化合物轉化成另一種式 II 化合物，將可根據本方法獲得之異構體混合物分離及將所欲異構體離析，及/或將可根據本方法獲得之式 II 游離化合物轉化成鹽，或將可根據本方法獲得之式 II 化合物鹽轉化成式 II 游離化合物或另一種鹽。

37.一種控制寄生蟲之組成物，其除了載劑及/或分散劑之外，還包含至少一種根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物作為活性成分。

38.一種根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物於控制寄生蟲的用途。

39.一種控制寄生蟲之方法，其中係使用有效量之至少一種根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物來對抗寄生蟲。

40.一種根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物的用途，其係用於控制溫血動物寄生蟲之方法。

41.一種根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物的用途，其係用來製備對抗溫血動物寄生蟲之醫藥組成物。

拾壹、圖式：

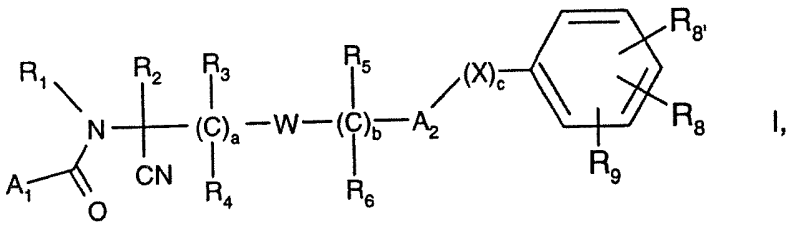
（無）

柒、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（　無　）圖。

(二)本代表圖之元件代表符號簡單說明:

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



I,