（由本局填寫）

承辦人代碼：	A6 B6
大　　類：	
ＩＰＣ分類：	

本案已向：

國（地區）	申請專利，申請日期：	案號：	，□有　□無主張優先權
日本	2000 年 6 月 15 日	2000-179251	☑有主張優先權
日本	2000 年 11 月 17 日	2000-351412	☑有主張優先權
日本	2000 年 12 月 8 日	2000-375024	☑有主張優先權

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

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（　）

1

本發明係有關新穎之維他命D衍生物者，詳而言，做爲醫藥品（例如乾癬等皮膚疾病治療藥）有用之維他命D衍生物者。

在活體內維他命D_3係最先在肝臟中其25位被羥基化成爲25－羥基維他命D_3，繼而在腎臟中1α位或24位被羥基化而成爲1α－25－二羥基維他命D_3與24R，25－二羥基維他命D_3。在此等代謝產物中，例如1α，25－二羥基維他命D_3及其合成類似物係對於鈣代謝調節作用，腫瘤細胞等之增殖抑制作用或分化抑制作用，免疫調節作用等多方面示有生理活性係爲人所知者。

以往，長期且連續地使用維他命D_3時會有易於引起高鈣血症的問題。爲解決此問題曾針對各種維他命D衍生物的合成進行檢討，曾有提案降低鈣上昇作用之維他命D衍生物者（例如特開平7－330714號，特開平10－231284號）。

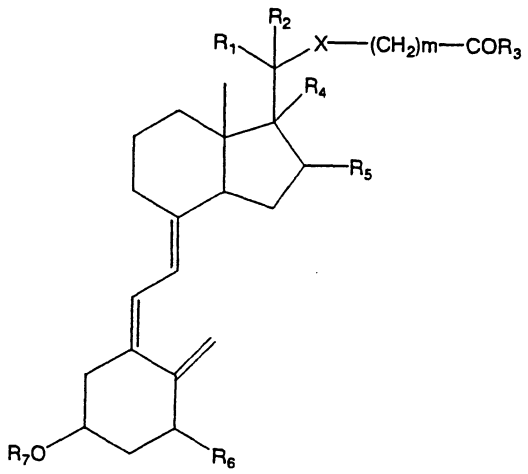
本發明係以提供做爲醫藥，尤其做爲乾癬等之皮膚疾病治療藥具有良好之生理活性，並且可降低鈣之上昇作用的維他命D衍生物爲目的者。

本發明人係有鑑於上述課題，著眼於側鏈具有酯或醯胺之化合物，爲提供可以更降低鈣上昇作用之維他命D衍生物再三深入研究，結果發現以下式（1）所示維他命D衍生物可達成所期目的，遂而完成本發明。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（　）

2



式（1）

｛式（１）中Ｘ示氧原子或硫原子；ｍ示１～３之數；

Ｒ１及Ｒ２示氫原子或烷基；Ｒ４及Ｒ５示氫原子或羥基，或Ｒ４及Ｒ５一起在１６位與１７位形成雙鍵；Ｒ３示－ＹＲ８（Ｙ示氧原子或硫原子，Ｒ８示氫原子，或氟原子或可被環狀烷基所取代之直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子取代之環狀烷基）或－ＮＲ９Ｒ１０（Ｒ９及Ｒ１０係示氫原子，或可被氟原子或環狀烷基所取代之直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之環狀烷基，或Ｒ４及Ｒ５爲一起在１６位與１７位形成雙鍵時，Ｒ９及Ｒ１０亦可與氮原子一起形爲環）；

Ｒ６係示氫原子或－ＯＲ１１（Ｒ１１示氫原子或保護基）；Ｒ７示氫原子或保護基｝。

即，依本發明時可提供式（１）所示維他命Ｄ衍生物者

式（１）中，較佳係Ｘ示氧原子或硫原子，ｍ示１～

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 3 ）

3之數，R_1及R_2示氫原子或C_1～C_4烷基，R_4及R_5示氫原子或羥基，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_3示－YR_8（Y示氧原子或硫原子，R_8示氫原子，或可被氟原子或C_3～C_{10}環狀烷基所取代之C_1～C_{15}直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_{15}環狀烷基）或－R_9R_{10}（R_9及R_{10}示氫原子，或可被氟原子或C_3～C_{10}環狀烷基所取代之C_1～C_{15}直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_{15}環狀烷基，或R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵時R_9及R_{10}係與氮原子一起形成爲3～10節環），R_6示氫原子或羥基，R_7示氫原子。

又，式（1）中較佳係X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_4及R_5同時示氫原子，或R_4示氫原子R_5示羥基，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_3示－YR_8（Y示氧原子或硫原子，R_8示氫原子，或可被氟原子或C_3～C_8環狀烷基所取代之C_1～C_{10}直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_{12}環狀烷基）或－NR_9R_{10}（R_9及R_{10}示氫原子，可被氟原子或C_3～C_8環狀烷基所取代之C_1～C_{10}直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_{12}環狀烷基，或R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵結合時，R_9及R_{10}係與氮原子一起形成爲3～10節環），R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子或硫原子，m係1～2

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（　）

4

之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_4及R_5示氫原子，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_3示－YR_8（Y示氧原子或硫原子，R_8示氫原子，可被氟原子或C_3～C_8環狀烷基所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_8環狀烷基）或－NR_9R_{10}，（R_9及R_{10}示氫原子，可被氟原子或C_3～C_8環狀烷基所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_8環狀烷基，或R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵結合時，R_9及R_{10}係與氮原子一起形成爲3～8節環），R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中，較佳係X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－YR_8（Y示氧原子或硫原子，R_8示氫原子，可被氟原子或C_3～C_6環狀烷基所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_8環狀烷基），R_4及R_5係示氫原子，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子或硫原子，m示1，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_4及R_5示氫原子，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵結合，R_3示－NR_9R_{10}（R_9及R_{10}示氫原子，氟原子或可被C_3～C_6環狀烷基所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_8環狀烷基，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵時，R_9及R_{10}係與氮原子一起形成3～6節

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（　）

5

環），R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－OR_8（R_8示C_3～C_8支鏈狀烷基），R_4及R_5示氫原子，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－SR_8（R_8示C_3～C_8支鏈狀烷基），R_4及R_5示氫原子或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中，較佳係X示氧原子或硫原子，m示1，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－NR_9R_{10}（R_9示氫原子或C_1～C_4直鏈或支鏈狀烷基，R_{10}示可被氟原子所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基），R_4及R_5示氫原子，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－OR_8（R_8示C_6～C_8支鏈狀烷基），R_4及R_5示氫原子，或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，且其一爲甲基，R_3示－OR_8（R_8示C_6～C_8支鏈狀烷基），R_4及R_5示一起在16位

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 6 ）

與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子，m示1，R_1及R_2示氫原子或甲基，且其一爲甲基，R_{13}示$-NR_9R_{10}$（R_9示氫原子或甲基，或可被氟原子所取代之C_1～C_4直鏈或支鏈狀烷基，R_4及R_5示一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

式（1）中較佳係X示氧原子，m示1，R_1及R_2示氫原子或甲基，且其一爲甲基，R_3示$-NR_9R_{10}$（R_9示氫原子，R_{10}示可被氟原子所取代之丙基），R_4及R_5示一起在16位17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

本發明之維他命D衍生物係較佳爲：

1α，1β－二羥基－20（S）－（1－乙基－1－甲基丙氧基羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

1α，3β－二羥基－20（S）－（1－異丙基－2－甲基丙氧基羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

1α，3β－二羥基－20（S）－（1，1－二甲基丁氧基羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

1α，3β－二羥基－20（S）－（1，1－二甲基己氧基羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（　）

7

1α，3β－二羥基－20（S）－｛2－（1－乙基－1－甲基丙氧基羰基）乙氧基｝－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

｛（1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基）氧基｝－N－（2，2，3，3，3－五氟化丙基）乙醯胺；及

1α，3β－二羥基－20（S）－（1－乙基－1－甲基丙氧基羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯。

本發明之另　發明可提供含上述維他命D衍生物之醫藥組成物。

本發明之又一發明可提供以上述維他命D衍生物爲有效成份之皮膚疾病治療劑，皮膚疾病係較佳係爲乾癬。

另外，本發明還可提供上述維他命D衍生物做爲製造皮膚疾病治療劑之使用。皮膚疾病治療劑係較佳爲乾癬治療劑。

另外，本發明又可提供使用上述維他命D衍生物治療皮膚疾病之方法。例如可提供包含對於需要此治療之患者投予治療上有效量之維他命D衍生物之步驟的方法。較佳之皮膚疾病係乾癬。

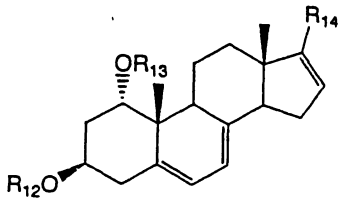
又，本發明可提供可做爲上述維他命D衍生物之製造中間體使用之化合物的有利製造方法。即，可提供在溶媒，有機鋁試藥及鈀觸媒存在下，於一氧化碳氣氛中使式（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（　）

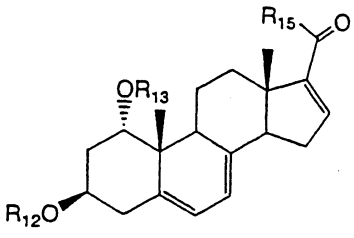
8

2）



（2）

（式中R_{12}及R_{13}示保護基，R_{14}示脫離基）所示化合物進行羰基化反應，以製造式（3）



（3）

（式中R_{12}及R_{13}係如同上述式（2）中所定義，R_{15}示烷基，芳基，烯基或炔基）所示化合物的方法。

上述方法中，有機鋁試藥以式（4）

$$(R_{15})_nAlW_{3-n} \qquad (4)$$

（式中n示1～3整數，R_{15}示烷基，芳基，烯基或炔基，W示鹵素原子）所示者爲宜。

以下詳細說明本發明之以式（1）所示維他命D衍生物及含其之醫藥組成物的實施形態以及實施方法。

又，本發明所主張優先權之基礎申請案的特願2000－179251號，特願2000－

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 9 ）

351412號，特願2000-375024號公報的揭示全部可藉由引用包含於本說明書中。

此說明書中除非特別指定，否則烷基係通常爲C_1～C_{15}直鏈或支鏈狀之烷基或C_3～C_{15}環狀烷基。R_1及R_2之烷基的碳數係較佳爲1～6，更佳係1～4。具體言可爲甲基，乙基，正丁基等。以甲基爲最佳。R_8，R_9及R_{10}之直鏈或支鏈狀的碳數係較佳爲1～10，更佳係1～8，最佳係R_8爲C_6～C_8之支鏈烷基，R_9及R_{10}係C_1～C_4之直鏈或支鏈狀烷基。具體言可爲甲基，乙基，正丙基，異丙基，正丁基，第二丁基，異丁基，第三丁基，正戊基，第三戊基，1－乙基－1－甲基丙基，1－異丙基－2－甲基丙基，1，1－二乙基丙基，1，1－二甲基丁基，1，1－二甲基己基，正己基，正庚基，正辛基，壬基，癸基等。較佳係甲基，乙基，正丙基，異丙基，異丁基，第三丁基，第三戊基，1－乙基－1－甲基丙基，1－異丙基－2－甲基丙基，1，1－二乙基丙基，1，1－二甲基丁基，1，1－二甲基己基等，更佳係甲基，乙基，正丙基，第三丁基，第三戊基，1－乙基－1－甲基丙基，1－異丙基－2－甲基丙基，1，1－二甲基丁基，1，1－二甲基己基，最佳係R爲1－乙基－1－甲基丙基，1，1－二甲基己基，R_9爲甲基，R_{10}爲正丙基。

環狀烷基係通常爲C_3～C_{15}，較佳係C_3～C_{12}，更佳係C_3～C_8之環狀烷基。直鏈或支鏈狀烷基之取代基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（　）

的環狀烷基係以C3～C6者爲最佳。具體言可爲環丙基，環丁基，環戊基，環己基，環庚基，環辛基，環壬基，環癸基，環十二烷基，環十五烷基等。

可被氟原子或環狀烷基所取代之直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之環狀烷基通常係指如上述之直鏈或支鏈狀烷基的一個以上任意氫原子可被氟原子或環狀烷基所取代之基而言。取代之氟原子數可因烷基之種類而異，通常係3～20，較佳係3～15，更佳係3～12，最佳係3～8。

R7，R11，R12，R13中之保護基可以分別相同或不同，可爲醯基，可被取代之烷基，取代矽烷基等，例如甲基，甲氧基甲基，甲硫基甲基，第三丁硫基甲基，（苯基二甲基矽烷基）甲氧基甲基，苯；甲氧基甲基，對甲氧基苯甲氧基甲基，對氯苯甲氧基甲基，（4－甲氧基苯氧基）甲基，第三丁氧基甲基，2－甲氧基乙氧基甲基，2，2，2－三氯乙氧基甲基，2－（三甲基矽烷基）乙氧基甲基，苯硫基甲基，環丙基甲基，四氫哌喃基，四氫硫基哌喃基，1－甲氧基環己基，4－甲氧基四氫哌喃基，4－甲氧基四氫硫基哌喃基，4－S，S－二氧化4－甲氧基四氫硫基哌喃基，1，4－二噁烷－2－基，四氫呋喃基，四氫硫基呋喃基，苯甲醯甲基，對溴苯甲醯甲基，1－乙氧基乙基，甲氧基異丙基，1－（2－氯乙氧基）乙基，1－甲基－1－甲氧基乙基，1－甲基－苯甲氧基乙基，1－甲基－1－苯甲氧基－2－氟乙基，2，2，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（　）

11

2－三氯乙基，2－三甲基矽烷基乙基，2，2－二氯－1，1－二氟乙基，烯丙基，第三丁基，對氯苯基，對甲氧基苯基，2，4－二硝基苯基，苯甲基，對甲氧基苯甲基，3，4－二甲氧基苯甲基，鄰硝基苯基，對硝基苯甲基，對氯苯甲基，對溴苯甲基，2，6－二氯苯甲基，對氰基苯甲基，對苯基苯甲基，4－（二甲基胺羰基）苯甲基，2－吡啶甲基，4－吡啶甲基，二苯基甲基，P，P´－二硝基二苯甲基，5－二苯并環庚基，三苯基甲基，對甲氧苯基二苯基甲基，二（對甲氧基苯基）苯甲基，三（對甲氧苯基）甲基，9－蒽基，1，3－苯并二（四氫噻吩）－2－基，S，S－二氧化苯異噻唑基，三甲基矽烷基，三乙基矽烷基，三異丙基矽烷基，二甲基異丙基矽烷基，二乙基異丙基矽烷基，二甲基己基矽烷基，第三丁基二甲基矽烷基，第三丁基二苯基矽烷基，三苯甲基矽烷基，三對二甲苯基矽烷基，三苯基矽烷，二苯基甲基矽烷基，第三丁基甲氧基矽烷基，甲醯基，乙醯基，氯乙醯基，二氯乙醯基，三氯乙醯基，三氟乙醯基，甲氧基乙醯基，丙醯基，丁醯基，異丁醯基，三甲基乙醯基，金剛烷基，環己烷羰基，苯甲醯基，4－硝基苯甲醯基，4－氯苯甲醯基，4－甲氧苯甲醯基，萘甲醯基，甲苯甲醯基，9－茀羰基，甲氧羰基，乙氧羰基，第三丁氧羰基，苯甲氧羰基，4－甲氧基苯甲氧羰基，9－茀基甲氧基羰基，2，2，2－三氯乙氧羰基，2－（三甲基矽烷基）乙氧羰基，2－（甲硫基甲氧基）乙氧羰基，丙氧羰基，異丙

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（　）

12

氧羰基，異丁氧羰基，乙烯氧羰基，烯丙氧羰基，對硝基苯氧羰基，3，4－二甲氧基苯甲氧羰基，鄰硝苯甲氧羰基，對硝苯甲氧羰基，苯甲硫羰基，4－乙氧基－1－萘氧羰基，（甲硫基）硫羰基，異丁胺羰基，苯基胺羰基等，較佳係三甲基矽烷基，三乙基矽烷基，三異丙基矽烷基，二甲基異丙基矽烷基，二乙基異丙基矽烷基，二甲基己基矽烷基，第三丁基二甲基矽烷基，第三丁基二苯基矽烷基，三苯甲基矽烷基，三對二甲苯基矽烷基，三苯基矽烷基，二苯基甲基矽烷基，第三丁基甲氧基苯基矽烷基等之取代矽烷基，或甲醯基，乙醯基，氯乙醯基，二氯乙醯基，三氯乙醯基，三氟乙醯基，甲氧基乙醯基，三氟甲氧基乙醯基，苯氧基乙醯基，丙醯基，丁醯基，異丁醯基，4－（甲硫基甲氧基）丁醯基，三甲基乙醯基，金剛烷基，環己烷醯基，苯甲醯基，4－硝基苯甲醯基，4－氯苯甲醯基，2－碘苯甲醯基，4－甲氧基苯甲醯基，對苯基苯甲醯基萘醯基，甲苯甲醯基，9－芴羰基之醯基，更佳係三乙基矽烷基，三異丙基矽烷基，二甲基異丙基矽烷基，二乙基異丙基矽烷基，第三丁基二甲基矽烷基，第三丁基二苯基矽烷基，三苯基矽烷基，二苯基甲基矽烷基，乙醯基，三甲基乙醯基，苯甲醯基，4－甲氧基苯甲醯基。

R_{14}中之脫離基係例如氯原子，溴原子，碘原子等鹵素原子，或三氟甲磺氧基，五氟乙磺氧基，九氟丁磺氧基，甲磺氧基，苯磺氧基，甲苯磺氧基等磺氧基，或二甲磷醯氧基，二乙磷醯氧基，二苯磷醯氧基等磷酸酯基，較佳

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（　）

13

係溴原子，碘原子，三氟甲磺氧基，九氟丁磺氧基。

本案之式（３）化合物的製法中，用於羰基反應之溶媒可適當地選擇，惟較佳係有機溶媒。有機溶媒可爲對反應基係惰性之液狀物質，例如可爲Ｎ，Ｎ－二甲基乙醯胺，Ｎ，Ｎ－二甲基甲醯胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，二甲亞碸，四氫呋喃，１，２－二甲氧基乙烷，１，４－二噁烷，第三丁基甲醚，乙醚，異丙醚，丙酮，甲基乙基酮，乙酸乙酯，二氯甲烷，１，２－二氯乙烷，甲苯，苯，氯苯等，較佳係Ｎ，Ｎ－二甲基乙醯胺，Ｎ，Ｎ－二甲基甲醯胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，更佳係Ｎ，Ｎ－二甲基甲醯胺。

本案之式（３）的製法中，有機鋁試藥係式（４）所示化合物，

$$(R_{15})_n Al W_{3-n} \qquad (4)$$

（ｎ示１，２，３之整數，R_{15}示烷基，芳基，烯基或炔基。在此烷基係示$C_1 \sim C_{15}$之直鏈或支鏈狀烷基或$C_3 \sim C_{15}$環狀烷基，芳基係示具有烷基或鹵素，硝基等取代基之苯基，烯基係指具有雙鍵之$C_2 \sim C_{15}$直鏈或支鏈狀之取代基，炔基係指具有三鍵之$C_2 \sim C_{15}$直鏈或支鏈狀的取代基。又，Ｗ係示氯原子，溴原子，碘原子等之鹵素原子）。可爲例如三甲基鋁，氯化二甲基鋁，溴化二甲基鋁，碘化二甲基鋁，二氯化甲基鋁，二溴化甲基鋁，二碘化

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（　）

14

甲基鋁，三乙基鋁，氯化二乙基鋁，溴化二乙基鋁，碘化二乙基鋁，二氯化乙基鋁，二溴化乙基鋁，二碘化乙基鋁，三正丙基鋁，氯化二正丙基鋁，溴化二正丙基鋁，碘化二正丙基鋁，二氯化正丙基鋁，二溴化正丙基鋁，二碘化正丙基鋁，三丁基鋁，氯化二丁基鋁，溴化二丁基鋁，碘化二丁基鋁，二氯化丁基鋁，二溴化丁基鋁，二碘化丁基鋁，三苯基鋁，氯化二苯基鋁，溴化二苯基鋁，碘化二苯基鋁，二氯化苯基鋁，二溴化苯基鋁，二碘化苯基鋁，較佳係三甲基鋁，氯化二甲基鋁，二氯化甲基鋁，三乙基鋁，氯化二乙基鋁，二氯化乙基鋁，三正丙基鋁，氯化二正丙基鋁，二氯化正丙基鋁，三丁基鋁，氯化二丁基鋁，二氯化丁基鋁，三苯基鋁，氯化二苯基鋁，二氯化苯基鋁，等更佳係氯化二甲基鋁，氯化二乙基鋁，氯化二正丙基鋁，氯化二正丁基鋁，氯化二苯基鋁。

鈀觸媒係可具有適當之配位基的0價或2價鈀化合物，可爲例如四（三苯膦）鈀，二氯雙（三苯膦）鈀，二氯〔1，3－雙（三苯膦基）丙烷〕鈀，二氯〔1，2－雙（三苯膦基）乙烷〕鈀，雙（二苯亞甲基丙酮）鈀，三（二苯亞甲基丙酮）二鈀等，較佳係四（三苯膦）鈀。

以下表1～43中示本發明之式（1）所示維他命D衍生物的非限定性具體例。

表1～表23中R_3係爲OR_8，表24中R_3爲SR_8，表25～表44中R_3爲NR_9R_{10}。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（15）

表1

	X	R1	R2	m	R3=OR8 R8	R4	R5	R6	R7
1	O	H	H	1	H	H	H	OH	H
2	O	H	H	1	CH_3	H	H	OH	H
3	O	H	H	1	CH_2CH_3	H	H	OH	H
4	O	H	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
5	O	H	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
6	O	H	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
7	O	H	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
8	O	H	H	1	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
9	O	H	H	1	H	H	OH	OH	H
10	O	H	H	1	CH_3	H	OH	OH	H
11	O	H	H	1	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
12	O	H	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
13	O	H	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
14	O	H	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
15	O	H	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
16	O	H	H	1	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
17	O	H	H	1	H		=	OH	H
18	O	H	H	1	CH_3		=	OH	H
19	O	H	H	1	CH_2CH_3		=	OH	H
20	O	H	H	1	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
21	O	H	H	1	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
22	O	H	H	1	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
23	O	H	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
24	O	H	H	1	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
25	O	H	H	1	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$		=	OH	H
26	O	H	H	1	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

五、發明說明（16）

表2

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
27	O	H	H	1	$C(CH_2CH_3)_3$		=	OH	H
28	O	H	H	1	cyclopropyl		=	OH	H
29	O	H	H	1	cyclobutyl		=	OH	H
30	O	H	H	1	cyclopentyl		=	OH	H
31	O	H	H	1	cyclohexyl		=	OH	H
32	O	H	H	1	cycloheptyl		=	OH	H
33	O	H	H	1	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
34	O	H	H	2	H	H	H	OH	H
35	O	H	H	2	CH_3	H	H	OH	H
36	O	H	H	2	CH_2CH_3	H	H	OH	H
37	O	H	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
38	O	H	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
39	O	H	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
40	O	H	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
41	O	H	H	2	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
42	O	H	H	2	H	H	OH	OH	H
43	O	H	H	2	CH_3	H	OH	OH	H
44	O	H	H	2	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
45	O	H	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
46	O	H	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
47	O	H	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
48	O	H	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
49	O	H	H	2	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
50	O	H	H	2	H		=	OH	H
51	O	H	H	2	CH_3		=	OH	H
52	O	H	H	2	CH_2CH_3		=	OH	H
53	O	H	H	2	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H

（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）

表3

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
54	O	H	H	2	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
55	O	H	H	2	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
56	O	H	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
57	O	H	H	2	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
58	O	H	H	3	H	H	H	OH	H
59	O	H	H	3	CH_3	H	H	OH	H
60	O	H	H	3	CH_2CH_3	H	H	OH	H
61	O	H	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
62	O	H	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
63	O	H	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
64	O	H	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
65	O	H	H	3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
66	O	H	H	3	H	H	OH	OH	H
67	O	H	H	3	CH_3	H	OH	OH	H
68	O	H	H	3	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
69	O	H	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
70	O	H	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
71	O	H	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
72	O	H	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
73	O	H	H	3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
74	O	H	H	3	H		=	OH	H
75	O	H	H	3	CH_3		=	OH	H
76	O	H	H	3	CH_2CH_3		=	OH	H
77	O	H	H	3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
78	O	H	H	3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
79	O	H	H	3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
80	O	H	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

A7
B7

五、發明說明（18

表4

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
81	O	H	H	3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
82	O	CH_3	H	1	H	H	H	OH	H
83	O	CH_3	H	1	CH_3	H	H	OH	H
84	O	CH_3	H	1	CH_2CH_3	H	H	OH	H
85	O	CH_3	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
86	O	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
87	O	CH_3	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
88	O	CH_3	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
89	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
90	O	CH_3	H	1	$CH(CH_2CH_3)_2$	H	H	OH	H
91	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$	H	H	OH	H
92	O	CH_3	H	1	H	H	OH	OH	H
93	O	CH_3	H	1	CH_3	H	OH	OH	H
94	O	CH_3	H	1	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
95	O	CH_3	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
96	O	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
97	O	CH_3	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
98	O	CH_3	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
99	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
100	O	CH_3	H	1	H		=	OH	H
101	O	CH_3	H	1	CH_3		=	OH	H
102	O	CH_3	H	1	CH_2CH_3		=	OH	H
103	O	CH_3	H	1	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
104	O	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
105	O	CH_3	H	1	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
106	O	CH_3	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
107	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 19

表5

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
108	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$		=	OH	H
109	O	CH_3	H	1	$CH(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
110	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
111	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2(CH(CH_3)_2)$		=	OH	H
112	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2((CH_2)_2CH_3)$		=	OH	H
113	O	CH_3	H	1	$C(CH_2CH_3)_3$		=	OH	H
114	O	CH_3	H	1	$CH(CH(CH_3)_2)_2$		=	OH	H
115	O	CH_3	H	1	$CH((CH_2)_2CH_3)_2$		=	OH	H
116	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2((CH_2)_3CH_3)$		=	OH	H
117	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2(CH_2CH(CH_3)_2)$		=	OH	H
118	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2(C(CH_3)_3)$		=	OH	H
119	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)((CH_2)_2CH_3)_2$		=	OH	H
120	O	CH_3	H	1	$C(CH_2CH_3)_2(CH(CH_3)_2)$		=	OH	H
121	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2((CH_2)_4CH_3)$		=	OH	H
122	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2(CH_2C(CH_3)_3)$		=	OH	H
123	O	CH_3	H	1	$C(CH_2CH_3)_2(C(CH_3)_3)$		=	OH	H
124	O	CH_3	H	1	$CH((CH_2)_3CH_3)_2$		=	OH	H
125	O	CH_3	H	1	$CH(C(CH_3)_3)_2$		=	OH	H
126	O	CH_3	H	1	$CH((CH_2)_2CH(CH_3)_2)_2$		=	OH	H
127	O	CH_3	H	1	$CH(CH_2C(CH_3)_3)_2$		=	OH	H
128	O	CH_3	H	1	cyclopropyl		=	OH	H
129	O	CH_3	H	1	cyclobutyl		=	OH	H
130	O	CH_3	H	1	cyclopentyl		=	OH	H
131	O	CH_3	H	1	cyclohexyl		=	OH	H
132	O	CH_3	H	1	cycloheptyl		=	OH	H
133	O	CH_3	H	1	cyclooctyl		=	OH	H
134	O	CH_3	H	1	cyclodecyl		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 20

表6

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
135	O	CH_3	H	1	cyclododecyl		=	OH	H
136	O	CH_3	H	1	cyclopropylmethyl				
137	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2$(cyclopropyl)		=	OH	H
138	O	CH_3	H	1	cyclopentylmethyl		=	OH	H
139	O	CH_3	H	1	cyclohexylmethyl		=	OH	H
140	O	CH_3	H	1	1-methylcyclopentyl		=	OH	H
141	O	CH_3	H	1	1-ethylcyclopentyl		=	OH	H
142	O	CH_3	H	1	1-methylcyclohexyl		=	OH	H
143	O	CH_3	H	1	1-methylcycloheptyl		=	OH	H
144	O	CH_3	H	1	1-ethylcyclohexyl		=	OH	H
145	O	CH_3	H	1	1-methylcyclooctyl		=	OH	H
146	O	CH_3	H	1	1-adamantyl		=	OH	H
147	O	CH_3	H	1	2-adamantyl		=	OH	H
148	O	H	H	1	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
149	O	CH_3	H	2	H	H	H	OH	H
150	O	CH_3	H	2	CH_3	H	H	OH	H
151	O	CH_3	H	2	CH_2CH_3	H	H	OH	H
152	O	CH_3	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
153	O	CH_3	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
154	O	CH_3	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
155	O	CH_3	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
156	O	CH_3	H	2	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
157	O	CH_3	H	2	H	H	OH	OH	H
158	O	CH_3	H	2	CH_3	H	OH	OH	H
159	O	CH_3	H	2	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
160	O	CH_3	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
161	O	CH_3	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 21

表7

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
162	O	CH_3	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
163	O	CH_3	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
164	O	CH_3	H	2	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
165	O	CH_3	H	2	H		=	OH	H
166	O	CH_3	H	2	CH_3		=	OH	H
167	O	CH_3	H	2	CH_2CH_3		=	OH	H
168	O	CH_3	H	2	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
169	O	CH_3	H	2	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
170	O	CH_3	H	2	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
171	O	CH_3	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
172	O	CH_3	H	2	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
173	O	CH_3	H	2	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
174	O	CH_3	H	3	H	H	H	OH	H
175	O	CH_3	H	3	CH_3	H	H	OH	H
176	O	CH_3	H	3	CH_2CH_3	H	H	OH	H
177	O	CH_3	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
178	O	CH_3	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
179	O	CH_3	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
180	O	CH_3	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
181	O	CH_3	H	3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
182	O	CH_3	H	3	H	H	OH	OH	H
183	O	CH_3	H	3	CH_3	H	OH	OH	H
184	O	CH_3	H	3	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
185	O	CH_3	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
186	O	CH_3	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
187	O	CH_3	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
188	O	CH_3	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（ 22

表8

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
189	O	CH_3	H	3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
190	O	CH_3	H	3	H		=	OH	H
191	O	CH_3	H	3	CH_3		=	OH	H
192	O	CH_3	H	3	CH_2CH_3		=	OH	H
193	O	CH_3	H	3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
194	O	CH_3	H	3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
195	O	CH_3	H	3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
196	O	CH_3	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
197	O	CH_3	H	3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
198	O	H	CH_3	1	H	H	H	OH	H
199	O	H	CH_3	1	CH_3	H	H	OH	H
200	O	H	CH_3	1	CH_2CH_3	H	H	OH	H
201	O	H	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
202	O	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
203	O	H	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
204	O	H	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
205	O	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
206	O	H	CH_3	1	H	H	OH	OH	H
207	O	H	CH_3	1	CH_3	H	OH	OH	H
208	O	H	CH_3	1	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
209	O	H	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
210	O	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
211	O	H	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
212	O	H	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
213	O	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
214	O	H	CH_3	1	H		=	OH	H
215	O	H	CH_3	1	CH_3		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 23

表 9

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
216	O	H	CH_3	1	CH_2CH_3		=	OH	H
217	O	H	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
218	O	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
219	O	H	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
220	O	H	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
221	O	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
222	O	H	CH_3	1	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$		=	OH	H
223	O	H	CH_3	1	$CH(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
224	O	H	CH_3	1	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
225	O	H	CH_3	1	$C(CH_2CH_3)_3$		=	OH	H
226	O	H	CH_3	1	cyclopropyl		=	OH	H
227	O	H	CH_3	1	cyclobutyl		=	OH	H
228	O	H	CH_3	1	cyclopentyl		=	OH	H
229	O	H	CH_3	1	cyclohexyl		=	OH	H
230	O	H	CH_3	1	cycloheptyl		=	OH	H
231	O	H	CH_3	1	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
232	O	H	CH_3	2	H	H	H	OH	H
233	O	H	CH_3	2	CH_3	H	H	OH	H
234	O	H	CH_3	2	CH_2CH_3	H	H	OH	H
235	O	H	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
236	O	H	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
237	O	H	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
238	O	H	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
239	O	H	CH_3	2	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
240	O	H	CH_3	2	H	H	OH	OH	H
241	O	H	CH_3	2	CH_3	H	OH	OH	H
242	O	H	CH_3	2	CH_2CH_3	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 24

表１０

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
243	O	H	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
244	O	H	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
245	O	H	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
246	O	H	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
247	O	H	CH_3	2	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
248	O	H	CH_3	2	H		=	OH	H
249	O	H	CH_3	2	CH_3		=	OH	H
250	O	H	CH_3	2	CH_2CH_3		=	OH	H
251	O	H	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
252	O	H	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
253	O	H	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
254	O	H	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
255	O	H	CH_3	2	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
256	O	H	CH_3	3	H	H	H	OH	H
257	O	H	CH_3	3	CH_3	H	H	OH	H
258	O	H	CH_3	3	CH_2CH_3	H	H	OH	H
259	O	H	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
260	O	H	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
261	O	H	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
262	O	H	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
263	O	H	CH_3	3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
264	O	H	CH_3	3	H	H	OH	OH	H
265	O	H	CH_3	3	CH_3	H	OH	OH	H
266	O	H	CH_3	3	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
267	O	H	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
268	O	H	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
269	O	H	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 25

表11

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
270	O	H	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
271	O	H	CH_3	3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
272	O	H	CH_3	3	H		=	OH	H
273	O	H	CH_3	3	CH_3		=	OH	H
274	O	H	CH_3	3	CH_2CH_3		=	OH	H
275	O	H	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
276	O	H	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
277	O	H	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
278	O	H	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
279	O	H	CH_3	3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
280	O	CH_3	CH_3	1	H	H	H	OH	H
281	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	H	H	OH	H
282	O	CH_3	CH_3	1	CH_2CH_3	H	H	OH	H
283	O	CH_3	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
284	O	CH_3	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
285	O	CH_3	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
286	O	CH_3	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
287	O	CH_3	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
288	O	CH_3	CH_3	1	H	H	OH	OH	H
289	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	H	OH	OH	H
290	O	CH_3	CH_3	1	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
291	O	CH_3	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
292	O	CH_3	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
293	O	CH_3	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
294	O	CH_3	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
295	O	CH_3	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
296	O	CH_3	CH_3	1	H		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 26

表12

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
297	O	CH_3	CH_3	1	CH_3		=	OH	H
298	O	CH_3	CH_3	1	CH_2CH_3		=	OH	H
299	O	CH_3	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
300	O	CH_3	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
301	O	CH_3	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
302	O	CH_3	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
303	O	CH_3	CH_3	1	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
304	O	CH_3	CH_3	1	cyclopropyl		=	OH	H
305	O	CH_3	CH_3	1	cyclobutyl		=	OH	H
306	O	CH_3	CH_3	1	cyclopentyl		=	OH	H
307	O	CH_3	CH_3	1	cyclohexyl		=	OH	H
308	O	CH_3	CH_3	1	cycloheptyl		=	OH	H
309	O	CH_3	CH_3	1	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
310	O	CH_3	CH_3	2	H	H	H	OH	H
311	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	H	H	OH	H
312	O	CH_3	CH_3	2	CH_2CH_3	H	H	OH	H
313	O	CH_3	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
314	O	CH_3	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
315	O	CH_3	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
316	O	CH_3	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
317	O	CH_3	CH_3	2	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
318	O	CH_3	CH_3	2	H	H	OH	OH	H
319	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	H	OH	OH	H
320	O	CH_3	CH_3	2	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
321	O	CH_3	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
322	O	CH_3	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
323	O	CH_3	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 27

表１３

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
324	O	CH_3	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
325	O	CH_3	CH_3	2	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
326	O	CH_3	CH_3	2	H		=	OH	H
327	O	CH_3	CH_3	2	CH_3		=	OH	H
328	O	CH_3	CH_3	2	CH_2CH_3		=	OH	H
329	O	CH_3	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
330	O	CH_3	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
331	O	CH_3	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
332	O	CH_3	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
333	O	CH_3	CH_3	2	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
334	O	CH_3	CH_3	3	H	H	H	OH	H
335	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	H	H	OH	H
336	O	CH_3	CH_3	3	CH_2CH_3	H	H	OH	H
337	O	CH_3	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
338	O	CH_3	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
339	O	CH_3	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
340	O	CH_3	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
341	O	CH_3	CH_3	3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
342	O	CH_3	CH_3	3	H	H	OH	OH	H
343	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	H	OH	OH	H
344	O	CH_3	CH_3	3	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
345	O	CH_3	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
346	O	CH_3	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
347	O	CH_3	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
348	O	CH_3	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
349	O	CH_3	CH_3	3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
350	O	CH_3	CH_3	3	H		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 28

表14

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
351	O	CH_3	CH_3	3	CH_3		=	OH	H
352	O	CH_3	CH_3	3	CH_2CH_3		=	OH	H
353	O	CH_3	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
354	O	CH_3	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
355	O	CH_3	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
356	O	CH_3	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
357	O	CH_3	CH_3	3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
358	S	H	H	1	H	H	H	OH	H
359	S	H	H	1	CH_3	H	H	OH	H
360	S	H	H	1	CH_2CH_3	H	H	OH	H
361	S	H	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
362	S	H	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
363	S	H	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
364	S	H	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
365	S	H	H	1	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
366	S	H	H	1	H	H	OH	OH	H
367	S	H	H	1	CH_3	H	OH	OH	H
368	S	H	H	1	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
369	S	H	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
370	S	H	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
371	S	H	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
372	S	H	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
373	S	H	H	1	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
374	S	H	H	1	H		=	OH	H
375	S	H	H	1	CH_3		=	OH	H
376	S	H	H	1	CH_2CH_3		=	OH	H
377	S	H	H	1	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（ 29

表15

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
378	S	H	H	1	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
379	S	H	H	1	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
380	S	H	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
381	S	H	H	1	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
382	S	H	H	1	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$		=	OH	H
383	S	H	H	1	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
384	S	H	H	1	$C(CH_2CH_3)_3$		=	OH	H
385	S	H	H	1	cyclopropyl		=	OH	H
386	S	H	H	1	cyclobutyl		=	OH	H
387	S	H	H	1	cyclopentyl		=	OH	H
388	S	H	H	1	cyclohexyl		=	OH	H
389	S	H	H	1	cycloheptyl		=	OH	H
390	S	H	H	1	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
391	S	H	H	2	H	H	H	OH	H
392	S	H	H	2	CH_3	H	H	OH	H
393	S	H	H	2	CH_2CH_3	H	H	OH	H
394	S	H	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
395	S	H	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
396	S	H	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
397	S	H	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
398	S	H	H	2	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
399	S	H	H	2	H	H	OH	OH	H
400	S	H	H	2	CH_3	H	OH	OH	H
401	S	H	H	2	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
402	S	H	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
403	S	H	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
404	S	H	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 30

表16

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
405	S	H	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
406	S	H	H	2	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
407	S	H	H	2	H		=	OH	H
408	S	H	H	2	CH_3		=	OH	H
409	S	H	H	2	CH_2CH_3		=	OH	H
410	S	H	H	2	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
411	S	H	H	2	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
412	S	H	H	2	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
413	S	H	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
414	S	H	H	2	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
415	S	H	H	3	H	H	H	OH	H
416	S	H	H	3	CH_3	H	H	OH	H
417	S	H	H	3	CH_2CH_3	H	H	OH	H
418	S	H	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
419	S	H	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
420	S	H	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
421	S	H	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
422	S	H	H	3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
423	S	H	H	3	H	H	OH	OH	H
424	S	H	H	3	CH_3	H	OH	OH	H
425	S	H	H	3	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
426	S	H	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
427	S	H	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
428	S	H	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
429	S	H	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
430	S	H	H	3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
431	S	H	H	3	H		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（ 31

表17

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
432	S	H	H	3	CH_3		=	OH	H
433	S	H	H	3	CH_2CH_3		=	OH	H
434	S	H	H	3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
435	S	H	H	3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
436	S	H	H	3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
437	S	H	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
438	S	H	H	3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
439	S	CH_3	H	1	H	H	H	OH	H
440	S	CH_3	H	1	CH_3	H	H	OH	H
441	S	CH_3	H	1	CH_2CH_3	H	H	OH	H
442	S	CH_3	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
443	S	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
444	S	CH_3	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
445	S	CH_3	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
446	S	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
447	S	CH_3	H	1	H	H	OH	OH	H
448	S	CH_3	H	1	CH_3	H	OH	OH	H
449	S	CH_3	H	1	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
450	S	CH_3	H	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
451	S	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
452	S	CH_3	H	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
453	S	CH_3	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
454	S	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
455	S	CH_3	H	1	H		=	OH	H
456	S	CH_3	H	1	CH_3		=	OH	H
457	S	CH_3	H	1	CH_2CH_3		=	OH	H
458	S	CH_3	H	1	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 32

表18

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
459	S	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
460	S	CH_3	H	1	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
461	S	CH_3	H	1	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
462	S	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
463	S	CH_3	H	1	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$		=	OH	H
464	S	CH_3	H	1	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
465	S	CH_3	H	1	$C(CH_2CH_3)_3$		=	OH	H
466	S	CH_3	H	1	cyclopropyl		=	OH	H
467	S	CH_3	H	1	cyclobutyl		=	OH	H
468	S	CH_3	H	1	cyclopentyl		=	OH	H
469	S	CH_3	H	1	cyclohexyl		=	OH	H
470	S	CH_3	H	1	cycloheptyl		=	OH	H
471	S	CH_3	H	1	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
472	S	CH_3	H	2	H	H	H	OH	H
473	S	CH_3	H	2	CH_3	H	H	OH	H
474	S	CH_3	H	2	CH_2CH_3	H	H	OH	H
475	S	CH_3	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
476	S	CH_3	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
477	S	CH_3	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
478	S	CH_3	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
479	S	CH_3	H	2	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
480	S	CH_3	H	2	H	H	OH	OH	H
481	S	CH_3	H	2	CH_3	H	OH	OH	H
482	S	CH_3	H	2	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
483	S	CH_3	H	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
484	S	CH_3	H	2	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
485	S	CH_3	H	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 38

表19

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
486	S	CH_3	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
487	S	CH_3	H	2	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
488	S	CH_3	H	2	H		=	OH	H
489	S	CH_3	H	2	CH_3		=	OH	H
490	S	CH_3	H	2	CH_2CH_3		=	OH	H
491	S	CH_3	H	2	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
492	S	CH_3	H	2	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
493	S	CH_3	H	2	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
494	S	CH_3	H	2	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
495	S	CH_3	H	2	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
496	S	CH_3	H	3	H	H	H	OH	H
497	S	CH_3	H	3	CH_3	H	H	OH	H
498	S	CH_3	H	3	CH_2CH_3	H	H	OH	H
499	S	CH_3	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
500	S	CH_3	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
501	S	CH_3	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
502	S	CH_3	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
503	S	CH_3	H	3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
504	S	CH_3	H	3	H	H	OH	OH	H
505	S	CH_3	H	3	CH_3	H	OH	OH	H
506	S	CH_3	H	3	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
507	S	CH_3	H	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
508	S	CH_3	H	3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
509	S	CH_3	H	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
510	S	CH_3	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
511	S	CH_3	H	3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
512	S	CH_3	H	3	H		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 34

表２０

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
513	S	CH_3	H	3	CH_3		=	OH	H
514	S	CH_3	H	3	CH_2CH_3		=	OH	H
515	S	CH_3	H	3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
516	S	CH_3	H	3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
517	S	CH_3	H	3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
518	S	CH_3	H	3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
519	S	CH_3	H	3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
520	S	H	CH_3	1	H	H	H	OH	H
521	S	H	CH_3	1	CH_3	H	H	OH	H
522	S	H	CH_3	1	CH_2CH_3	H	H	OH	H
523	S	H	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
524	S	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
525	S	H	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
526	S	H	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
527	S	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
528	S	H	CH_3	1	H	H	OH	OH	H
529	S	H	CH_3	1	CH_3	H	OH	OH	H
530	S	H	CH_3	1	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
531	S	H	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
532	S	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
533	S	H	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
534	S	H	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
535	S	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
536	S	H	CH_3	1	H		=	OH	H
537	S	H	CH_3	1	CH_3		=	OH	H
538	S	H	CH_3	1	CH_2CH_3		=	OH	H
539	S	H	CH_3	1	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（ 35

表２１

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
540	S	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
541	S	H	CH_3	1	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
542	S	H	CH_3	1	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
543	S	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
544	S	H	CH_3	1	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$		=	OH	H
545	S	H	CH_3	1	$C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
546	S	H	CH_3	1	$C(CH_2CH_3)_3$		=	OH	H
547	S	H	CH_3	1	cyclopropyl		=	OH	H
548	S	H	CH_3	1	cyclobutyl		=	OH	H
549	S	H	CH_3	1	cyclopentyl		=	OH	H
550	S	H	CH_3	1	cyclohexyl		=	OH	H
551	S	H	CH_3	1	cycloheptyl		=	OH	H
552	S	H	CH_3	1	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
553	S	H	CH_3	2	H	H	H	OH	H
554	S	H	CH_3	2	CH_3	H	H	OH	H
555	S	H	CH_3	2	CH_2CH_3	H	H	OH	H
556	S	H	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
557	S	H	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
558	S	H	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
559	S	H	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
560	S	H	CH_3	2	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
561	S	H	CH_3	2	H	H	OH	OH	H
562	S	H	CH_3	2	CH_3	H	OH	OH	H
563	S	H	CH_3	2	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
564	S	H	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
565	S	H	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
566	S	H	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 36

表22

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
567	S	H	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
568	S	H	CH_3	2	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
569	S	H	CH_3	2	H		=	OH	H
570	S	H	CH_3	2	CH_3		=	OH	H
571	S	H	CH_3	2	CH_2CH_3		=	OH	H
572	S	H	CH_3	2	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
573	S	H	CH_3	2	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
574	S	H	CH_3	2	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
575	S	H	CH_3	2	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
576	S	H	CH_3	2	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
577	S	H	CH_3	3	H	H	H	OH	H
578	S	H	CH_3	3	CH_3	H	H	OH	H
579	S	H	CH_3	3	CH_2CH_3	H	H	OH	H
580	S	H	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	H	OH	H
581	S	H	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
582	S	H	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	H	OH	H
583	S	H	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
584	S	H	CH_3	3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
585	S	H	CH_3	3	H	H	OH	OH	H
586	S	H	CH_3	3	CH_3	H	OH	OH	H
587	S	H	CH_3	3	CH_2CH_3	H	OH	OH	H
588	S	H	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$	H	OH	OH	H
589	S	H	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
590	S	H	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$	H	OH	OH	H
591	S	H	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
592	S	H	CH_3	3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
593	S	H	CH_3	3	H		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 37

表２３

	X	R1	R2	m	R8	R4	R5	R6	R7
594	S	H	CH_3	3	CH_3		=	OH	H
595	S	H	CH_3	3	CH_2CH_3		=	OH	H
596	S	H	CH_3	3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
597	S	H	CH_3	3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
598	S	H	CH_3	3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
599	S	H	CH_3	3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
600	S	H	CH_3	3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 38

表24

	X	R1	R2	m	R3=SR8 R8	R4	R5	R6	R7
1	O	H	H	1	CH_2CH_3	=		OH	H
2	O	H	H	1	$CH(CH_3)_2$	=		OH	H
3	O	H	H	1	$C(CH_3)_3$	=		OH	H
4	O	CH_3	H	1	CH_2CH_3	=		OH	H
5	O	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$	=		OH	H
6	O	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$	=		OH	H
7	O	H	CH_3	1	CH_2CH_3	=		OH	H
8	O	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	=		OH	H
9	O	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	=		OH	H
10	O	CH_3	CH_3	1	CH_2CH_3	=		OH	H
11	O	CH_3	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	=		OH	H
12	O	CH_3	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	=		OH	H
13	S	H	H	1	CH_2CH_3	=		OH	H
14	S	H	H	1	$CH(CH_3)_2$	=		OH	H
15	S	H	H	1	$C(CH_3)_3$	=		OH	H
16	S	CH_3	H	1	CH_2CH_3	=		OH	H
17	S	CH_3	H	1	$CH(CH_3)_2$	=		OH	H
18	S	CH_3	H	1	$C(CH_3)_3$	=		OH	H
19	S	H	CH_3	1	CH_2CH_3	=		OH	H
20	S	H	CH_3	1	$CH(CH_3)_2$	=		OH	H
21	S	H	CH_3	1	$C(CH_3)_3$	=		OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 39

表２５

R3=NR9R10

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
1	O	H	H	1	H	H	H	H	OH	H
2	O	H	H	1	H	CH_3	H	H	OH	H
3	O	H	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
4	O	H	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
5	O	H	H	1	H	H	H	OH	OH	H
6	O	H	H	1	H	CH_3	H	OH	OH	H
7	O	H	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
8	O	H	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
9	O	H	H	1	H	H		=	OH	H
10	O	H	H	1	H	CH_3		=	OH	H
11	O	H	H	1	H	CH_2CH_3		=	OH	H
12	O	H	H	1	H	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
13	O	H	H	1	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
14	O	H	H	1	H	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
15	O	H	H	1	H	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
16	O	H	H	1	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
17	O	H	H	1	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
18	O	H	H	1	H	cyclopropyl		=	OH	H
19	O	H	H	1	H	cyclobutyl		=	OH	H
20	O	H	H	1	H	cyclopentyl		=	OH	H
21	O	H	H	1	H	cyclohexyl		=	OH	H
22	O	H	H	1	H	cycloheptyl		=	OH	H
23	O	H	H	1	H	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
24	O	H	H	1	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
25	O	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
26	O	H	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
27	O	H	H	1	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 40

表26

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
28	O	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
29	O	H	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
30	O	H	H	1	CH_3	CH_3		=	OH	H
31	O	H	H	1	CH_3	CH_2CH_3		=	OH	H
32	O	H	H	1	CH_3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
33	O	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
34	O	H	H	1	CH_3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
35	O	H	H	1	CH_3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
36	O	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
37	O	H	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
38	O	H	H	1		$-(CH_2)_2-$		=	OH	H
39	O	H	H	1		$-(CH_2)_3-$		=	OH	H
40	O	H	H	1		$-(CH_2)_4-$		=	OH	H
41	O	H	H	1		$-(CH_2)_5-$		=	OH	H
42	O	H	H	1		$-(CH_2)_6-$		=	OH	H
43	O	H	H	2	H	H	H	H	OH	H
44	O	H	H	2	H	CH_3	H	H	OH	H
45	O	H	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
46	O	H	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
47	O	H	H	2	H	H	H	OH	OH	H
48	O	H	H	2	H	CH_3	H	OH	OH	H
49	O	H	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
50	O	H	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
51	O	H	H	2	H	H		=	OH	H
52	O	H	H	2	H	CH_3		=	OH	H
53	O	H	H	2	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
54	O	H	H	2	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
55	O	H	H	2	CH_3	CH_3	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（ 41

表２７

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
56	O	H	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
57	O	H	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
58	O	H	H	2	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
59	O	H	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
60	O	H	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
61	O	H	H	2	CH_3	CH_3		=	OH	H
62	O	H	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
63	O	H	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
64	O	H	H	3	H	H	H	H	OH	H
65	O	H	H	3	H	CH_3	H	H	OH	H
66	O	H	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
67	O	H	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
68	O	H	H	3	H	H	H	OH	OH	H
69	O	H	H	3	H	CH_3	H	OH	OH	H
70	O	H	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
71	O	H	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
72	O	H	H	3	H	H		=	OH	H
73	O	H	H	3	H	CH_3		=	OH	H
74	O	H	H	3	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
75	O	H	H	3	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
76	O	H	H	3	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
77	O	H	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
78	O	H	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
79	O	H	H	3	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
80	O	H	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
81	O	H	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
82	O	H	H	3	CH_3	CH_3		=	OH	H
83	O	H	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 42

表２８

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
84	O	H	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
85	O	CH_3	H	1	H	H	H	H	OH	H
86	O	CH_3	H	1	H	CH_3	H	H	OH	H
87	O	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
88	O	CH_3	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
89	O	CH_3	H	1	H	H	H	OH	OH	H
90	O	CH_3	H	1	H	CH_3	H	OH	OH	H
91	O	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
92	O	CH_3	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
93	O	CH_3	H	1	H	H		=	OH	H
94	O	CH_3	H	1	H	CH_3		=	OH	H
95	O	CH_3	H	1	H	OCH_3		=	OH	H
96	O	CH_3	H	1	H	CH_2CH_3		=	OH	H
97	O	CH_3	H	1	H	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
98	O	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
99	O	CH_3	H	1	H	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
100	O	CH_3	H	1	H	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
101	O	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
102	O	CH_3	H	1	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
103	O	CH_3	H	1	H	$CH_2(CH(CH_3)_2)$		=	OH	H
104	O	CH_3	H	1	H	$CH(CH_2CH_3)_2$		=	OH	H
105	O	CH_3	H	1	H	$CH_2C(CH_3)_3$		=	OH	H
106	O	CH_3	H	1	H	$CH_2(CH(CH_2CH_3)_2)$		=	OH	H
107	O	CH_3	H	1	H	$CH((CH_2)_2CH_3)_2$		=	OH	H
108	O	CH_3	H	1	H	cyclopropyl		=	OH	H
109	O	CH_3	H	1	H	cyclobutyl		=	OH	H
110	O	CH_3	H	1	H	cyclopentyl		=	OH	H
111	O	CH_3	H	1	H	cyclohexyl		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

43

五、發明說明（　）

表29

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
112	O	CH_3	H	1	H	cycloheptyl		=	OH	H
113	O	CH_3	H	1	H	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
114	O	CH_3	H	1	H	CH_2CF_3		=	OH	H
115	O	CH_3	H	1	H	$CH_2CF_2CF_3$		=	OH	H
116	O	CH_3	H	1	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
117	O	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
118	O	CH_3	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
119	O	CH_3	H	1	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
120	O	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
121	O	CH_3	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
122	O	CH_3	H	1	CH_3	CH_3		=	OH	H
123	O	CH_3	H	1	CH_3	OCH_3		=	OH	H
124	O	CH_3	H	1	CH_3	CH_2CH_3		=	OH	H
125	O	CH_3	H	1	CH_3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
126	O	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
127	O	CH_3	H	1	CH_3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
128	O	CH_3	H	1	CH_3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
129	O	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
130	O	CH_3	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
131	O	CH_3	H	1		$-(CH_2)_2-$		=	OH	H
132	O	CH_3	H	1		$-(CH_2)_3-$		=	OH	H
133	O	CH_3	H	1		$-(CH_2)_4-$		=	OH	H
134	O	CH_3	H	1		$-(CH_2)_5-$		=	OH	H
135	O	CH_3	H	1		$-(CH_2)_6-$		=	OH	H
136	O	CH_3	H	2	H	H	H	H	OH	H
137	O	CH_3	H	2	H	CH_3	H	H	OH	H
138	O	CH_3	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
139	O	CH_3	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 44 ）

表30

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
140	O	CH_3	H	2	H	H	H	OH	OH	H
141	O	CH_3	H	2	H	CH_3	H	OH	OH	H
142	O	CH_3	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
143	O	CH_3	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
144	O	CH_3	H	2	H	H		=	OH	H
145	O	CH_3	H	2	H	CH_3		=	OH	H
146	O	CH_3	H	2	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
147	O	CH_3	H	2	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
148	O	CH_3	H	2	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
149	O	CH_3	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
150	O	CH_3	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
151	O	CH_3	H	2	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
152	O	CH_3	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
153	O	CH_3	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
154	O	CH_3	H	2	CH_3	CH_3		=	OH	H
155	O	CH_3	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
156	O	CH_3	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
157	O	CH_3	H	3	H	H	H	H	OH	H
158	O	CH_3	H	3	H	CH_3	H	H	OH	H
159	O	CH_3	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
160	O	CH_3	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
161	O	CH_3	H	3	H	H	H	OH	OH	H
162	O	CH_3	H	3	H	CH_3	H	OH	OH	H
163	O	CH_3	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
164	O	CH_3	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
165	O	CH_3	H	3	H	H		=	OH	H
166	O	CH_3	H	3	H	CH_3		=	OH	H
167	O	CH_3	H	3	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 45 ）

表３１

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
168	O	CH_3	H	3	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
169	O	CH_3	H	3	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
170	O	CH_3	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
171	O	CH_3	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
172	O	CH_3	H	3	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
173	O	CH_3	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
174	O	CH_3	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
175	O	CH_3	H	3	CH_3	CH_3		=	OH	H
176	O	CH_3	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
177	O	CH_3	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
178	O	H	CH_3	1	H	H	H	H	OH	H
179	O	H	CH_3	1	H	CH_3	H	H	OH	H
180	O	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
181	O	H	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
182	O	H	CH_3	1	H	H	H	OH	OH	H
183	O	H	CH_3	1	H	CH_3	H	OH	OH	H
184	O	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
185	O	H	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
186	O	H	CH_3	1	H	H		=	OH	H
187	O	H	CH_3	1	H	CH_3		=	OH	H
188	O	H	CH_3	1	H	CH_2CH_3		=	OH	H
189	O	H	CH_3	1	H	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
190	O	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
191	O	H	CH_3	1	H	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
192	O	H	CH_3	1	H	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
193	O	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
194	O	H	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
195	O	H	CH_3	1	CH_3	CH_3	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 46 ）

表３２

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
196	O	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
197	O	H	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
198	O	H	CH_3	1	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
199	O	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
200	O	H	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
201	O	H	CH_3	1	CH_3	CH_3		=	OH	H
202	O	H	CH_3	1	CH_3	CH_2CH_3		=	OH	H
203	O	H	CH_3	1	CH_3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
204	O	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
205	O	H	CH_3	1	CH_3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
206	O	H	CH_3	1	CH_3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
207	O	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
208	O	H	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
209	O	H	CH_3	2	H	H	H	H	OH	H
210	O	H	CH_3	2	H	CH_3	H	H	OH	H
211	O	H	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
212	O	H	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
213	O	H	CH_3	2	H	H	H	OH	OH	H
214	O	H	CH_3	2	H	CH_3	H	OH	OH	H
215	O	H	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
216	O	H	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
217	O	H	CH_3	2	H	H		=	OH	H
218	O	H	CH_3	2	H	CH_3		=	OH	H
219	O	H	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
220	O	H	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
221	O	H	CH_3	2	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
222	O	H	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
223	O	H	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 47 ）

表33

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
224	O	H	CH_3	2	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
225	O	H	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
226	O	H	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
227	O	H	CH_3	2	CH_3	CH_3		=	OH	H
228	O	H	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
229	O	H	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
230	O	H	CH_3	3	H	H	H	H	OH	H
231	O	H	CH_3	3	H	CH_3	H	H	OH	H
232	O	H	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
233	O	H	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
234	O	H	CH_3	3	H	H	H	OH	OH	H
235	O	H	CH_3	3	H	CH_3	H	OH	OH	H
236	O	H	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
237	O	H	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
238	O	H	CH_3	3	H	H		=	OH	H
239	O	H	CH_3	3	H	CH_3		=	OH	H
240	O	H	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
241	O	H	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
242	O	H	CH_3	3	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
243	O	H	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
244	O	H	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
245	O	H	CH_3	3	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
246	O	H	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
247	O	H	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
248	O	H	CH_3	3	CH_3	CH_3		=	OH	H
249	O	H	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
250	O	H	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
251	O	CH_3	CH_3	1	H	H	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 48 ）

表３４

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
252	O	CH_3	CH_3	1	H	CH_3	H	H	OH	H
253	O	CH_3	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
254	O	CH_3	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
255	O	CH_3	CH_3	1	H	H	H	OH	OH	H
256	O	CH_3	CH_3	1	H	CH_3	H	OH	OH	H
257	O	CH_3	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
258	O	CH_3	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
259	O	CH_3	CH_3	1	H	H		=	OH	H
260	O	CH_3	CH_3	1	H	CH_3		=	OH	H
261	O	CH_3	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
262	O	CH_3	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
263	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
264	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
265	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
266	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
267	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
268	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
269	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	CH_3		=	OH	H
270	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
271	O	CH_3	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
272	O	CH_3	CH_3	2	H	H	H	H	OH	H
273	O	CH_3	CH_3	2	H	CH_3	H	H	OH	H
274	O	CH_3	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
275	O	CH_3	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
276	O	CH_3	CH_3	2	H	H	H	OH	OH	H
277	O	CH_3	CH_3	2	H	CH_3	H	OH	OH	H
278	O	CH_3	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
279	O	CH_3	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（49）

表35

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
280	O	CH_3	CH_3	2	H	H		=	OH	H
281	O	CH_3	CH_3	2	H	CH_3		=	OH	H
282	O	CH_3	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
283	O	CH_3	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
284	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
285	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
286	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
287	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
288	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
289	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
290	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	CH_3		=	OH	H
291	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
292	O	CH_3	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
293	O	CH_3	CH_3	3	H	H	H	H	OH	H
294	O	CH_3	CH_3	3	H	CH_3	H	H	OH	H
295	O	CH_3	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
296	O	CH_3	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
297	O	CH_3	CH_3	3	H	H	H	OH	OH	H
298	O	CH_3	CH_3	3	H	CH_3	H	OH	OH	H
299	O	CH_3	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
300	O	CH_3	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
301	O	CH_3	CH_3	3	H	H		=	OH	H
302	O	CH_3	CH_3	3	H	CH_3		=	OH	H
303	O	CH_3	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
304	O	CH_3	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
305	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
306	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
307	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 50

表36

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
308	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
309	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
310	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
311	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	CH_3		=	OH	H
312	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
313	O	CH_3	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
314	S	H	H	1	H	H	H	H	OH	H
315	S	H	H	1	H	CH_3	H	H	OH	H
316	S	H	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
317	S	H	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
318	S	H	H	1	H	H	H	OH	OH	H
319	S	H	H	1	H	CH_3	H	OH	OH	H
320	S	H	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
321	S	H	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
322	S	H	H	1	H	H		=	OH	H
323	S	H	H	1	H	CH_3		=	OH	H
324	S	H	H	1	H	CH_2CH_3		=	OH	H
325	S	H	H	1	H	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
326	S	H	H	1	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
327	S	H	H	1	H	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
328	S	H	H	1	H	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
329	S	H	H	1	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
330	S	H	H	1	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
331	S	H	H	1	H	cyclopropyl		=	OH	H
332	S	H	H	1	H	cyclobutyl		=	OH	H
333	S	H	H	1	H	cyclopentyl		=	OH	H
334	S	H	H	1	H	cyclohexyl		=	OH	H
335	S	H	H	1	H	cycloheptyl		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 51）

表37

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
336	S	H	H	1	H	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
337	S	H	H	1	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
338	S	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
339	S	H	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
340	S	H	H	1	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
341	S	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
342	S	H	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
343	S	H	H	1	CH_3	CH_3		=	OH	H
344	S	H	H	1	CH_3	CH_2CH_3		=	OH	H
345	S	H	H	1	CH_3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
346	S	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
347	S	H	H	1	CH_3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
348	S	H	H	1	CH_3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
349	S	H	H	1	CH_3	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
350	S	H	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
351	S	H	H	1		$-(CH_2)_2-$		=	OH	H
352	S	H	H	1		$-(CH_2)_3-$		=	OH	H
353	S	H	H	1		$-(CH_2)_4-$		=	OH	H
354	S	H	H	1		$-(CH_2)_5-$		=	OH	H
355	S	H	H	1		$-(CH_2)_6-$		=	OH	H
356	S	H	H	2	H	H	H	H	OH	H
357	S	H	H	2	H	CH_3	H	H	OH	H
358	S	H	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
359	S	H	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
360	S	H	H	2	H	H	H	OH	OH	H
361	S	H	H	2	H	CH_3	H	OH	OH	H
362	S	H	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
363	S	H	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 52 ）

表38

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
364	S	H	H	2	H	H		=	OH	H
365	S	H	H	2	H	CH_3		=	OH	H
366	S	H	H	2	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
367	S	H	H	2	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
368	S	H	H	2	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
369	S	H	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
370	S	H	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
371	S	H	H	2	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
372	S	H	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
373	S	H	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
374	S	H	H	2	CH_3	CH_3		=	OH	H
375	S	H	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
376	S	H	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
377	S	H	H	3	H	H	H	H	OH	H
378	S	H	H	3	H	CH_3	H	H	OH	H
379	S	H	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
380	S	H	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
381	S	H	H	3	H	H	H	OH	OH	H
382	S	H	H	3	H	CH_3	H	OH	OH	H
383	S	H	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
384	S	H	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
385	S	H	H	3	H	H		=	OH	H
386	S	H	H	3	H	CH_3		=	OH	H
387	S	H	H	3	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
388	S	H	H	3	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
389	S	H	H	3	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
390	S	H	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
391	S	H	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 53）

表39

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
392	S	H	H	3	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
393	S	H	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
394	S	H	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
395	S	H	H	3	CH_3	CH_3		=	OH	H
396	S	H	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
397	S	H	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
398	S	CH_3	H	1	H	H	H	H	OH	H
399	S	CH_3	H	1	H	CH_3	H	H	OH	H
400	S	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
401	S	CH_3	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
402	S	CH_3	H	1	H	H	H	OH	OH	H
403	S	CH_3	H	1	H	CH_3	H	OH	OH	H
404	S	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
405	S	CH_3	H	1	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
406	S	CH_3	H	1	H	H		=	OH	H
407	S	CH_3	H	1	H	CH_3		=	OH	H
408	S	CH_3	H	1	H	CH_2CH_3		=	OH	H
409	S	CH_3	H	1	H	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
410	S	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
411	S	CH_3	H	1	H	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
412	S	CH_3	H	1	H	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
413	S	CH_3	H	1	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
414	S	CH_3	H	1	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
415	S	CH_3	H	1	H	cyclopropyl		=	OH	H
416	S	CH_3	H	1	H	cyclobutyl		=	OH	H
417	S	CH_3	H	1	H	cyclopentyl		=	OH	H
418	S	CH_3	H	1	H	cyclohexyl		=	OH	H
419	S	CH_3	H	1	H	cycloheptyl		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 54）

表４０

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
420	S	CH_3	H	1	H	$CH(CF_3)_2$		=	OH	H
421	S	CH_3	H	1	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
422	S	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
423	S	CH_3	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
424	S	CH_3	H	1	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
425	S	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
426	S	CH_3	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
427	S	CH_3	H	1	CH_3	CH_3		=	OH	H
428	S	CH_3	H	1	CH_3	OCH_3		=	OH	H
429	S	CH_3	H	1	CH_3	CH_2CH_3		=	OH	H
430	S	CH_3	H	1	CH_3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
431	S	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
432	S	CH_3	H	1	CH_3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
433	S	CH_3	H	1	CH_3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
434	S	CH_3	H	1	CH_3	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
435	S	CH_3	H	1	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
436	S	CH_3	H	1		$-(CH_2)_2-$		=	OH	H
437	S	CH_3	H	1		$-(CH_2)_3-$		=	OH	H
438	S	CH_3	H	1		$-(CH_2)_4-$		=	OH	H
439	S	CH_3	H	1		$-(CH_2)_5-$		=	OH	H
440	S	CH_3	H	1		$-(CH_2)_6-$		=	OH	H
441	S	CH_3	H	2	H	H	H	H	OH	H
442	S	CH_3	H	2	H	CH_3	H	H	OH	H
443	S	CH_3	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
444	S	CH_3	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
445	S	CH_3	H	2	H	H	H	OH	OH	H
446	S	CH_3	H	2	H	CH_3	H	OH	OH	H
447	S	CH_3	H	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 55）

表４１

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
448	S	CH_3	H	2	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
449	S	CH_3	H	2	H	H		=	OH	H
450	S	CH_3	H	2	H	CH_3		=	OH	H
451	S	CH_3	H	2	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
452	S	CH_3	H	2	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
453	S	CH_3	H	2	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
454	S	CH_3	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
455	S	CH_3	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
456	S	CH_3	H	2	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
457	S	CH_3	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
458	S	CH_3	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
459	S	CH_3	H	2	CH_3	CH_3		=	OH	H
460	S	CH_3	H	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
461	S	CH_3	H	2	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
462	S	CH_3	H	3	H	H	H	H	OH	H
463	S	CH_3	H	3	H	CH_3	H	H	OH	H
464	S	CH_3	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
465	S	CH_3	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
466	S	CH_3	H	3	H	H	H	OH	OH	H
467	S	CH_3	H	3	H	CH_3	H	OH	OH	H
468	S	CH_3	H	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
469	S	CH_3	H	3	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
470	S	CH_3	H	3	H	H		=	OH	H
471	S	CH_3	H	3	H	CH_3		=	OH	H
472	S	CH_3	H	3	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
473	S	CH_3	H	3	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
474	S	CH_3	H	3	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
475	S	CH_3	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 56 ）

表４２

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
476	S	CH_3	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
477	S	CH_3	H	3	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
478	S	CH_3	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
479	S	CH_3	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
480	S	CH_3	H	3	CH_3	CH_3		=	OH	H
481	S	CH_3	H	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
482	S	CH_3	H	3	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
483	S	H	CH_3	1	H	H	H	H	OH	H
484	S	H	CH_3	1	H	CH_3	H	H	OH	H
485	S	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
486	S	H	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
487	S	H	CH_3	1	H	H	H	OH	OH	H
488	S	H	CH_3	1	H	CH_3	H	OH	OH	H
489	S	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
490	S	H	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
491	S	H	CH_3	1	H	H		=	OH	H
492	S	H	CH_3	1	H	CH_3		=	OH	H
493	S	H	CH_3	1	H	CH_2CH_3		=	OH	H
494	S	H	CH_3	1	H	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
495	S	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
496	S	H	CH_3	1	H	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
497	S	H	CH_3	1	H	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
498	S	H	CH_3	1	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
499	S	H	CH_3	1	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
500	S	H	CH_3	1	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
501	S	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
502	S	H	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
503	S	H	CH_3	1	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 57）

表43

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
504	S	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
505	S	H	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
506	S	H	CH_3	1	CH_3	CH_3		=	OH	H
507	S	H	CH_3	1	CH_3	CH_2CH_3		=	OH	H
508	S	H	CH_3	1	CH_3	$(CH_2)_2CH_3$		=	OH	H
509	S	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
510	S	H	CH_3	1	CH_3	$(CH_2)_3CH_3$		=	OH	H
511	S	H	CH_3	1	CH_3	$CH_2CH(CH_3)_2$		=	OH	H
512	S	H	CH_3	1	CH_3	$CH(CH_3)CH_2CH_3$		=	OH	H
513	S	H	CH_3	1	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
514	S	H	CH_3	2	H	H	H	H	OH	H
515	S	H	CH_3	2	H	CH_3	H	H	OH	H
516	S	H	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
517	S	H	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
518	S	H	CH_3	2	H	H	H	OH	OH	H
519	S	H	CH_3	2	H	CH_3	H	OH	OH	H
520	S	H	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
521	S	H	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
522	S	H	CH_3	2	H	H		=	OH	H
523	S	H	CH_3	2	H	CH_3		=	OH	H
524	S	H	CH_3	2	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
525	S	H	CH_3	2	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
526	S	H	CH_3	2	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
527	S	H	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
528	S	H	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
529	S	H	CH_3	2	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
530	S	H	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
531	S	H	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝 訂 線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 58）

表４４

	X	R1	R2	m	R9	R10	R4	R5	R6	R7
532	S	H	CH_3	2	CH_3	CH_3		=	OH	H
533	S	H	CH_3	2	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
534	S	H	CH_3	2	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
535	S	H	CH_3	3	H	H	H	H	OH	H
536	S	H	CH_3	3	H	CH_3	H	H	OH	H
537	S	H	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
538	S	H	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
539	S	H	CH_3	3	H	H	H	OH	OH	H
540	S	H	CH_3	3	H	CH_3	H	OH	OH	H
541	S	H	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
542	S	H	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
543	S	H	CH_3	3	H	H		=	OH	H
544	S	H	CH_3	3	H	CH_3		=	OH	H
545	S	H	CH_3	3	H	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
546	S	H	CH_3	3	H	$C(CH_3)_3$		=	OH	H
547	S	H	CH_3	3	CH_3	CH_3	H	H	OH	H
548	S	H	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	H	OH	H
549	S	H	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	H	OH	H
550	S	H	CH_3	3	CH_3	CH_3	H	OH	OH	H
551	S	H	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$	H	OH	OH	H
552	S	H	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$	H	OH	OH	H
553	S	H	CH_3	3	CH_3	CH_3		=	OH	H
554	S	H	CH_3	3	CH_3	$CH(CH_3)_2$		=	OH	H
555	S	H	CH_3	3	CH_3	$C(CH_3)_3$		=	OH	H

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

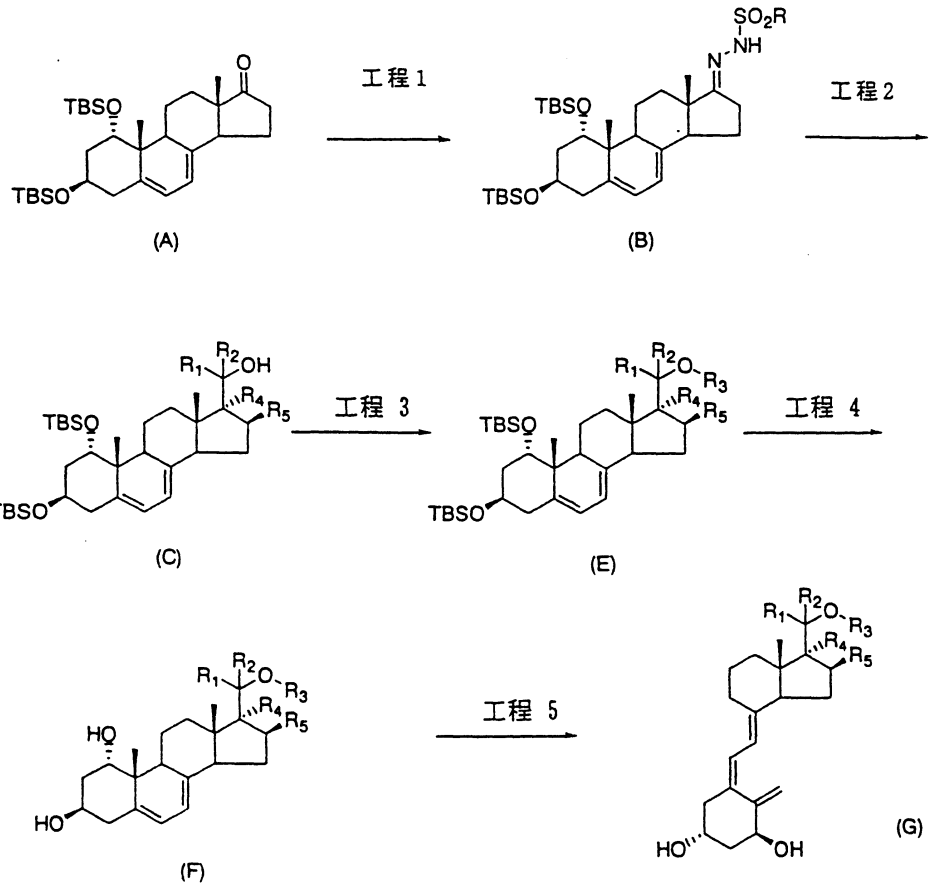
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（59）

本發明之式（1）所示維他命D衍生物可依以下方法方法製造，惟並不特別限於此方法，亦可用公知之方法合成。

Ⅰ．合成式（1）中X爲氧原子之維他命D衍生物

式（1）中，X爲氧原子，R_6爲羥基，且R_7爲氫原子之維他命D衍生物可依以下方法，以特開昭61－267550或E. Murayama et al, Chem. Pharm. Bull., 34 (10) 1986 4410-4413，所記載式（A）所示化合物爲起始物質予以製造。



式中TBS係示第三丁基二甲基矽烷基。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（60）

（步驟１）脒化反應

於適當溶媒中，使化合物（Ａ）與芳磺基醯肼或烷磺基醯肼反應，合成爲化合物（Ｂ）。

此反應中所用芳磺基醯肼或烷磺基醯肼可爲例如苯磺基醯肼，對甲苯磺基醯肼，間甲苯磺基醯肼，鄰甲苯磺基醯肼，４－乙苯磺基醯肼，２－伸茉磺基醯肼，４－氯苯磺基醯肼，４－異丙苯磺基醯肼，２，４，６－三異丙苯磺基醯肼，甲磺基醯肼，２－甲基－２－丙磺基醯肼，２－丙磺基醯肼，乙磺基醯肼等。較佳係苯磺基醯肼，對甲苯磺基醯肼，２，４，６－三異丙苯磺基醯肼等。更佳係２，４，６－三異丙苯磺基醯肼。

此反應中所用溶媒可爲烴系，醚系，鹵素系，酯系，醯胺系，醇系，亞碸系，腈系等。例如可爲己烷，苯，甲苯，二乙醚，四氫呋喃，１，４－二噁烷，１，２－二甲氧基乙烷，第三丁基甲醚，二異丙醚，二氯甲烷，氯仿，１，２－二氯乙烷，氯苯，乙酸乙酯，乙酸甲酯，乙酸丙酯，Ｎ，Ｎ－二甲基甲醯胺，Ｎ，Ｎ－二甲基乙醯胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，１，３－二甲基－３，４，５，６－四氫－２（１Ｈ）－嘧啶酮，甲醇，乙醇，丙醇，二甲亞碸，乙腈，丙腈等，較佳係甲苯，二乙醚，四氫呋喃，二氯甲烷，乙酸乙酯等，更佳可用四氫呋喃，乙酸乙酯。

反應溫度係只要反應可進行之溫度，並不特別限制，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（61）

以０～１００℃爲宜，更佳係在室溫進行。

（步驟２）烷基化反應

繼而在適當溶媒中，使化合物（Ｂ）與鹼反應後，使其與甲醛（或其等價物：例如１，３，５－三噁烷，多聚甲醛）或丙酮反應即可合成爲化合物（Ｃ）。

上述反應中所用鹼係例如正丁基鋰，第二丁基鋰，第三丁基鋰，甲基鋰，苯基鋰，溴化甲基鎂，氯化甲基鎂，碘化甲基鎂，溴化異丙基鎂，二異丙基鎂，二異丙基醯胺鋰，雙（三甲基矽烷基）醯胺鋰，２，２，６，６－四甲基六氫吡啶鋰，醯胺鋰，氫化鈉，雙（三甲基矽烷基）醯胺鈉，氫化鉀，雙（三甲基矽烷基）醯胺鉀等。較佳係正丁基鋰，第二丁基鋰，第三丁基鋰，二異丙基醯胺鋰。更佳係正丁基鋰，第二丁基鋰。

又，上述反應中，與鹼反應後亦可添加適當之金屬鹽。金屬鹽可爲氯化鈰，溴化鎂，氯化鎂，氯化鋅，四氯化鈦，三異丙氧基氯鈦，氯化釤，氯化銦等，較佳係氯化鈰。

上述反應中所用溶媒係烴系，醚系。例如戊烷，己烷，苯，甲苯，二乙醚，第三丁基甲醚，四氫呋喃，１，２－二甲氧基乙烷，１，４－二噁烷，苯甲醚等，較佳係己烷，二乙醚，四氫呋喃。更佳係用己烷，四氫呋喃。

又，此反應亦可在醯胺系，胺系化合物之存在下進行。醯胺系，胺系化合物可爲例如１，４－二氮雜二環〔２

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

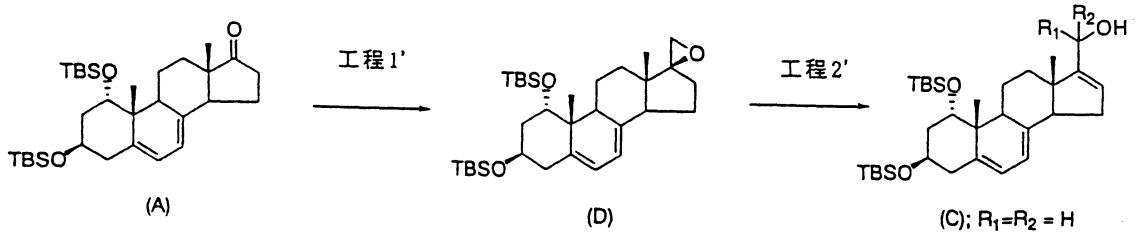
五、發明說明（62）

．２．２〕辛烷，Ｎ，Ｎ，Ｎ′，Ｎ′－四甲基乙二胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，１，３－二甲基－３，４，５，６－四氫－２（１Ｈ）－嘧啶酮，Ｎ，Ｎ－二甲基甲醯胺，Ｎ，Ｎ，二甲基乙醯胺，六甲基化磷三醯胺等，較佳係Ｎ，Ｎ，Ｎ′，Ｎ′－四甲基乙二胺，１，３－二甲基－３，４，５，６－四氫－２（１Ｈ）－嘧啶酮，六甲基磷三醯胺。更佳係Ｎ，Ｎ，Ｎ′，Ｎ′－四甲基乙二胺。

上述反應中使鹼作用時的反應溫度係只要可進行反應溫度即可並不特別限制，惟以－１００～５０℃範圍爲宜。更佳係－８０～２０℃進行反應。

上述反應中使甲醛（或其等價物：例如１，３，５－三噁烷，多聚甲醛）或丙酮時之反應溫度係只要可進行反應之溫度即不特別限制，惟以－１００～５０℃範圍爲宜，更佳係－８０～２０℃爲宜。

Ｒ１及Ｒ２爲氫原子，且Ｒ４及Ｒ５在１６位與１７位形成雙鍵時亦可依以下方法合成。



（步驟１′）環氧化物形成反應

在適當溶媒中，於鹼存在下使化合物（Ａ）與三甲基銃鹽或三甲基亞碸鎓鹽反應，即可合成爲化合物（Ｄ）。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（63）

此反應所用之三甲基銃鹽或三甲基亞碸鎓鹽可爲碘化三甲基銃，溴化三甲基銃，氯化三甲基銃，三甲基銃硫酸酯，三甲基銃四氟化硼酸鹽，三甲基銃全氯酸鹽，碘化三甲基亞碸鎓鹽，溴化三甲基亞碸鎓鹽，氯化三甲基亞碸鎓鹽，三甲基亞碸鎓硫酸甲酯，三甲基亞碸鎓四氟化硼酸鹽，三甲基亞碸鎓全氯酸鹽等，較佳係溴化三甲基銃，碘化三甲基亞碸鎓。

此反應中所用鹼係例如正丁基鋰，第二丁基鋰，第三丁基鋰，甲基鋰，苯基鋰，溴化甲基鎂，氯化甲基鎂，碘化甲基鎂，溴化異丙基鎂，二異丙基醯胺鋰，雙（三甲基矽烷基）醯胺鋰，２，２，６，６－四甲基六氫吡啶鋰，醯胺鋰，氫化鈉，雙（三甲基矽烷基）醯胺鈉，氫化鉀，雙（三甲基矽烷基）醯胺鉀，氫氧化鈉，氫氧化鉀等。較佳係氫化鈉，氫化鉀，正丁基鋰，第二丁基鋰，第三丁基鋰，氫氧化鈉，氫氧化鉀，更佳係氫化鈉，氫化鉀。

此反應中所用溶媒可爲烴系，醚系，醯胺系，亞碸系，例如戊烷，己烷，苯，甲苯，二乙醚，第三丁基甲醚，四氫呋喃，１，２－二甲氧基乙烷，１，４－二噁烷，苯甲醚，二乙二醇二甲醚，Ｎ，Ｎ，二甲基甲醯胺，Ｎ，Ｎ－二甲基乙醯胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，１，３－二甲基－３，４，５，６－四氫－２（１Ｈ）－嘧啶酮，二甲亞碸。較佳係二甲亞碸。視其需要亦可混合醚系溶媒，例如四氫呋喃使用。

上述反應溫度係只要可進行反應之溫度，並不特別限

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（64）

定，較佳係在－２０℃～２０℃進行。

（步驟２´）環氧化物開環反應

在適當溶媒中使化合物（Ｄ）與酸反應即可合成爲化合物（Ｃ）。

此反應所用酸係例如爲鹽酸，硫酸，乙酸，磷酸，三甲醇鋁，三乙醇鋁，三異丙醇鋁，三第三丁醇鋁，氯化鋁，氯化鋅，氯化亞錫，三氯化錫，四氯化鈦，四甲醇鈦，四乙醇鈦，四異丙醇鈦等。較佳係三甲醇鋁，三乙醇鋁，三異丙醇鋁，三第三丁醇鋁等，更佳係三異丙醇鋁。

此反應中所用溶媒可爲烴系，醚系，鹵素系，醯胺系，例如可爲戊烷，己烷，苯，１，２－二氯苯，甲苯，二乙醚，四氫呋喃，１，４－二噁烷，第三丁基甲醚，二乙二醇二甲醚，１，２－二甲氧基乙烷，１，４－二噁烷，苯甲醚，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳，１，２－二氯甲烷，Ｎ，Ｎ－二甲基甲醯胺，Ｎ，Ｎ－二甲基乙醯胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，１，３－二甲基－３，４，５，６－四氫－２（１Ｈ）－嘧啶酮，二甲亞碸等，較佳係苯，１，２－二氯苯，甲苯等，更佳係１，２－二氯苯。

此反應之反應溫度係只要可進行反應之溫度即不予特別限定，惟以０℃～２００℃範圍爲宜，更以８０～１８０℃爲宜。

上述反應亦可用鹼代替酸。鹼可爲正丁基鋰，第二丁

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（65）

基鋰，第三丁基鋰，甲基鋰，苯基鋰，溴化甲基鎂，氯化甲基鎂，碘化甲基鎂，溴化異丙基鎂，二乙醯胺鋰，二異丙醯胺鋰，雙（三甲基矽烷基）醯胺鋰，2，6，6－四甲基六氫吡啶鋰，醯胺鋰，氫化鈉，雙（三甲基矽烷基）醯胺鈉，氫化鉀，雙（三甲基矽烷基）醯胺鉀，二異丙醯胺二乙鋁，2，2，6，6－四甲基六氫吡啶二乙基鋁，氫氧化鈉，氫氧化鉀等。較佳係二乙醯胺鋰，二異丙基鎂，二異丙醯胺鋰，雙（三甲基矽烷基）醯胺鋰，2，2，6，6－四甲基六氫吡啶鋰，醯胺鋰，氫化鈉，雙（三甲基矽烷基）醯胺鈉，氫化鉀，雙（三甲基矽烷基）醯胺鉀，二異丙基醯胺二乙鋁，2，2，6，6－四甲基六氫吡啶二乙基鋁等，更佳係用乙二醯胺鋰。

使用鹼時之溶媒可爲烴系，醚系，鹵素系，醯胺系。例如戊烷，己烷，苯，1，2－二氯苯，甲苯，二乙醚，四氫呋喃，1，4－二噁烷，第三丁基甲醚，二乙二醇二甲醚，1，2－二甲氧基乙烷，1，4－二噁烷，苯甲醚，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳，1，2－二氯甲烷，N，N－二甲基甲醯胺，N，N－二甲基乙醯胺，1，3－二甲基－2－咪唑啶酮，1，3－二甲基－3，4，5，6－四氫－2（1H）－嘧啶酮，二甲亞碸等，較佳係苯，甲苯，二乙醚，四氫呋喃等。

使用鹼時之反應溫度係只要可進行反應之溫度即不予特別限定，惟以－40℃～200℃範圍爲宜，更以0～100℃爲宜。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（66）

（步驟３）導入側鏈

在鹼存在下，使上述步驟（１）～（２）或步驟（１´）～（２´）等方法所得化合物（Ｃ），與相對應側鏈之烷基化劑反應，導入側鏈，得化合物（Ｅ）。

使用之烷基化劑係使用對應於式（１）所示本發明化合物之R_3的烷基化劑。即，可爲對應於側鏈R_3的式

$$Z-(CH_2)_m-COR_3$$

（式中Ｚ示鹵素原子，甲磺醯氧基，甲苯磺醯氧基，三氟化甲磺醯氧基等脫離基）

或

$$CH_2=CH-COR_3$$

（特開平６－７２９９４，T. Mikami, T. Iwaoka, M. Kato, H. Watanabe, and N. Kubodera; Synth. Commun. 27(14), 1997, 2363- 2369）等。

$Z-(CH_2)_m-COR_3$可爲例如溴代乙酸第三丁酯，Ｎ－第三丁基溴代乙醯胺，Ｎ－第三丁基－Ｎ－甲基溴化乙醯胺等。

$CH_2=CH-COR_3$可爲例如丙烯酸，丙烯酸甲酯，丙烯酸乙酯，丙烯酸正丙酯，丙烯酸異丙酯，丙烯酸丁

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（67）

酯，丙烯酸第三丁酯，丙烯醯胺，N－甲基丙烯醯胺，N，N－二甲基丙烯醯胺，N－乙基丙烯醯胺，N，N－二乙基丙烯醯胺，N－第三丁基丙烯醯胺等。

鹼可爲例如鹼金屬鹽氫化物，鹼金屬烷氧化物，金屬二烷基醯胺，鹼金屬等，較佳係氫化鈉，氫化鉀，第三丁醇鉀，二異丙醯胺鋰，雙（三甲基矽烷基）醯胺鋰，甲基鋰，正丁基鋰，溴化乙基鎂等，更佳係氫化鈉，氫化鉀。

又，本反應亦可在冠醚存在下進行。冠醚可爲例如15－冠－5，18－冠－6，二苯并－18－冠－6等。

溶媒可爲例如烴系，醚系，醯胺系溶媒，具體言係苯，甲苯，二乙醚，四氫呋喃，1，2－二甲氧基乙烷，1，4－二噁烷，N，N－二甲基乙醯胺，N，N－二甲基甲醯胺，1，3－二甲基－2－咪唑啶酮，1，3－二甲基－3，4，5，6－四氫－2（1H）－嘧啶酮等，較佳係四氫呋喃，1，2－二甲氧基乙烷，N，N－二甲基甲醯胺，1，3－二甲基－2－咪唑啶酮，更佳係四氫呋喃。

反應溫度係視基質而不同，通常係在－40℃～使用之溶媒沸點或分解點以下範圍，較佳係0～200℃，更佳係室溫～120℃左右。

又，側鏈之導入並不特別限於上述方法，亦可依斯業者熟知之方法進行。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（68）

（步驟４）脫保護

依常法，自化合物（Ｅ）除去保護基，得化合物（Ｆ）。

試藥可用鹽酸，硫酸，乙酸，酸性離子交換樹脂，氟化四丁基銨，氟化氫／吡啶，氟化氫／三乙胺，氟化氫酸，較佳係用酸性離子交換樹脂，氟化四丁基銨，氟化氫／吡啶。

溶媒係通常可用醚系溶媒，較佳係四氫呋喃。反應溫度係因基質而不同，通常於室溫～６５℃範圍進行爲宜。

（步驟５）光反應‧熱異構化

依常法進行化合物（Ｆ）之光反應‧熱異構化，得化合物（Ｇ）。

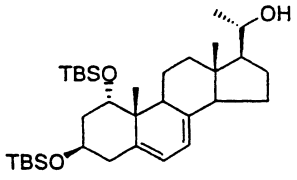
又，進行步驟３，４，５時未必按其順序並不予限定，亦可爲步驟３→步驟５→步驟４或步驟５→步驟３→步驟４之順序，惟不會有步驟３之前先進行步驟４之事。

又，各步驟中還可視其需要進行藉由加溶媒分解（包含水解在內）一酯。醯胺化，酯交換反應等公知方法（Larock, R. C., Comprehensive Organic Transformations, 2nd. ed.; Wiley-VCH: New York, 1999）的側鏈部份修飾。

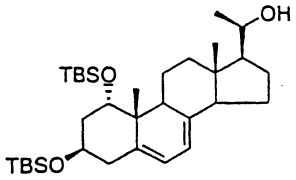
又，例如使用如下化合物做爲式（Ｃ）所示化合物，進行自步驟或步驟５之處理。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

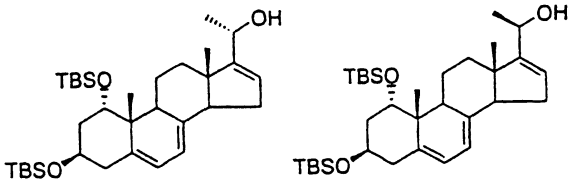
五、發明說明（69）



此化合物係記於記載於特開昭６１－２６７５５０或 E. Murayama, K. Miyamoto, N. Kubodera, T. Mori, and I. Matsunaga; Chem. Pharm. Bull. 34(10), 1986, 4410-4413 者。



此化合物係記載於特開平６－８６６２６及 N. Kubodera, H. Watanabe, K. Miyamoto, and M. Matsumoto; Bioorg. Med. Chem. Lett. 3(9), 1993, 1869- 1872 等者。



此等化合物係記載於特開平１０－２１２８４者。

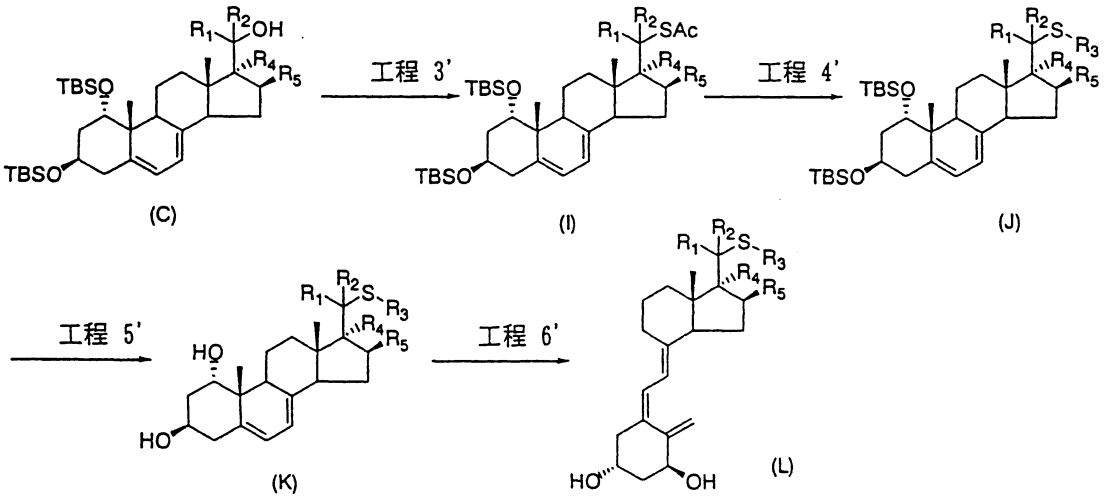
Ⅱ　合成式（１）中Ｘ爲硫原子之維他命Ｄ衍生物

式（１）中Ｘ爲硫原子，Ｒ６爲羥基，且Ｒ７爲氫原子之維他命Ｄ衍生物，可自經由上述步驟１，２等所得化合

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

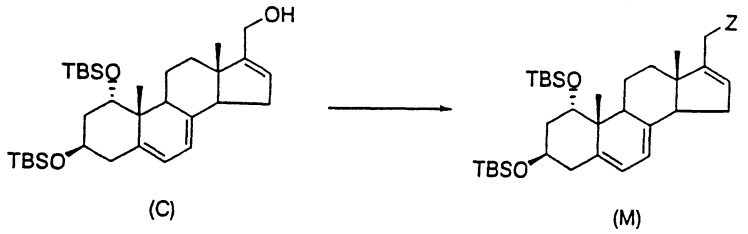
五、發明說明（70）

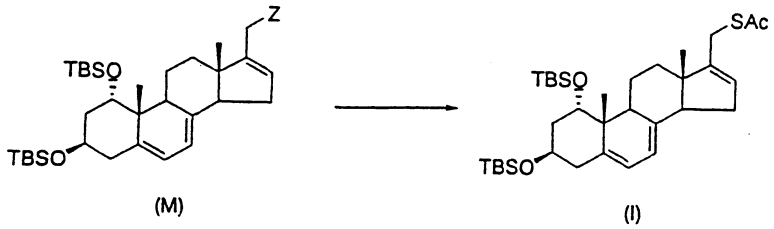
物（C），依例以下方法合成。



（步驟3'）導入硫官能基

對化合物（C）進行以下二個反應得化合物（I）。





在此Z示脫離基，例如爲氯原子，溴原子，碘原子，甲磺醯氧基，甲苯磺醯氧基等。

自化合物（C）轉換爲化合物（M）之脫離基可依常法進行（Larock, R. C. Comprehensive Organic Transformations, 2nd ed., ; Wiley-VCH: New York, 1999）。

上述式中係示化合物（C）中R_1及R_2爲氫原子，且R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵時的反應，其以

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（71）

外者亦可依同樣反應進行。

繼而在適當之溶媒中使化合物（Ｍ）與硫代羧酸或二硫代羧酸之金屬鹽反應，合成爲化合物（Ｉ）。

硫代羧酸或二硫代羧酸之金屬鹽可爲例如硫代乙酸鈉，硫代乙酸鉀，硫代苯甲酸鈉，硫代苯甲酸鉀，二硫代乙酸鈉，二硫代乙酸鉀，二硫代苯甲酸鈉，二硫代苯甲酸鉀等，較佳係硫代乙酸鉀。

溶媒可爲烴系，醚系，鹵素系，酮·酯·醯胺系，亞碸系，腈系溶媒等。例如可爲己烷，苯，甲苯，二乙醚，四氫呋喃，１，４－二噁烷，１，２－二甲氧基乙烷，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳，丙酮，乙酸乙酯，Ｎ，Ｎ－二甲基乙醯胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，１，３－二甲基－３，４，５，６－四氫－２（１Ｈ）－嘧啶酮，二甲亞碸，乙腈等，較佳係二乙醚，四氫呋喃，１，４－二噁烷，１，２－二甲氧基乙烷，丙酮，Ｎ，Ｎ－二甲基甲醯胺，Ｎ，Ｎ－二甲基乙醯胺，１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，二甲亞碸等，更佳係四氫呋喃，丙酮，二甲亞碸。此等溶媒亦可混合二種以上使用。

反應溫度係只要可進行反應之溫度，並不特別限定，通常係－５０～１００℃範圍，較佳係０℃～室溫。

上述二個反應亦可連續進行。即，將羥基轉換爲脫離基後，不施予後處理即與硫代羧酸或二硫代羧酸之金屬鹽反應。

（步驟４´）鹼溶媒分解作用·Ｓ－烷基化

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（72）

使化合物（Ⅰ）進行鹼溶媒分解作用，同時使其S－烷基化即可得化合物（Ｊ）。

鹼溶媒分解作用及S－烷基化所用鹼係氫氧化鋰，氫氧化鈉，氫氧化鋰，甲醇鈉，甲醇鉀等，較佳係用氫氧化鈉，氫氧化鉀，甲醇鈉等。

溶媒可爲水或醇系溶媒，例如甲醇，乙醇，丙醇，丁醇等單獨使用或醚系溶媒爲宜。例如可在二乙醚，四氫呋喃，１，２－二甲氧基乙烷，１，４－二噁烷，二乙二醇二甲醚系之混合溶媒系下進行反應。

烷基化劑可爲如Ｉ（步驟３）中所述，使用對應於側鏈之烷基化劑。

反應溫度係通常在－４０～１００℃進行，較佳係０～５０℃，較佳在室溫進行。

（步驟５´）脫保護

依常法，自化合物（Ｊ）除去保護基，得化合物（Ｋ）。

試藥可用鹽酸，硫酸，乙酸，酸性離子交換樹脂，氟化四丁基銨，氟化氫／吡啶，氟化氫／三乙胺，氟化氫酸，較佳係用酸性離子交換樹脂，氟化四丁基銨。

溶媒係通常可用醚系溶媒，較佳係四氫呋喃。反應溫度係因基質而不同，通常於室溫～６５℃範圍進行爲宜。

（步驟６）光反應・熱異構化

依常法進行化合物（Ｋ）之光反應・熱異構化得化合

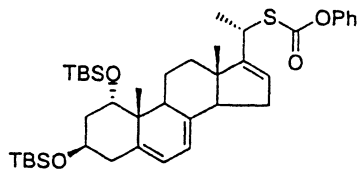
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

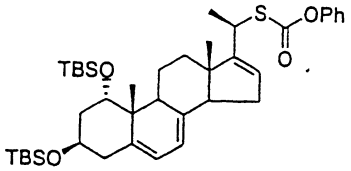
五、發明說明（73）

物（L）。

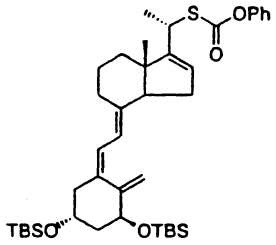
又，進行步驟3′，4′，5′時未必按其順序並不予限定，惟不會有步驟4′，5′較步驟3′先施行情形。

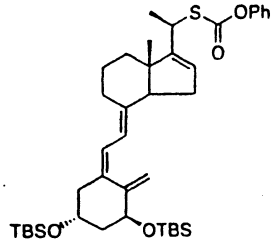
又，可以例如使用如下化合物（特開平10－231284中記載）做爲式（I）所示化合物，施行自步驟4′之處理。





且，例如如下述化合物（特開平10－231284所記載）作爲一般式（I）所表示的化合物使用，可由步驟4'進行處理亦可，此狀況下，可省略步驟6'。





上述之I及II之各合成步驟中，各中間體及最後物質可以用矽膠管柱層析，薄層層析，再結晶等一般之手法進行精製，單離。

依本發明時可以有利地製造在製造本發明式（1）所示維他命D衍生物中可做爲中間體體使用的式（3）所示化合物。

自上述式（2）所示化合物製造式（3）所示化合物時，以往係做爲反應試藥用四甲基錫或二甲基鋅。惟使用

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（74）

前者時，因反應性不足所以極易同時進行副反應，且試藥之毒性高，所以極需加以改善。又，使用後者時反應性高，但卻使副反應優先進行，亦希望有所改善。

依本發明使用有機鋁試藥時幾乎不會引起副反應，還可高選擇性地進行目的之反應，提高反應物之收率。另外，使用之試藥的毒性低。因此與以往方法相比，可以有利地製造式（3）所示化合物。爲此將上述有利之處適用於式（1）所示化合物之製造步驟中時，可以連帶地提高式（1）所示化合物之收率，降低所用試藥之毒性等，與以往之方法相比顯然可以更有利地製造式（1）所示化合物。

式（2）中，R_{12}及R_{13}所示保護基係例如乙醯基，第三丁基二甲基矽烷基等。R_{14}所示脫離基可爲例如溴原子，碘原子，三氟甲磺氧基，九氟丁磺氧基等。又，式（2）所示化合物可依後述之實施例24所示方法等得到。

在N，N－二甲基甲醯胺，二甲亞碸，N，N－二甲基乙醯胺，1，3－二甲基－2－咪唑啶酮，四氫呋喃，甲苯等有機溶媒中，於式（4）所示有機鋁試藥及鈀觸媒存在下，以一氧化碳使該式（2）所示化合物進行羰基化反應，即可有利地製得目的之式（3）所示化合物。

有機鋁試藥可爲例如氯化二甲基鋁，氯化二乙基鋁，氯化二正丙基鋁，氯化二正丁基鋁，氯化二苯基鋁等。

鈀觸媒係四（三苯膦）鈀，二氯雙（三苯膦）鈀，二氯〔1，3－雙（三苯膦基）丙烷〕鈀，二氯〔1，2－

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（75）

雙（三苯膦基）乙烷〕鈀，雙（二苯亞甲基丙酮）鈀，三（二苯亞甲基丙酮）二鈀等。

本發明中係爲得更高觸媒活性，或爲得更高之反應選擇性，亦可視其需要併用三苯膦，三丁基膦，三環己膦，三第三丁膦等配位鋅。

羰基化反應係在０～１５０℃溫度，一氧化碳氣氛下，常壓至加壓（２０氣壓左右爲止），反應１０分鐘～１２小時。

如此所得式（３）所示化合物係在合成本發明之式（１）所示維他命Ｄ衍生物時做爲中間體使用。

即，自式（３）所示化合物，可依後述實施例２５所記載方法製得式（１）所示化合物。

式（３）中，R_{12}反R_{13}係與式（２）之定義相同。R_{15}係示甲基，乙基，丙基，丁基等烷基，苯基等芳基，乙烯基等烯基或乙炔基等炔基。

含有本發明維他命Ｄ衍生物之醫藥組成物可以使用製藥上可被容許之載體，賦形劑，散解劑，滑澤劑，結合劑，香料，著色劑等，製劑爲所希望之劑型，例如錠劑，顆粒劑，細粒劑，膠囊劑，粉劑，注射劑，溶液劑，懸濁劑，乳劑，經皮吸收劑，栓劑等使用。

使用本發明之維他命Ｄ衍生物做爲有效成份之皮膚疾病治療藥做爲乾癬治療劑等時的劑型可爲軟膏，乳霜，生髮水等外用劑。

以本發明之維他命Ｄ衍生物爲有效成份之治療藥，其

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（76）

投予量係視對象疾病，病人狀態，體型，體質，年齡，性別，或投予徑路，劑型等適當選擇，通常，經口投予時係做爲有效成份1日0.001μg～100000μg，較佳係0.01μg～1000μg範圍，做爲注射劑時係每日0.01μg～100000μg，較佳爲0.1μg～1000μg範圍，又，外用劑時係做爲有效成份1日1μg～5），000μg，較佳係10μg～5000μg範圍中選擇，每天1～3次分開使用。

做爲乾癬治療劑使用本發明之維他命D衍生物，做爲有效成份之皮膚疾病治療藥時，其投予方法係以外用劑等局部投予爲宜，有時視其需要亦可全身投予經口劑或注射劑。

以下藉由實施例更具體說明本發明，惟本發明並不受此等所限定。本實施例中NMR譜係以四甲基矽烷或氯仿做爲內標準，除有特別記載以外，通常以CDCl$_3$爲溶媒。質譜（MS）係以EI模式，離子化電壓70eV測定。紫外吸收光譜（UV）係在乙醇溶媒中測定。管柱層析係用矽膠（75～150μm或40～63μm），又，分取用薄層層析係用矽膠（厚1mm，0.5m或0.25mm，均爲20×20cm）。

（實施例1）

製造17－乙醯基硫甲基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）雄甾－5，7，16－三烯

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（77）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１７－（２，４，６－三異丙基苯碸基亞胂基）雄甾－５，７－二烯

溶解１．６４ｇ（３．０８毫莫爾）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１７－氧代雄甾－５，７－二烯及１．０１ｇ（３．３９毫莫爾）２，４，６－三異丙基苯碸基醯胂於６ｍｌ乙酸，於室溫攪拌１６小時。減壓下餾去溶媒後，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝１５：１）精製，得１．８６ｇ（７５％）標題化合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：７．１５（ｓ，２Ｈ），
６．９８（ｂｒｓ，１Ｈ），
５．５８（ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ，１Ｈ），
５．４０－５．３３（ｍ，１Ｈ），
４．２８－４．２０（ｍ，２Ｈ），
４．１８－３．９３（ｍ，１Ｈ），
３．７０－３．６３（ｍ，１Ｈ），
２．９５－２．７４（ｍ，２Ｈ），
１．３０－１．２２（ｍ，２４Ｈ），
０．８８（ｓ，９Ｈ），０．８５（ｓ，９Ｈ），
０．６８（ｓ，３Ｈ），０．０９（ｓ，３Ｈ），
０．０６（ｓ，３Ｈ），０．０４（ｓ，３Ｈ），
０．０３（ｓ，３Ｈ）．
ＩＲ（ＫＢｒ）：３２３２，２９５６，２８６０，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（78）

1600，1462，1426，1384，1372，1362，1328，1254，1214，1194，1166，1154，1102，1038，1006，968，952，938，928，916，878，834，774，716，666，548cm^{-1}。

（2）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（羥甲基）雄甾－5，7，16－三烯

將32.7mg（0.0403毫莫爾）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（2，4，6－三異丙基苯磺基亞肼基）雄甾－5，7－二烯之0.8ml己烷，0.16ml四甲基乙二胺溶液冷卻爲－78℃，加入0.106ml（0.161毫莫爾）1.53M正丁基鋰。於－78℃攪拌2小時後昇溫至0℃，攪拌15分鐘後，加入10mg（0.33毫莫爾）多聚甲醛，於0℃攪拌1小時，於室溫攪拌1小時。反應液中加入食鹽水，以二氯甲烷萃取，以無水硫酸鈉乾燥後，餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝6：1）精製，得13.6mg（62%）標題化合物。

（3）製造17－乙醯基硫甲基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）雄甾－5，7，16－三烯

在4.00g（7.34毫莫爾）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（羥甲基）雄甾－5

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（79）

，7，16－三烯之70ml四氫呋喃溶液中加入4.10ml（29.4毫莫爾）三乙胺，再於－10℃滴入1.70ml（22.0毫莫爾）甲磺基氯，攪拌20分鐘。將反應液昇溫至室溫後，加入3.73g（29.4毫莫爾）硫代乙酸鉀之70ml二甲亞碸溶液。攪拌30分鐘後以己烷稀釋，以水洗淨後，以無水硫酸鎂乾燥。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以矽膠管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝15：1）精製，得3.91g（88%）無色油狀之標題化合物。

IR（neat）：2954，2929，2897，2856，1695，1471，1462，1371，1360，1254，1099cm^{-1}.

^1H NMRδ：0.05（s，1H），0.07（s，3H），0.07（s，3H），0.11（s，3H），0.82（s，3H），0.88（s，18H），0.94（s，3H），2.34（s，3H），2.79－2.90（m，1H），3.52－3.68（m，2H），3.68－3.73（（m，1H），3.98－4.12（（m，1H），5.35－5.41（m，1H），5.57－5.64（m，2H）.

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（80）

ＭＳ　ｍ／ｚ：６０２（Ｍ⁺），４１３（１００％）．

ＵＶ　λ_{max} ｎｍ：２３４，２６１，２７１，２８１，２９４。

（實施例２）

代替實施例１（１）～（２）之步驟，進行以下（１）～（２）步驟。

（１）製造１β，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）雄甾－５，７－二烯－（１７Ｓ）－螺－２´－環氧乙烷

在１３ｍｌ二甲亞碸中加入０．２８２１ｇ（７．０６毫莫爾）油性，６０％氫化鈉，於８０℃攪拌１小時。所得懸濁液冷卻爲０℃後，以１９ｍｌ四氫呋喃稀釋，滴下１．３３ｇ（６．５０毫莫爾）碘化三甲基銃之９ｍｌ二甲亞碸溶液，於０℃攪拌３５分鐘。繼而加入１．０ｇ（１．８８毫莫爾）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１７－氧雜雄甾－５，７－二烯之７ｍｌ四氫呋喃溶液，於室溫攪拌１４小時。將反應混合物倒入飽和氨化銨水溶液中後，以乙酸乙酯萃取，以水，飽和食鹽水洗淨萃取物，以無水硫酸鈉乾燥。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝６：１）精製，得０．９３ｇ（９１％）白色泡沫狀標題化合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．０５（ｓ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（81）

0.06（s，3H），0.07（s，3H），
0.11（s，3H），0.88（s，3H），
0.89（s，3H），
2.65（d，J＝4.9Hz，1H），
2.93（d，J＝4.9Hz，1H），
3.71（brs，1H），
3.98－4.12（m，1H），
5.35－5.43（m，1H），
5.57－5.64（m，1H）。

（2）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（羥甲基）雄甾－5，7，16－三烯

氬氣氛下，在20g（36.7毫莫爾）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）雄甾－5，7－二烯－（17S）－螺－2´－環氧乙烷之130ml 1，2－二氯苯溶液中，加入22g（108毫莫爾）異丙醇鋁，於130℃攪拌1.5小時後，加入羅謝爾鹽（Rochelle salt）水溶液，以乙酸乙酯萃取（二次），以水洗淨後，以無水硫酸鈉乾燥。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝6：1）精製，得10g（50%）白色固體之標記化合物。

IR（neat）：3392，2954，2929，2856，1462，1254，1097，1082

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（82）

cm^{-1}.

^1H NMR δ：：0.05（s，3H），
0.07（s，6H），0.11（s，3H），
0.88（s，3H），0.89（s，3H），
3.71（brs，1H），
4.00（brs，1H），
4.22（s，2H），
5.40（brs，1H），
5.57－5.66（m，2H）.
MS m／z：544（M^+），355（100%）.
UV λ_{max} nm：27），281，293。

（實施例3）

製造17－乙醯基甲硫基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）雄甾－5，7，16－三烯

繼實施例1（1）～（2）步驟之後，代替（3）施行以下步驟。

在100mg（0.18毫莫爾）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（羥甲基）雄甾－5，7，16－三烯，96.0mg（0.366毫莫爾）三苯膦，49.8mg（0.732毫莫爾）咪唑之2ml二氯甲烷溶液中，於0℃加入65.1mg（0.366毫莫爾）N－溴化琥珀醯亞胺，於室溫攪拌，1小時後加入己烷，繼而以水，飽和食鹽水洗淨。以無水

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（83）

硫酸鎂乾燥後，減壓下餾去溶媒，得１５０ｍｇ含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１７－（溴甲基）雄甾－５，７，１６－三烯之混合物。將其溶解於１．５ｍｌ丙酮，加入３１．４ｍｇ（０．２７５毫莫爾）硫代乙酸鉀，攪拌３０分鐘。以己烷稀釋反應液後經過濾，減壓下自所得濾液餾去溶媒，殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝２０：１，展開一次）精製，得７０．２ｍｇ（６４％）無色油狀之標記化合物。

（實施例４）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（Ｎ，Ｎ－二甲胺羰基乙氧基）孕甾－５，７，１６－三烯

在４００ｍｇ（０．７２毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－羥基孕甾－５，７，１６－三烯之７．２ｍｌ四氫呋喃溶液中，加入４６ｇ（１．１５毫莫耳）油性，６０％氫化鈉，氮氣流下於室溫攪拌３０分鐘，再加入３０８ｍｇ（３．１１毫莫耳Ｎ，Ｎ－二甲基丙烯醯胺，於同溫度攪拌３小時。反應溶液倒入飽和氯化銨水溶液，以乙酸乙酯萃取後（三次），以飽和食鹽水洗淨，有機層以無水硫酸鎂乾燥。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝２：１）精製，得４５９ｍｇ（９６．９％）無色油狀標記

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（84）

化合物。

IR（neat）：2954，2929，2895，2856，1655，1462，1389，1371，1254，1149，1097 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.05（s，3H），0.06（s，6H），0.11（s，3H），0.88（s，21H），0.94（s，3H），1.30（d，J＝6.6Hz，3H），2.60（t，J＝6.9Hz，2H），2.78－2.90（m，1H），2.94（s，3H），3.02（s，3H），3.57－3.80（m，3H），3.90－4.11（m，2H），5.35－5.43（m，1H），5.57－5.64（m，2H）.

MS m／z：540（M^+-$HO(CH_2)_2CONMe_2$），73（100%）.

UV λ_{max} nm：271，282，294。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（N，N－二甲胺羰基乙氧基）孕甾－5，7，16－三烯

在100mg（0.15毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（N，N－二

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（85）

甲胺羰基乙氧基）孕甾－5，7，16－三烯之6．0ml四氫呋喃溶液中加入1．5ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，氮氣流下於50℃攪拌1小時。冷卻反應液爲室溫後，以乙酸乙酯稀釋，依序以0．5N鹽酸，飽和碳酸氫鈉水溶液，飽和食鹽水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（1．0mm×2枚，氯仿：甲醇＝10：1）精製，得45mg（70．3%）無色泡沫狀之標記化合物。

IR（neat）：3359，2970，2935，2918，2873，2837，1624，1417，1361，1257，1196，1151，1097，1053cm^{-1}．

^1H　NMRδ：0．87（s，3H），
0．97（s，3H），
1．29（d，J＝6．3Hz，3H），
2．59（t，J＝6．9Hz，2H），
2．73－2．85（m，1H），
2．93（s，3H），
3．02（s，3H），
3．53－3．66（m，1H），
3．69－3．81（m，2H），
3．92－4．13（m，2H），
5．40－5．48（m，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（86）

5．60（brs，1H），
5．70－5．76（m，1H）．
MS　m／z：312（M^+-$HO(CH_2)_2CONMe_2$），72（100%）．
UV　λ_{max}　nm：271，282，293。

（3）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（N，N－二甲胺羰基乙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

溶解60mg（0．14毫莫耳）1α，3β－二羥基－20（S）－（N，N－二甲胺羰基乙氧基）孕甾－5，7，16－三烯於200ml乙醇中。於0℃所得溶液攪拌下，一邊使氬起泡，一邊藉由400W高壓水銀燈高硼矽酸濾透過光照射5分鐘後，加熱回流2小時。冷卻爲室溫後減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（0．5mm×3枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1，展開三次，再以0．5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝3：7：0．5，展開三次，再以0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝2：8：0．5，展開三次）精製，得5．333mg（8．9%）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3400，2930，2848，1633，1628，1103，1055cm^{-1}．
^1H　NMRδ：0．77（s，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（87）

1．29（d，J＝6．6Hz，3H），
2．59（t，J＝6．9Hz，2H），
2．74－2．86（m，1H），
2．93（s，3H），
3．02（s，3H），
3．52－3．65（m，1H），
3．68－3．80（m，1H），
3．94（q，J＝6．6Hz，1H），
4．17－4．29（m，1H），
4．39－4．48（m，1H），
5．01（brs，1H），
5．33（brs，1H），
5．57（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．37（d，J＝11．2Hz，1H）．
MS　m／z：429（M^+），118（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例5）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（R）－（N，N－二甲胺基羰基乙氧基）孕甾－5，7，16－三烯

以實施例4（1）一樣之操作，使316mg（0．57毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（88）

氧基）－20（R）－羥基孕甾5，7，16－三烯，175mg（1.77毫莫耳）N，N－二甲基丙烯醯胺，36mg（0.91毫莫耳）油性，60%氫化鈉，5.7ml四氫呋喃反應（0℃，1.5小時，再於室溫，1.5小時），進行後處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝2：1）精製，得352mg（93.9%）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3280，2954，2929，2885，2856，1628，1464，1402，1373，1255，1097 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.05（s，3H），0.07（s，6H），0.11（s，3H），0.83（s，3H），0.88（s，18H），0.94（s，3H），1.32（d，J＝63Hz，3H），2.63（t，J＝6.9Hz，2H），2.79－2.90（m，1H），2.94（s，3H），3.01（s，3H），3.66－3.79（m，3H），3.96－4.09（m，2H），5.34－5.42（m，1H），5.56－5.66（m，2H）.

MS m／z：540（M^+－HO（CH_2）$_2$CONM

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（89）

e$_2$），７３（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２７１，２８２，２９４。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｒ）－（Ｎ，Ｎ－二甲胺基羰基乙氧基）孕甾－５，７，１６－三烯

與實施例４（２）一樣之操作，使１００ｍｇ（０．１５毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｒ）－（Ｎ，Ｎ－二甲胺基羰基乙氧基）孕甾－５，７，１６－三烯，１．５ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，６．０ｍｌ，四氫呋喃反應（室溫下３０分鐘，再於５０℃　１．５小時），進行後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，氯仿：甲醇＝１０：１）精製，５２ｍｇ（８３．０％）無色泡沫狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，２９６２，２９３３，２８７５，１６２４，１４５６，１３９８，１３７３，１２６７，１１５７，１０９７，１０５７ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．８４（ｓ，３Ｈ），

０．９８（ｓ，３Ｈ），

１．３２（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），

２．６０（ｔ，Ｊ＝７．３Ｈｚ，２Ｈ），

２．７３－２．８５（ｍ，１Ｈ），

２．９４（ｓ，３Ｈ），３．０１（ｓ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（90）

3．72（t，J＝7．3Hz，2H），
3．78（brs，1H），
3．97－4．13（m，2H），
5．42－5．49（m，1H），
5．65（brs，1H），
5．72－5．78（m，1H）．
MS　m／z：312（M^+-$HO(CH_2)_2CONMe_2$），72（100%）．
UV　λ_{max}　nm：271，281，293。

（3）製造1α，3β－二羥基－20（R）－（N，N－二甲胺基羰基乙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（3）一樣之操作，使50mg（0．12毫莫耳）1α，3β－二羥基－20（R）－（N，N－二甲胺基羰基乙氧基）孕甾－5，7，16－三烯，200ml乙醇進行反應後（光照射4分45秒，加熱回流2小時），以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1，展開三次，再以0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝2：8：0．5，展開三次）精製，得3．427mg（6．9%）色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3400，2929，1633，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（91）

1055cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.73（s，3H），
1.31（d，J＝6.6Hz，3H），
2.59（t，J＝7.3Hz，2H），
2.75－2.85（m，1H），
2.94（s，3H），3.02（s，3H），
3.72（t，J＝7.3Hz，2H），
3.99（q，J＝6.6Hz，1H），
4.18－4.30（m，1H），
4.39－4.49（m，1H），
5.01（brs，1H），
5.33（brs，1H），
5.60（brs，1H），
6.10（d，J＝11.6Hz，1H），
6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：429（M$^+$），72（100%）.

UV λ_{max} nm：265。

（實施例6）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（N，N－二甲胺基羰基乙氧甲基）雄甾－5，7，16－三烯

與實施例4（1）一樣操作，使951mg（1.75毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（92）

氧基）－17－（羥甲基）雄甾－5，7，16－三烯，540mg（5.44毫莫耳）N，N－二甲基丙烯醯胺，105mg（2.62毫莫耳）油性，60%氫化鈉，17.5ml四氫呋喃進行反應（5℃，14小時），進行後處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝2：1）精製，得1.05g（92.7%）黃色油狀標記化合物。

IR（neat）：2954，2929，2895，2856，1653，1462，1398，1371，1254，1097，1074 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.05（s，3H），0.06（m，6H），0.11（s，3H），0.82（s，3H），0.877（s，9H），0.881（s，9H），0.94（s，3H），2.62（t，J＝6.6Hz，2H），2.80－2.90（m，1H），2.94（s，3H），3.02（s，3H），3.70（brs，1H），3.76（t，J＝6.6Hz，2H），3.96－4.12（m，4H），5.34－5.42（m，1H），5.55－5.67（m，2H）.

MS m／z：644（M^+－1），73（100%）.

UV λ_{max} nm：271，281，293。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（93）

（２）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽氧烷基）－１７－（Ｎ，Ｎ－二甲胺基羰基乙氧甲基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例４（３）一樣操作，使３００ｍｇ（０．４７毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽氧烷基）－１７－（Ｎ，Ｎ－二甲胺基羰基乙氧甲基）雄甾－５，７，１６－三烯，３５０ｍｌ乙醇進行反應（光照射１３分３０秒，加熱回流２小時），減壓下餾去溶媒，得３００ｍｇ含目的物之黃色油狀化合物。

（３）製造１α，３β－二羥基－１７－（Ｎ，Ｎ－二甲胺基羰基乙氧甲基）９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

在３００ｍｇ實施例６（２）所得化合物之３０ｍｌ四氫呋喃，３０ｍｌ甲醇溶液中，加入１１．１ｇ Amberdist １５，遮光氮氣流下於室溫攪拌４小時。以矽藻土（celite）過濾不溶物，以甲醇洗淨。在此濾液中加入碳酸氫鈉，攪拌５分鐘，再次過濾。減壓下濃縮滴液，所得殘渣以分取用薄層層析（１．０ｍｍ×３枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開三次，再以０．５ｍｍ×３枚，己烷：乙酸乙酯＝２：８：０．５，展開三次）精製，得１０．２８２ｍｇ（５．５％）無色油狀標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（94）

IR（neat）：3400，2929，2875，2850，1633，1500，1402，1159，1059cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.72（s，3H），2.62（t，J＝6.6Hz，2H），2.54－2.66（m，1H），2.75－2.86（m，1H），2.94（s，3H），3.02（s，3H），3.68－3.78（m，2H），3.96－4.09（m，2H），4.18－4.29（m，1H），4.39－4.48（m，1H），5.00（brs，1H），5.33（brs，1H），5.60（brs，1H），6.09（d，J＝11.6Hz，1H），6.36（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：298(M^+-HO$(CH_2)_2$CONMe_2)，72（100%）.

UV λ_{max} nm：264。

（實施例7）

製造1α，3β－二羥基－20（S）－（N，N－二甲胺基羰基乙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（95）

（１９）－三烯

與實施例４（３）一樣操作，使２２０ｍｇ（０．３３毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽氧烷基）－２０（Ｓ）－（Ｎ，Ｎ－二甲胺基羰基乙氧基）孕甾－５，７－二烯，２０ｍｌ乙醇進行反應（光照射１２分鐘，加熱回流２小時），減壓下餾去溶媒。使２１０ｍｇ所得殘渣，與２０ｍｌ四氫呋喃，２０ｍｌ甲醇，７．４ｇ Amberlist １５，與實施例６（３）一樣之操作進行反應（室溫５小時），進行後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×７枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１展開三次，再以０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝２：８：０．５，展開三次，再以０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開二次）精製，得７．２０２ｍｇ（５．１％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４００，２９２７，２８７３，１６３３，１６２８，１４４６，１４１７，１１４９，１０９５，１０５９ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ ＮＭＲδ：０．５１（ｓ，３Ｈ），１．１６（ｄ，Ｊ＝５．９Ｈｚ，３Ｈ），２．７５－２．８８（ｍ，１Ｈ），２．９３（ｓ，３Ｈ），３．０２（ｓ，３Ｈ），３．２０－３．３３（ｍ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（96）

3．51－3．63（m，1H），
3．80－3．92（m，1H），
4．17－4．27（m，1H），
4．39－4．47（m，1H），
4．99（brs，1H），
5．32（brs，1H），
6．02（d，J＝11．2Hz，1H），
6．36（d，J＝11．2Hz，1H）．
MS　m／z：296(M^+-HO$(CH_2)_2$CONMe_2-H_2O)，72（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例8）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽氧烷基）－20（S）－（第三丁氧羰甲氧基）孕甾－5，7，16－三烯

在外溫72℃條件下攪拌55．5mg（0．0993毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽氧烷基）－20（S）－羥基孕甾－5，7，16－三烯，15mg（0．594毫莫耳，95%）氫化鈉，15mg（0．0681毫莫耳）15－冠－5－醚之1ml四氫呋喃溶液經1小時後，於室溫加入0．05ml（0．336毫莫耳）溴代乙酸第三丁酯，於外溫72℃條件下攪拌5小時15分鐘。以乙酸乙酯稀釋反應液後，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（97）

冰冷下滴入水，以飽和食鹽水洗淨後，以無水硫酸鎂乾燥有機層，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝10：1，展開1次）精製得55.1mg（82%）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：2928，2856，1748，1088，832 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.05（s，3H），0.06（s，6H），0.10（s，3H），0.86（s，3H），0.88（s，18H），0.94（s，3H），1.36（d，J＝6.3Hz，3H），1.46（s，9H），2.79－2.91（m，1H），3.69（brs，1H），3.82（d，J＝16.5Hz，1H），3.94（d，J＝16.5Hz，1H），3.98－4.15（m，2H），4.09（q，J＝6.3Hz，1H），5.35－5.43（m，1H），5.57－5.66（m，2H）.

UV λ_{max} nm：271，282，294。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（98）

（2）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽氧烷基）－20（S）－（第三丁氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（3）一樣操作，使52.2mg（0.0775毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基矽烷氧基）－20（S）－（N，N－二甲胺基羰基甲氧基）孕甾－5，7，16－三烯及200ml乙醇進行反應（光照射4分20秒，加熱回流2小時）後，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝20；1，展開二次）精製，得16.6mg含標記化合物之混合物。

（3）製造20（S）－（第三丁氧羰基甲氧基）－1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

在16.6mg實施例8（2）所得混合物的2.5ml四氫呋喃溶液中加入1ml　70%氟化氫－吡啶，於室溫攪拌30分鐘。以乙酸乙酯稀釋反應溶液，依序以水2次，以飽碳酸氫鈉水溶液3次，飽和食鹽水一次洗淨，以無水硫酸鎂乾燥，減壓下除去溶媒。所得殘渣以分取用薄層層析（0.25mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1展開3次再以0.25mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1，展開5次，再以0.25mm×1枚，二氯甲烷：乙酸乙酯＝3：1，展開3次）精製，得1.77mg（5%）無色油狀標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（99）

IR（neat）：3400，2976，2932，1746，1122 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.77（s，3H），1.36（d，J＝6.4Hz，3H），1.47（s，9H），2.37－2.47（m，1H），2.55－2.66（m，1H），2.76－2.89（m，1H），3.81（d，J＝16.3Hz，1H），3.94（d，J＝16.3Hz，1H），4.07（q，J＝6.4Hz，1H），4.19－4.31（m，1H），4.41－4.50（m，1H），5.01（s，1H），5.34（s，1H），5.60（brs，1H），6.11（d，J＝11.4Hz，1H），6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2C(CH_3)_3$)，57（100%）.

UV λ_{max} nm：263。

（實施例9）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（100）

－２０（Ｒ）－（第三丁氧羰基甲氧基）孕甾－５，７，１６－三烯

與實施例８（１）一樣操作，使１５８ｍｇ（０．２８３毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁氧二甲基矽烷氧基）－２０（Ｒ）－羥基孕甾－５，７，１６－三烯，７７ｍｇ（１．９２５毫莫耳）油性，６０％氫化鈉，６ｍｌ四氫呋喃，６７ｍｇ（０．３０４毫莫耳）１５－冠－５－醚及０．２５ｍｌ（１．６７９毫莫耳）溴代乙酸第三丁酯反應（外溫８５℃，１１小時４０分）經後處理，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝１０：１）以及以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×３枚，己烷：乙酸乙酯＝２０：１，展開２次）精製得１４２．６ｍｇ（７５％）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：２９３２，２８５６，１７４８，１１０），８３４ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．０５（ｓ，３Ｈ），
０．０７（ｓ，６Ｈ），０．１１（ｓ，３Ｈ），
０．８５（ｓ，３Ｈ），０．８８（ｓ，１８Ｈ），
０．９４（ｓ，３Ｈ），
１．３７（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），
１．４７（ｓ，９Ｈ），
２．７８－２．９１（ｍ，１Ｈ），
３．７０（ｂｒｓ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（101）

3．86（d，J＝16．4Hz，1H），
3．96（d，J＝16．4Hz，1H），
3．98－4．13（m，1H），
4．15（q，J＝6．6Hz，1H），
5．35－5．46（m，1H），
5．61（d，J＝5．4Hz，1H），
5．66（brs，1H）．
UV λ_{max} nm：271，282，294。

（2）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（R）－（第三丁氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（3）一樣操作，使108．3mg（0．161毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基矽烷氧基）－20（R）－（第三丁氧羰基甲氧基）孕甾－5，7，16－三烯，200ml乙醇進行反應（光照射6．5分，加熱回流1．5小時）後，以分取用薄層層析（0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝20；1，展開2次）精製，得25．6mg，含標記化合物之混合物。

（3）製造20（R）－（第三丁氧羰基甲氧基）－1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（2）一樣操作，使25．6mg實施例

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（102）

9（2）所得混合物，2.5ml四氫呋喃，0.35ml（0.35毫莫耳）1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液行反應（外溫47.5℃，4小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝15：1展開4次，再以0.25mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1，展開3次，再以0.25mm×1枚，二氯甲烷：乙酸乙酯＝3：1，展開3次）精製，得3.169mg（4%二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3400，2932，1744，1162，1124，1056，732cm^{-1}.

^{1}H NMR δ：0.76（s，3H），
1.37（d，J＝6.4Hz，3H），
1.47（s，9H），
2.41－2.54（m，1H），
2.54－2.69（m，1H），
2.76－2.91（m，1H），
3.85（d，J＝16.3Hz，1H），
3.95（d，J＝16.3Hz，1H），
4.12（q，J＝6.6Hz，1H），
4.17－4.31（m，1H），
4.39－4.52（m，1H），
5.01（s，1H），5.34（s，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（103）

5.64（brs，1H），
6.10（d，J＝11.3Hz，1H），
6.37（d，J＝11.3Hz，1H）.
MS m／z：312(M^+-$HOCH_2C(O)OC(CH_3)_3$)，57（100%）.
UV λ_{max} nm：263。

實施例10

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（第三丁氧羰基甲氧基甲基）雄甾－5，7，16－三烯

於外溫88℃條件下攪拌1小時15分鐘1.0g（1.84毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（羥甲基）雄甾－5，7，16－三烯，220mg（5.50毫莫耳）油性，60%氫化鈉，400mg（1.82毫莫耳）15－冠－5－醚，0.55ml（3.69毫莫耳）溴代乙酸第三丁酯。以乙酸乙酯稀釋反應溶液後，以矽藻土過濾，冰冷下滴水於濾液以飽和食鹽水洗淨後，有機層以無水硫酸鎂乾燥後，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝20：1）精製，得946.6mg（78%）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：2952，2928，2892，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

六、申請專利範圍4

2856，1748，1460，1370，1252，1098，968，834，774 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.05（s，3H），0.06（s，6H），0.11（s，3H），0.84（s，3H），0.88（s，18H），0.94（s，3H），1.48（s，9H），2.79－2.92（m，1H），3.70（brs，1H），3.95（s，2H），4.13（s，2H），3.97－4.20（m，1H），5.35－5.43（m，1H），5.60（d，J＝5.4Hz，1H），5.69（s，1H）.

MS m／z：526(M^+-$HOCH_2C(O)OC(CH_3)_3$)，57（100%）.

UV λ_{max} nm：271，281，294。

（2）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（第三丁氧羰基甲氧基甲基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（3）一樣操作，使168mg（0.255毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－（第三丁氧羰基甲氧基甲基）雄甾－5

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（105)

，７，１６－三烯，及２００ｍｌ乙醇進行反應（光照射１０分種，加熱回流１．５小時）後，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×３枚，己烷：乙酸乙酯＝１５：１，展開２次）精製，得３５．８ｍｇ含標記化合物之混合物。

（３）製造１α，３β－二羥基－１７－（第三丁氧羰基甲氧基甲基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例４（２）一樣操作，使３５．８ｍｇ實施例１０（１）所得混合物，１ｍｌ四氫呋喃，０．３５ｍｌ（０．３５毫莫耳）１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫４５℃，２小時），經後處理，所得殘渣之分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝１５：１，展開１次，再以０．２５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１，展開３次，再以０．２５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１展開２次，再以０．２５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙酸乙酯＝３：１，展開２次）精製，得０．６４９ｍｇ（０．６％，２步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３５２，２９２８，１７４４，１４５２，１３６８，１２２６，１１６２，１１３０，１０５６ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７４（ｓ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（106）

1．48（s，9H），
2．53－2．67（m，1H），
2．75－2．89（m，1H），
3．95（s，2H），
4．12（brs，2H），
4．17－4．30（m，1H），
4．39－4．50（m，1H），
5．01（s，1H），5．33（s，1H），
5．65（s，1H），
6．09（d，J＝11．5Hz，1H），
6．37（d，J＝11．5Hz，1H）．
MS　m／z：430（M^+），
57（100%）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例11）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（3）一樣操作，使1．0mg（1．79毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－羥基孕甾－5，7，16－三烯，270ml乙醇進行反應（光照射1小時，加熱回流2小時）後，以管柱層析（己烷：二氯甲烷：乙酸乙酯＝9：

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（107）

1：

0．5）分離，得250mg含目的物之無色泡沫狀餾份。

（2）製造製造1α，3β－二羥基－20（S）－（第三丁氧羰基乙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（1）一樣之條件使40mg實施例11（1）所得含1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之餾份，4．5mg（0．11毫莫耳）油性，60%氫化鈉1，0．7ml四氫呋喃，55mg（0．43毫莫耳）丙烯酸第三丁酯反應，經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×3枚，己烷：二氯甲烷：乙醇＝9：1：0．5）分離，得42mg含目的物之無色油狀餾份。與實施例4（2）一樣，使42mg此餾份，2．4ml四氫呋喃，0．6ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（1．5小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1展開2次，再以0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1展開4次，再以0．5mm×1枚，二氯甲烷：乙酸乙酯＝1：3展開4次）精製，得3．276mg（1．22%3步驟）無色油狀標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（108）

IR（neat）：3383，2976，2931，2869，2850，1732，1448，1367，1255，1159，1105，1054 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.78（s，3H），1.28（d，J＝6.6Hz，3H），1.45（s，9H），2.46（t，J＝6.6Hz，2H），2.56－2.65（m，1H），2.76－2.87（m，1H），3.45－3.57（m，1H），3.60－3.72（m，1H），3.92（q，J＝6.6Hz，1H），4.18－4.31（m，1H），4.39－4.50（m，1H），5.01（brs，1H），5.34（brs，1H），5.57（brs，1H），6.10（d，J＝11.2Hz，1H），6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：458（M^+），57（100%）.

UV λ_{max} nm：263。

（實施例2）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（109）

製造1α，3β－二羥基－20（R）－（N，N－二甲胺基羰基乙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯

與實施例4（3）一樣操作，使100mg（0.18毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（R）－羥基孕甾－5，7－二烯，200ml乙醇進行反應（光照射5分45秒，加熱回流2小時）後，以分取用薄層層析（0.5mm×3枚，己烷：乙酸乙酯＝5：1）分離，得18mg含目的物之黃色油狀餾份。再以實施例4（1）一樣之操作使其與9.8mg（0.099毫莫耳）N，N－二甲基丙烯醯胺，2mg（0.047毫莫耳）油性，60%氫化鈉，0.32ml四氫呋喃反應（0℃，2小時，再於室溫24小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，乙酸乙酯）分離，得11mg含目的物之無色油狀餾份。與實施例6（3）一樣之操作，使此11mg餾份，2ml四氫呋喃，2ml甲醇，1.3g Amberlist 15反應（室溫，5小時）經後處理，以分取用薄層層析（0.25mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝10：1展開3次，再以0.25mm×1枚，甲苯：乙酸乙酯＝1：9展開5次）得1.261mg（1.62%）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3429，2925，2871，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明(110)

1628，1103，1057cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.55（s，3H），

1.09（t，J＝5.9Hz，3H），

2.78－2.89（m，1H），

2.93（s，3H），

3.02（s，3H），

3.25－3.37（m，1H），

3.54－3.66（m，1H），

3.79－3.90（m，1H），

4.16－4.29（m，1H），

4.38－4.48（m，1H），

5.00（brs，1H），

5.32（brs，1H），

5.99（d，J＝11.2Hz，1H），

6.38（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：431（M^{+}），118（100%）.

UV λ_{max} nm：264。

（實施例13）

製造1α，3β－二羥基－20（S）－（N－第三丁基－N－甲胺羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例8（1）一樣之操作，使100mg含實施例11（1）所得1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明 (111)

氧基）－２０（Ｓ）－羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之餾份，８６ｍｇ（２．１４毫莫耳）油性，６０％氫化鈉，４．８ｍｌ四氫呋喃，８０ｍｇ（０．３６毫莫耳）１５－冠－５－醚，４４６ｍｇ（２．１４毫莫耳）Ｎ－第三丁基－Ｎ－甲基溴化乙醯胺反應，經後處理以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×４枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開４次）精製，得６３ｍｇ含目的物之無色油狀餾份。再以實施例４（２）一樣之操作，使此餾份，６．０ｍｌ四氫呋喃，１．３８ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應２小時，經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１展開４次，再以０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１．５，展開５次）精製，得１０．６８３ｍｇ（二步驟２．３５％）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，２７９４，２９３１，２８５０，１６５１，１６３３，１４４６，１３９２，１３６５，１２１１，１１４０，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７６（ｓ，３Ｈ），

１．３５（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），

１．４０（ｓ，９Ｈ），

２．５４－２．６７（ｍ，１Ｈ），

２．８７（ｓ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（112）

3．89（d，J＝13．9Hz，1H），
3．99－4．14（m，2H），
4．18－4．31（m，1H），
4．40－4．52（m，1H），
5．01（brs，1H），
5．33（brs，1H），
5．60（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．37（d，J＝11．2Hz，1H）．
MS　m／z：312（M^+-$HOCH_2CON(Me)t$-Br），57（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例14）

製造1α，3β－二羥基－20（S）－（N－第三丁基胺羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例8（1）一樣操作，使100mg含實施例11（1）所得1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之餾份，43mg（1．07毫莫耳）油性，60%氫化鈉，1．9ml四氫呋喃，80mg（1．9毫莫耳）N，N－二甲基甲醯胺，208mg（1．07毫莫耳）N－第三丁基溴化乙醯

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（113）

胺反應，經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×４枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開三次）分離，得３５ｍｇ含目的物之黃色油狀餾份。再以實施例４（２）一樣之操作，使３５ｍｇ此餾份，３．３ｍｌ四氫呋喃，０．７８ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（２小時）經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１展開３次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１，展開５次）精製，得５．２６７ｍｇ（三步驟１．２０％）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４００，３３２３，２９６８，２９３１，２８５０，１６６６，１５３１，１４５６，１３６５，１２２７，１１０９，１０５５ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），
１．３７（ｓ，９Ｈ），
２．１９－２．４７（ｍ，３Ｈ），
２．５５－２．６５（ｍ，１Ｈ），
２．７７－２．８８（ｍ，１Ｈ），
３．６９（ｄ，Ｊ＝１５．２Ｈｚ，１Ｈ），
３．８１（ｄ，Ｊ＝１５．２Ｈｚ，１Ｈ），
３．９８（ｑ，Ｊ＝６．３Ｈｚ，１Ｈ），
４．１７－４．３３（ｍ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明(114)

4.40－4.53(m，1H)，
5.01(brs，1H)，
5.34(brs，1H)，
5.60(brs，1H)，
6.11(d，J＝11.2Hz，1H)，
6.37(d，J＝11.2Hz，1H)，
6.44(brs，1H)．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CON(Me)t\text{-}Bu$)，57(100%)．
UV　λ_{max}　nm：263。

(實施例15)

製造1α，3β－二羥基－20(S)－(異丙氧羰基甲氧基)－9，10－閉聯孕甾－5，7，10(19)，16－四烯

與實施例8(1)一樣操作，使100mg含實施例11(1)所得1α，3β－雙(第三丁基二甲基矽烷氧基)－20(S)－羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10(19)，16－四烯之餾份，43mg(1.07毫莫耳)油性，60%氫化鈉，4.8ml四氫呋喃，80mg　15－冠－5－醚388mg(2.14毫莫耳)溴代乙酸異丙酯反應，進行後處理，以分取用薄層層析(0.5mm×4枚，己烷：乙酸乙酯＝10：1)分離，得20mg含目的物之無色油狀餾份。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準(CNS)A4規格(210×297公釐)

五、發明說明（115）

再與實施例4（2）一樣操作，使20mg此餾份，2.0ml四氫呋喃，0.46ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（2小時），施予後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1，展開2次，再以0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10；5：1，展開4次，再以0.5mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝1：3，展開4次）精製，得1.386mg（0.32%，3步驟）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3386，2978，2931，2850，1747，1444，1373，1286，1207，1126，1105，1052 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.78（s，3H），
1.25（d，J＝6.3Hz，6H），
1.37（d，J＝6.6Hz，3H），
2.55－2.66（m，1H），
2.77－2.87（m，1H），
3.89（d，J＝16.5Hz，1H），
4.02（d，J＝16.2Hz，1H），
4.07（q，J＝6.3Hz，1H），
4.19－4.30（m，1H），
4.40－4.50（m，1H），
5.01（brs，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（116）

５０３－５．１５（ｍ，１Ｈ），
５．３４（ｂｒｓ，１Ｈ），
５．６１（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ），
６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ）．
ＭＳ　ｍ／ｚ：４３０（M^+），１３３（１００％）．
ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６４。

（實施例１６）

（１）製造１７－乙醯基硫甲基－１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例４（３）一樣操作，使７５０ｍｇ（１．３８毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基））－１７－（羥甲基）雄甾－５，７，１６－三烯，６００ｍｌ乙醇進行反應（光照射３０分鐘，加熱回流２小時），以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝１０；１）精製，得５５０ｍｇ含標記化合物之餾份。與實施例１（３）一樣操作，使該餾份，與０．２３ｍｌ（２．９７毫莫耳）甲磺氯，０．５６ｍｌ（４．０２毫莫耳）三乙胺，５ｍｌ四氫呋喃，０．４５７ｇ（４．００毫莫耳）硫代乙酸鉀，５ｍｌ二甲亞碸反應（甲磺基化１５分鐘，硫代乙醯基化３０分鐘），經後處理，以分取用薄層層析（１．０ｍｍ×７枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（117）

一次）精製，得４３０ｍｇ含標記化合物之餾份。與實施例６（３）一樣，使此餾份與４０ｍｌ四氫呋喃，４０ｍｌ甲醇，１８ｇ Amberlist １５反應，經後處理，以分取用薄層層析（１．０ｍｍ×７枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開一次）精製，得３０ｍｇ無色油狀之標記化合物。

^{1}Ｈ ＮＭＲδ：０．７２（ｓ，３Ｈ），
２．３３（ｓ，３Ｈ），
３．５０－３．６８（ｍ，２Ｈ），
４．１０（ｂｒｓ，１Ｈ），
４．４３（ｂｒｓ，１Ｈ），
５．００（ｓ，１Ｈ），５．３３（ｓ，１Ｈ），
５．５７（ｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ），
６．３４（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ）。

（２）製造１７－（第三丁氧羰基甲硫基甲基）－１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

在氮氣氛下，於１０ｍｇ（０．０２６７毫莫耳）１７－乙醯基硫甲基－１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之０．５ｍｌ四氫呋喃溶液中，加入１０ｍｇ（０．０５１３毫莫

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（118）

耳）溴代乙酸第三丁酯，於室溫攪拌5分鐘後，加入0．5ml 1M氫氧化鉀甲醇溶液，於室溫攪拌14小時。以乙酸乙酯稀釋反應液後，以水，飽和食鹽水洗淨，以無水硫酸鈉乾燥。減壓下餾去溶媒後，所得殘渣以分取用薄層層析（0．25mm×1枚，乙酸乙酯：甲苯＝1：1，展開2次）精製得0．479mg（4%）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：2924，2848，1722，1564，1367，1294，1259，1124，1053cm^{-1}．

^1H NMRδ：0．76（s，3H），1．48（s，9H），3．08（s，2H），3．28－3．31（m，2H），4．22（bs，1H），4．46（brs，1H），5．01（s，1H），5．34（s，1H），5．59（s，1H），6．10（d，J＝10．9Hz，1H），6．37（d，J＝10．9Hz，1H）．

MS m／z：389（$M^+-(CH_3)_3C$），57（100%）．

UV λ_{max}nm：264。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（119）

（實施例１７）

製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－烯

在８４８ｍｇ（１．５２毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之２５ｍｌ四氫呋喃溶液中，加入３７４ｍｇ（９．３４毫莫耳）油性，６０％氫化鈉，氮氣流下，於室溫攪拌１５分鐘後，滴入３３５ｍｇ（１．５２毫莫耳）１５－冠醚－５，１．８２ｇ（９．３４毫莫耳）溴代乙酸第三丁酯之８ｍｌ四氫呋喃，加熱回流下攪拌４小時３０分鐘。將反應溶液倒入水中，以乙酸乙酯萃取後，依序以飽和氯化銨水溶液，飽和碳酸氫鈉水溶液，飽和食鹽水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥後，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（正己烷：乙酸乙酯＝２０：１）精製，得１．４７ｍｇ含標記化合物之無色油狀混合物。

（２）製造〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸

在１．４７ｇ實施例１７（１）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（120）

19），16－四烯之混合物之30.0ml四氫呋喃溶液中，加入11ml　1M甲醇鈉甲醇溶液，於室溫攪拌30分鐘。再加入11ml　1M氫氧化鈉水溶液，於室溫攪拌30分鐘，以二氯甲烷稀釋反應溶液後，倒入飽和磷酸二氫鈉水溶液中，以二氯甲烷萃取後，以無水硫酸鎂乾燥後。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（二氯甲烷：乙醇＝20；1）精製，得651mg（69%二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3330－2500，2952，2929，2886，2856，1727，1471，1461，1369，1253，1083，1078 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.04－0.09（m，12H），0.78（s，3H），0.88（s，18H），1.40（d，J＝6.4Hz，3H），2.78－2.88（m，1H），3.93（d，J＝16.3Hz，1H），4.01－4.25（m，3H），4.34－4.43（m，1H），4.87（d，J＝2.1Hz，1H），5.20（d，J＝1.7Hz，1H），5.64（brs，1H），6.10（d，J＝11.4Hz，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（121）

6．23（d，J＝11．2Hz，1H）．

MS　m／z：616（M^+－1），73（100%）．

UV　λ_{max}　nm：264。

（3）製造1α，3β雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－乙基－1－甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

在326mg（0．53毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸之5．3ml四氫呋喃溶液中，加入87mg（0．85毫莫耳）3－甲基－3－戊醇，175mg（0．85毫莫耳）N，N´－二環己基碳二胺，65mg（0．53毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，氮氣流下於室溫攪拌17小時。將反應液倒入水中，以乙酸乙酯萃取，有機層以無水硫酸鎂乾燥後，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝20：1）精製，得319mg含標記化合物之無色油狀混合物。

（4）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－乙基－1－甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

在319mg實施例17（3）所得含1α，3β雙

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（122）

（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物之１０ｍｌ四氫呋喃溶液中，加入４．５５ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，氮氣流下於５０℃攪拌２小時。將反應溶液倒入水中，以乙酸乙酯萃取，依序以飽和氯化銨水溶液，飽和碳酸氫鈉水溶液，飽和食鹽水洗淨後，有機層以無水硫酸鎂乾燥。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（二氯甲烷：乙醇＝２０：１）再以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×３枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開３次）精製，得１２５．３ｍｇ（５０％二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４００，２９７３，２９３１，２８８３，２８５０，１７４５，１７２７，１４５９，１３７３，１２１８，１１２２，１０５２ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），
０．８５（ｔ，Ｊ＝７．６Ｈｚ，６Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），
２．５６－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７７－２．８７（ｍ，１Ｈ），
３．８４（ｄ，Ｊ＝１６．５Ｈｚ，１Ｈ），
３．９６（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），
４．０８（ｑ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（123）

4．19－4．29（m，1H），
4．40－4．49（m，1H），
5．01（brs，1H），
5．34（brs，1H），
5．59（brs，1H），
6．11（d，J＝11．4Hz，1H），
6．37（d，J＝11．1Hz，1H）．
MS　m／z：472（M^+），85（100%）．
UV　λ_{max}nm：263。

（實施例18）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1－二甲基丁氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使26mg（0．042毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，0．1ml（1．208毫莫耳）2－甲基－2－戊醇，14mg（0．067毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，5mg（0．042毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1．0ml四氫呋喃反應（室溫，18小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝6：1，展開1次）精製，得20mg含標記

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（124）

化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣之操作，使２０ｍｇ實施例１８（１）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丁氧羰基甲氧基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，１．０ｍｌ　１Ｍ氟化四丁基銨四氫呋喃溶液，１．０ｍｌ四氫呋喃反應（外溫４５℃，１小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開二次）精製，得２．７２４ｍｇ（１４％二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：２９２９，２８５２，１７４７，１６３５，１４５５，１３６９，１２１８，１１２２，１０５２ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），
０．９１（ｔ，Ｊ＝７．０Ｈｚ，３Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．２Ｈｚ，３Ｈ），
２．５６－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７７－２．８９（ｍ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（125）

3．82（d，J＝16．5Hz，1H），
3．93（d，J＝16．5Hz，1H，
4．08（q，J＝6．2Hz，1H），
4．19－4．30（m，1H），
4．40－4．93（m，1H），
5．01（s，1H），5．34（s，1H），
5．60（s，1H），
6．11（d，J＝11．3Hz，1H），
6．37（d，J＝11．3Hz，1H）．
MS（ESI）　m／z：495（M^+＋Na）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例19）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1－二甲基己氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－%5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使50．7mg（0．0822毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，0．1ml（0．936毫莫耳）2－甲基－2－庚醇，14mg（27毫莫耳）N，N´－二環己基碳一醯亞胺，0．01mg（0．01毫莫耳）4－（二甲胺基）吡

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（126）

啶，１．０ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１８小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝６：１，展開２次）精製，得３０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基己氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣之操作，使３０ｍｇ實施例１９（１）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丁氧羰基甲氧基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，１．０ｍｌ　１Ｍ氟化四丁基銨四氫呋喃溶液，１．０ｍｌ四氫呋喃反應（外溫５０℃，１小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開二次）精製，得７．４１４ｍｇ（１８％二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：２９２９，２８５２，１７４５，１７２７，１６２５，１５６２，１４５０，１３６９，１１２２，１０５２ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），０．８８（ｔ，Ｊ＝７．０Ｈｚ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（127）

1．36（d，J＝6．5Hz，3H），
2．56－2．65（m，1H），
2．77－2．87（m，1H），
3．82（d，J＝16．5Hz，1H），
3．92（d，J＝16．5Hz，1H），
4．07（q，J＝6．5Hz，1H），
4．21－4．29（m，1H），
4．40－4．49（m，1H），
5．01（s，1H），5．34（s，1H），
5．59（s，1H），
6．11（d，J＝11．3Hz，1H），
6．37（d，J＝11．3Hz，1H）．

MS　m／z：482（M^+-H_2O），57（100％）．

UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例20）

（1）製造丙烯酸1－乙基－1－甲基丙酯

在氮氣氛下，於室溫在5．0g（55．2毫莫耳）丙烯醯氯，7．6ml（60．8毫莫耳）3－甲基－3－戊醇之二氯甲烷溶液中，加入23ml（166毫莫耳）三乙胺，於室溫攪拌14小時後，以二氯甲烷稀釋反應溶液，以水，飽和食鹽水洗淨後，有機層以無水硫酸鎂乾燥。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（128）

乙酯＝１０：１）精製，得５．４５ｇ（６３％）無色油狀混合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．８２（ｔ，Ｊ＝７．６Ｈｚ，６Ｈ），１．３７（ｓ，３Ｈ），
１．６６－１．９６（ｍ，４Ｈ），
５．６６（ｄｄ，Ｊ＝１０．３，１．７Ｈｚ，１Ｈ），
６．００（ｄｄ，Ｊ＝１７．３，１０．３Ｈｚ，１Ｈ），６．２４（ｄｄ，Ｊ＝１７．３，１．７Ｈｚ，１Ｈ）。

（２）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－｛２－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基）乙氧基｝－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

在氮氣氛下，於０℃在５０ｍｇ（０．０８９４毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，０．１ｇ（０．６４０毫莫耳）丙烯酸１－乙基－１－甲基丙酯之１．０ｍｌ四氫呋喃溶液中，加入３．４ｍｇ（０．０８５毫莫耳）油性，６０％氫化鈉，於５℃攪拌１８小時後，以乙酸乙酯稀釋反應溶液，以飽和氯化銨水，水洗淨後，以無水硫酸鎂乾燥有機層，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（129）

０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開一次）精製，得７７．３ｍｇ含標記化合物之混合物。

（３）製造１α，３β－２０（Ｓ）－｛２－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基）乙氧基｝－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例２０（２）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－｛２－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基）乙氧基｝－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，１．０ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，１．０ｍｌ四氫呋喃反應（外溫５０℃，１小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×４枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１展開２次）精製，得１５．８ｍｇ（３６％二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：：２９７３，２９３１，２８８１，２８５），１７２７，１４６１，１４４４，１３６７，１２６３，１１９５，１０５６ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），

０．８５（ｔ，Ｊ＝７．６Ｈｚ，６Ｈ），

１．２８（ｄ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，３Ｈ），

１．３７（ｓ，３Ｈ），

２．４８（ｔ，Ｊ＝６．８Ｈｚ，２Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（130）

2．55－2．66（m，1H），
2．76－2．88（m，1H），
3．44－3．56（m，1H），
3．57－3．71（m，1H），
3．92（q，J＝6．5Hz，1H），
4．19－4．28（m，1H），
4．40－4．49（m，1H），
5．01（s，1H），5．34（s，1H），
5．57（s，1H），
6．10（d，J＝11．3Hz，1H），
6．37（d，J＝11．3Hz，1H）．
MS　m／z：486（M^+），312（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

實施例21

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－異丙基－2－甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

於室溫攪拌一夜30mg（0．049毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，17mg（0．15毫莫耳）2，4－二甲基－3－戊醇，19mg（0．099毫莫

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（131）

耳）1－乙基－3－（3－二甲胺基丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，18mg（0.15毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1ml二氯甲烷之混合物後，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝5：1，展開1次）分離，得22mg含目的物之無色油狀混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－異丙基－2－甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使22mg（0.031毫莫耳）實施例21（1）所得含1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－異丙基－2－甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.62ml四氫呋喃，0.31ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫50℃，2小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1展開2次）精製，得9.336mg（39%，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

IR（neat）：3370，2966，2933，2877，2850，1751，1464，1203，1122，1053cm^{-1}.

^{1}H　NMRδ：0.78（s，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（132）

0.83－0.91（m，12H）
1.38（d，J＝6.4Hz，3H），
2.56－2.65（m，1H），
2.77－2.87（m，1H），
3.98（d，J＝16.7Hz，1H），
4.08（d，J＝16.7Hz，1H），
4.04－4.17（m，1H），
4.18－4.36（br，1H），
4.40－4.50（br，1H），
4.67（t，J＝6.3Hz，1H），
5.01（brs，1H），
5.34（s，1H），
5.61（brs，1H），
6.11（d，J＝11.4Hz，1H），
6.37（d，J＝11.4Hz，1H）.
MS m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2CH(I\text{-}Pr)_2$)，57（100%）.
UV λ_{max} nm：264。

（實施例22）
（1）製造〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基}氧基〕－N－（2，2，3，3，3－五氟化丙基）丙醯胺

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（133）

於室溫攪拌一夜３４．１ｍｇ（０．０５５毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，４１ｍｇ（０．２８毫莫耳）２，２，３，３，３－五氟化丙胺，２１ｍｇ（０．１１毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲胺基丙基）碳二醯亞胺・１水合物，５５ｍｌ二氯甲烷之混合物後，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）分離，得２９ｍｇ含目的物之無色油狀化合物。

（２）製造｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－（２，２，３，３，－五氟化丙基）乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使２９ｍｇ（０．０３９毫莫耳）實施例２２（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（２，２，３，３，３－五氟化丙基）乙醯胺之混合物，０．７８ｍｌ四氫呋喃，０．３９ｍｌ１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液（外溫５０℃，１．５小時），經後處理以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（由本局填寫）

承辦人代碼：	134
大　　類：	
IPC分類：	

A6
B6

再以0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙腈＝1：1，展開1次）精製，得9.603mg（33%，二步驟）無色泡沫狀標記化合物。

本案已向：
國（地區）　申請專利，申請日期：　　案號：　　，□有　□無主張優先權

IR（neat）：3419，3357，2927，2852，1684，1533，1437，1346，1198，1155，1115，1053，1028 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.79（s，3H），1.36（d，J＝6.6Hz，3H），2.55－2.65（m，1H），2.77－2.87（m，1H），3.86（d，J＝15.5Hz，1H），4.02（d，J＝15.5Hz，1H），3.91－4.09（m，3H），4.19－4.30（m，1H），4.41－4.49（m，1H），5.01（brs，1H），5.34（s，1H），5.61（brs，1H），6.11（d，J＝11.2Hz，1H），6.36（d，J＝11.2Hz，1H），6.85－6.97（m，1H）.

MS m／z：519（M^+），91（100%）.

UV λ_{max} nm：264。

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

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（135）

（實施例２３）

（１）製造溴代乙酸１－乙基－１－甲基丙酯

在１０．６ｇ（１０３毫莫耳）３－甲基－３－戊醇之４９ｍｌ二氯甲烷溶液中，加入１５．０ｇ（１２４毫莫耳）Ｎ，Ｎ－二甲基苯胺，２５．０ｇ（１２４毫莫耳）化乙醯溴，於氮氣流下室溫下攪拌２小時。將反應溶液倒入水中，以第三丁基甲醚萃取後，依序以飽和硫酸氫鉀水溶液，飽和碳酸氫鈉水溶液洗淨，以無水硫酸鎂乾燥，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以減壓蒸餾（５ｍｍＨｇ，７１－７２℃）精製，得２０．４ｇ（８９％）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：２９７５，２９４２，２８８３，１７３１，１４６１，１３８２，１２９０，１１８０，１１３３，１１０８ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：

０．８８（ｔ，Ｊ＝７．５Ｈｚ，６Ｈ），

１．４１（ｓ，３Ｈ），

１．７０－１．９９（ｍ，４Ｈ），

３．７６（ｓ，２Ｈ）．

（２）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）孕甾－５，７－二烯

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 136）

在５．００ｇ（８．９１毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－羥基孕甾－５，７－二烯之９０ｍｌ四氫呋喃溶液中，加２．１４ｇ（５３．５毫莫耳）油性６０％氫化鈉，１．７７ｍｌ（８．９１毫莫耳）１５－冠－５－醚及１１．９ｇ（５３．５毫莫耳）溴代乙酸１－乙基－１－甲基丙酯，於氬氣氛下加熱回流１６小時。恢復爲室溫，將反應溶液倒入飽和氯化銨水溶液中，以乙酸乙酯萃取二次。有機層分在一起，以飽和食鹽水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥後，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：第三丁基甲醚＝３０：１，以己烷：甲苯＝２：１）精製，得５．５９ｇ含標記化合物之混合物。

（３）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）孕甾－５，７－二烯

於６５℃（外溫）攪拌１７小時，５．５９ｇ實施例２３（２）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧）孕甾－５，７－二烯之混合物，７９．５ｍｌ（７９．５毫莫耳）１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，２ｍｌ乙酸之混合物。使反應溶液恢復爲室溫，以乙酸乙酯稀釋，依序以無水硫酸氫鈉水溶液，飽和碳酸氫鈉水溶液，飽和食鹽水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥。減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 137）

：０．３）精製，得２．４３ｇ（５７％二步驟）淡黃色泡沫狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３６９，２９６８，２９３９，２８７５，１７５１，１７２２，１４６０，１３７５，１２９４，１２０９，１１３２，１０５５，１０３２ cm^{-1}.

^{1}H ＮＭＲδ：０．６２（ｓ，３Ｈ），
０．８５（ｔ，Ｊ＝７．５Ｈｚ，６Ｈ），
０．９４（ｓ，３Ｈ），
１．２０（ｄ，Ｊ＝６．１Ｈｚ，３Ｈ），
１．４０（ｓ，３Ｈ），
２．２７－２．４１（ｍ，１Ｈ），
２．４８－２．５９（ｍ，１Ｈ），
２．６６－２．７９（ｍ，１Ｈ），
３．３９（ｍ，１Ｈ），
３．７６（ｂｒｓ，１Ｈ），
３．９３（ｄ，Ｊ＝１６．０Ｈｚ，１Ｈ），
４．０１（ｄ，Ｊ＝１６．０Ｈｚ，１Ｈ），
４．０７（ｍ，１Ｈ），
５．３６－５．４５（ｍ，１Ｈ），
５．６９－５．７６（ｍ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４７４（M^{+}），３１５（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２７１，２８２，２９４．

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 138）

（４）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９）－三烯

除將光照射改爲２小時１５分鐘以外，其他均與實施例４（３）一樣操作，使２．４２ｇ（５．１０毫莫耳）１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）孕甾－５，７－二烯，６５０ｍｌ四氫呋喃反應後，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯：乙醇＝７：３：０．３，再以二氯甲烷：乙酸乙酯：乙醇＝６：１：０．１）精製，得７７３ｍｇ（３２％）無色泡沫狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３７７，２９６８，２９３９，２８７９，１７４９，１７１６，１４５８，１３７５，１２９６，１２１３，１１２８，１０５７ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．５３（ｓ，３Ｈ），
０．８５（ｔ，Ｊ＝７．５Ｈｚ，６Ｈ），
１．１９（ｄ，Ｊ＝６．０Ｈｚ，３Ｈ），
１．３９（ｓ，３Ｈ），
２．２５－２．３７（ｍ，１Ｈ），
２．５５－２．６５（ｍ，１Ｈ），
２．７７－２．８８（ｍ，１Ｈ），
３．３６（ｍ，１Ｈ），
３．９２（ｄ，Ｊ＝１６．０Ｈｚ，１Ｈ），
４．００（ｄ，Ｊ＝１６．０Ｈｚ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 139）

4．17－4．29（br，1H），
4．39－4．48（br，1H），
4．99（m，1H），5．32（m，1H），
6．03（d，J＝11．3Hz，1H），
6．37（d，J＝11．3Hz，1H）．
MS　m／z：474（M^+），134（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

實施例24

合成（1α，3β）－1，3－雙（（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）孕甾－5，7，16－三烯－20－酮

（1）合成（1α，3β）－1，3－雙（（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）雄甾－5，7，16－三烯－17－基三氟甲磺酸酯

溶解21．0g（1α，3β）－1，3－雙（（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）雄甾－5，7－二烯－17－酮於140ml四氫呋喃。所得溶液中於室溫加入19．1g　2－（N，N－雙（三氟甲磺基）胺基）吡啶，繼而冷卻爲－78℃後，滴下48．3ml雙（三甲矽烷基）醯胺鈉之1．0莫耳四氫呋喃溶液。於－78℃繼續攪拌此溶液30分鐘後，加入飽和碳酸氫鈉水溶液，以己烷／乙酸乙酯＝5／1萃取。以無水硫酸鈉乾燥此萃取液後，減壓下除去溶媒。所得殘留物以100ml乙腈洗淨，得23．3．g（收率：89%）標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 140）

^{1}H NMR（270MHz，CDCl$_3$）δ：
5.64－5.58（m，2H），
5.43－5.37（m，1H），
4.12－3.98（m，1H），
3.74－3.68（m，1H），
2.96－2.84（m，1H），
2.48－2.26（m，5H），
2.00－1.42（m，1H），
0.97（s，3H），0.95（s，3H），
0.89（s，18H），0.12（s，3H），
0.107（s，6H），0.06（s，3H）。

（2）合成（1α，3β）－1，3－雙（（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）孕甾－5，7，16－三烯－20－酮

溶解40.3g（1α，3β）－1，3－雙（（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）雄甾－5，7，16－三烯－17－基三氟甲磺酸酯於203ml二甲基乙醯胺，繼而加入703mg（三苯膦）鈀（0）。減壓所得混合液，使其爲一氧化碳氣氛，再重覆二次此操作。室溫下，於此混合液中加入74.4ml氯化二甲基鋁之0.98莫耳己烷溶液，繼而於室溫下攪拌20分鐘。昇溫混合液至58℃，繼續攪拌2小時後，加入水，以己烷／乙酸乙酯＝1／1萃取，以無水硫酸鎂乾燥此萃取溶液

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（141）

後，減壓下濃縮，得３４．０ｇ（收率：１００％）標記化合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲ（３００ＭＨｚ，benzene ｄ$_{6}$）δ：

６．０１（ｄｄ，Ｊ＝２．５，２．７Ｈｚ，１Ｈ），

５．７２（ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ，１Ｈ），

５．４３－５．３６（ｍ，１Ｈ），

４．３８－４．２３（ｍ，１Ｈ），

３．５８－３．５１（ｍ，１Ｈ），

３．０９－２．９７（ｍ，１Ｈ），

２．６３－２．５３（ｍ，２Ｈ），

２．４１－２．２９（ｍ，１Ｈ），

２．０８－１．９６（ｍ，３Ｈ），

１．９４（ｓ，３Ｈ），

１．８３－１．６７（ｍ，２Ｈ），

１．０５（ｓ，９Ｈ），１．０４（ｓ，３Ｈ），

０．９５（ｓ，９Ｈ），０．８６（ｓ，３Ｈ），

０．１９（ｓ，３Ｈ），０．１７（ｓ，３Ｈ），

０．１１（ｓ，３Ｈ），０．０２（ｓ，３Ｈ）。

實施例２５

合成１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

（１）合成（１α，３β，２０Ｓ）－１，３－雙（（第

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（142）

三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）孕甾－5，7，16－烯－20－醇

溶解45.0g實施例24合成之（1α，3β）－1，3－雙（（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）孕甾－5，7，16－三烯－20－酮於240ml甲苯，繼而冷卻爲－20℃，攪拌30分鐘。所得溶液中，於－20℃加入22.9ml甲硼烷一硫化二甲基錪合物，攪拌5分鐘。室溫下於此溶液中加入74.4ml氯化二甲基鋁之0.98莫耳己烷溶液，繼而於室溫下攪拌20分鐘。再於－20℃下在此溶液中加入22.9ml（R）－2－甲基－CBS－oxazaborolizine之1莫耳甲苯溶液，攪拌1小時後，加入甲醇，以乙酸乙酯萃取。以無水硫酸鈉乾燥此萃取液後，減壓下餾去溶媒。所得殘渣以矽膠管柱層析（液層：己烷／乙酸乙酯＝9／1）精製，得23.3g（收率89%）標記化合物。

^{1}H NMR（300MHz，benzene d_6）δ：

5.71（d，J＝4.9Hz，1H），

5.49（brs，2H），

4.40－4.15（m，2H），

3.59（brs，1H），

3.13－3.03（m，1H），

2.61（s，1H），2.59（s，1H），

2.46－2.37（m，1H），

2.20－1.92（m，4H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 143）

1．85－1．47（m，4H），
1．24（d，J＝6．6Hz，3H），
1．06（s，9H），0．99（s，3H），
0．95（s，9H），0．91（s，3H），
0．20（s，3H），0．18（s，3H），
0．06（s，3H），0．05（s，3H）。

（2）合成乙酸（（（（1α，3β，20S）－1，3－雙（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）孕甾－5，7，16－三烯－20基）氧基）1－乙基－1－甲基丙酯

溶解210mg（1α，3β，20S）－1，3－雙（（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）孕甾－5，7，16－烯－20－醇及90mg　60％氫化鈉於3．7ml四氫呋喃。室溫下於所得溶液中加入83μl 15－冠－5－醚，繼而加入502mg溴代乙酸1－乙基－1－甲基丙酯，加熱爲60℃，攪拌12小時後，加入甲醇，以第三丁基甲醚萃取。以無水硫酸鈉乾燥此萃取溶液後減壓下餾去溶媒。所得殘留物以矽膠管柱層析（液層：己烷／二氯甲烷＝1／2）精製，得244mg（收率93％）標記化合物。

^{1}H　NMR（300MHz，benzene d_6）δ：
5．70（d，J＝6．9Hz，1H），
5．56（brs，1H），
5．49－5．41（m，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 144）

4．38－4．25（m，1H），
4．21（q，J＝6．3Hz，1H），
3．99（d，J＝16．2Hz，1H），
3．92（d，J＝16．2Hz，1H），
3．63－3．55（m，1H），
3．10－3．00（m，1H），
2．64－2．53（m，1H），
2．47－2．36（m，1H），
2．23－1．44（m，12H），
1．41（d，J＝6．3Hz，3H），
1．31（s，3H），1．04（s，9H），
0．98（s，3H），0．94（s，9H），
0．89（s，3H），
0．76（t，J＝7．4Hz，6H），
0．18（s，3H），0．16（s，3H），
0．13（s，3H），0．06（s，3H）。

（3）合成乙酸（（（1α，3β，20S）－1，3－二羥基孕甾－5，7，16－三烯－20－基）氧基）1－乙基－1－甲基丙酯

溶解203mg乙酸（（（（1α，3β，20S）－1，3－雙（第三丁基（二甲基）矽烷基）氧基）孕甾－5，7，16－三烯－20基）氧基）1－乙基－1－甲基丙酯於3．0ml氟化四丁基銨1．0莫耳四氫呋喃

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 145）

溶液，繼而加入７５μｇ乙酸。所得溶液加熱爲６０℃，攪拌１２小時後，以乙酸乙酯萃取。以無水硫酸鈉乾燥此萃取液，減壓下餾去溶媒。所得殘留物以矽膠管柱層析（液層：己烷／乙酸乙酯＝２／３）精製，得１３２ｍｇ（收率９７％）標記化合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲ（３００ＭＨｚ，acetone-d_6）δ：

５．６６－５．５９（ｍ，２Ｈ），

５．４５－５．３９（ｍ，１Ｈ），

４．１４（ｑ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，１Ｈ），

４．０９－３．９５（ｍ，１Ｈ），

３．９５（ｄ，Ｊ＝１６．２Ｈｚ，１Ｈ），

３．８６（ｄ，Ｊ＝１６．２Ｈｚ，１Ｈ），

３．８０－３．７０（ｍ，１．５Ｈ），

３．６４－３．５０（ｍ，０．５Ｈ），

２．４９－２．３９（ｍ，１Ｈ），

２．３８－２．１７（ｍ，４Ｈ），

２．１２－２．０６（ｍ，１Ｈ），

１．９６－１．６２（ｍ，８Ｈ），

１．５４－１．４２（ｍ，１Ｈ），

１．３７（ｓ，３Ｈ），

１．３０（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），

０．９５（ｓ，３Ｈ），０．９０（ｓ，３Ｈ），

０．８５（ｔ，Ｊ＝７．４Ｈｚ，６Ｈ）。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 146）

（４）合成１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

溶解１３２ｍｇ乙酸（（（１α，３β，２０Ｓ）－１，３－二羥基孕甾－５，７，１６－三烯－２０－基）氧基）１－乙基－１－甲基丙酯於５００ｍｌ四氫呋喃。於氬氣體氣流下冷卻此溶液爲１８℃，使牛尾電機公司製５ＫＷ氙－汞燈紫外線照射裝置（２８０～３２０ｎｍ）（特願平１０－１８８８８０號，ＷＯ　００／０１４７７號）紫外線照射３０分鐘。再加熱回流此溶液２小時後，減壓下餾去溶媒。所得殘留物以矽膠管柱層析（液層：二氯甲烷／乙酸乙酯＝６／４）精製，得３４．２ｍｇ（收率２６％）標記化合物。如此所得化合物之各光譜測定值均與實施例１７（４）所得化合物一致。

實施例２６

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣使３１ｍｇ（０．０５毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，９ｍｇ（０．０８毫

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（147）

莫耳）3－乙基－3－戊醇，17mg（0.08毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，6mg（0.05毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶反應（室溫，17小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.05mm×3枚，己烷：乙酸乙酯＝10：1，展開2次）精製，得27.0mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1，1－二乙基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使27mg實施例26（1）所得含1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1－二甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，1.7ml四氫呋喃，0.57ml 1M氟化四丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫50℃，2小時），施予後處理，所得殘留物以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1，展開2次，再以0·5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1，展開3次，再以0·25mm×2枚，二氯甲烷：乙酸乙酯＝3：1，展開2次）精製，得2.966mg（12.2%，二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3386，2969，2931，2881，2852，1745，1727，1457，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（148）

1288，1214，1122，1052cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.78（s，3H），

0.81（t，J＝7.3Hz，9H），

1.36（d，J＝6.3Hz，3H），

1.84（q，J＝7.3Hz，6H），

2.18－2.47（m，3H），

2.54－2.67（m，1H），

2.76－2.88（m，1H），

3.85（d，J＝16.5Hz，1H），

3.97（d，J＝16.5Hz，1H），

4.04－4.13（m，1H），

4.19－4.31（m，1H），

4.39－4.49（m，1H），

5.01（brs，1H），

5.34（brs，1H），

5.59（brs，1H），

6.11（d，J＝11.5Hz，1H），

6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：312(M^{+}-$HOCH_2COOCEt_3$)，57（100%）.

UV λ_{max} nm：263。

（實施例27）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（149）

－２０（Ｓ）－（環庚氧基羰基甲氧基））－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣操作，使２０ｍｇ（０．０３２毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，６μｌ（０．０５１８毫莫耳）環庚醇，１０ｍｇ（０．０５１８毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，４ｍｇ（０．０３２４毫莫耳）４－（二甲基胺基）吡啶，１．０ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，２小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得２６．７ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（環庚氧基羰基甲氧基））－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣之操作，使２６．７ｍｇ實施例２７（１）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（環庚氧基羰基甲氧基））－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．７ｍｌ四氫呋喃，０．３ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，１小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（150）

1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝5：5：1，展開2次）精製，得4.134mg（25%，2步驟）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3326，2927，2852，2358，2321，1749，1627，1558，1448，1218，1122，1053 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.77（s，3H），
1.36（d，J＝6.5Hz，3H），
2.55－2.65（m，1H），
2.76－2.87（m，1H），
3.85－4.17（m，3H），
4.18－4.29（m，1H），
4.41－4.49（m，1H），
4.94－5.07（m，2H），
5.34（s，1H），
5.61（brs，1H），
6.11（d，J＝11.1Hz，1H），
6.37（d，J＝11.1Hz，1H）.

MS m／z：466（M^+-H_2O），55（100%）.

UV λ_{max} nm：263。

實施例28

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（151）

－２０（Ｓ）－（１－乙基丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使２０ｍｇ（０．０３２４毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，７μｌ（０．０５１８毫莫耳）４－庚醇，１０ｍｇ（０．０５１８毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，４ｍｇ（０．０３２４毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，１．０ｍｌ二氯甲烷，反應（室溫℃，２小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得２１．７ｍｇ（％）之標記化合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣，使２１．７ｍｇ實施例２８（１）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．７ｍｌ四氫呋喃，０．３ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，１小時），經後處理，所得殘體以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（152）

枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開２次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開２次））精製，得４．２６６ｍｇ（２７％，二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，３３２５，２９５６，２９３１，２８５２，１７４９，１６２７，１４４８，１２０３，１１２２，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），

０．９０（ｔ，Ｊ＝７．０Ｈｚ，６Ｈ），

１．３７（ｄ，Ｊ＝６．２Ｈｚ，３Ｈ），

２．５３－２．６５（ｍ，１Ｈ），

２．７６－２．８８（ｍ，１Ｈ），

３．８７－４．１７（ｍ，３Ｈ），

４．１９－４．２９（ｍ，１Ｈ），

４．３９－４．４９（ｍ，１Ｈ），

４．９２－５．０５（ｍ，２Ｈ），

５．３４（ｓ，１Ｈ），

５．６１（ｂｒｓ，１Ｈ），

６．１１（ｄ，Ｊ＝１１．１Ｈｚ，１Ｈ），

６．３８（ｄ，Ｊ＝１１．１Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４５０（$M^{+}-2H_2O$），５７（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６３。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（153）

（實施例２９）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－甲基－１－丙基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使２０ｍｇ（０．０３毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，６．３ｍｇ（０．０４８毫莫耳）４－甲基－４－庚醇，９．９ｍｇ（０．０４８毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，３．７ｍｇ（０．０３毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．３ｍｌ二氯甲烷反應（室溫℃，１５小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開２次）精製，得１４．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－甲基－１－丙基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使１４ｍｇ實施例２９（１）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－甲基－１－丙基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（154）

16－四烯之混合物，0．5ml四氫呋喃，0．2ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫50℃，2小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0．25mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1，展開3次）精製，得6．351mg（42．3%，二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3417，2960，2931，2873，1747，1467，1373，1213，1122，1052 cm^{-1}．

^1H NMR δ：0．77（s，3H），
0．90（t，J＝7．3Hz，6H），
1．36（d，J＝6．6Hz，3H），
1．40（s，3H），
2．17－2．47（m，3H），
2．56－2．66（m，1H），
2．76－2．88（m，1H），
3．81（d，J＝16．5Hz，1H），
3．94（d，J＝16．5Hz，1H），
4．02－4．13（m，1H），
4．19－4．29（m，1H），
4．40－4．51（m，1H），
5．01（brs，1H），
5．34（brs，1H），
5．59（brs，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（155）

6．11（d，J＝11．4Hz，1H），
6．37（d，J＝11．1Hz，1H）．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2COOC(CH_3)(C_3H_7)_2$)，
71（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例30）
（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－甲基環己氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣操作，使20mg（0．0324毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，7μl（0．0518毫莫耳）1－甲基環己醇，10mg（0．0518毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，4mg（0．0324毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1．0ml二氯甲烷反應（室溫℃，14小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝7：1，展開1次）精製，得14．0mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－甲基環己氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（156）

10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例30（1）所得含14.0mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－甲基環己氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.7ml四氫呋喃，0.3ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫50℃，1小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝5：5：1，展開1次）精製，得4.220mg（27%，二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3446，2931，2852，1747，1446，1211，1124，1053，962cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.78（s，3H），
1.37（d，J＝6.8Hz，3H），
1.49（s，3H），
2.56－2.66（m，1H），
2.77－2.89（m，1H），
3.85（d，J＝16.5Hz，1H），
3.98（d，J＝16.5Hz，1H），
4.09（q，J＝6.8Hz，H），
4.19－4.29（m，1H），
4.41－4.49（m，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（157）

5．02（s，1H），
5．34（s，1H），
5．60（brs，1H），
6．11（d，J＝11．6Hz，1H），
6．38（d，J＝11．6Hz，1H）．
MS　m／z：466（M^+-H_2O），55（100%）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例31）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（環十二烷氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使20mg（0．0324毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，9μl（0．0518毫莫耳）環十二烷醇，10mg（0．0518毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，4mg（0．0324毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1．0ml二氯甲烷反應（室溫℃，14小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝7：1，展開1次）精製，得21．6mg含標記化合物之混合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（158）

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（環十二烷氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３１（１）所得含２１．６ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（環十二烷氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．７ｍｌ四氫呋喃，０．３ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫５０℃，１小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開１次）精製，得４．９７１ｍｇ（２８％，二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４４６，２９３１，２８５），１７４８，１４７１，１４４６，１２０５，１１２４，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），
２．５６－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７７－２．８７（ｍ，１Ｈ），
３．９０（ｄ，Ｊ＝１６．５Ｈｚ，１Ｈ），
４．０２（ｄ，Ｊ＝１６．５Ｈｚ，１Ｈ），
４．０９（ｑ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，１Ｈ），
４．１９－４．２９（ｍ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明(159)

4.41-4.49(m, 1H),
5.01(s, 1H),
5.04-5.15(m, 1H),
5.34(s, 1H), 5.60(brs, 1H),
6.10(d, J=11.3Hz, 1H),
6.37(d, J=11.3Hz, 1H).
MS m/z：518(M^+-2H_2O), 55(100%).
UV λ_{max} nm：263。

(實施例32)

(1)製造1α, 3β-雙(第三丁基二甲基矽烷氧基)-20(S)-(甲基環戊氧羰基甲氧基)-9, 10-閉聯孕甾-5, 7, 10(19), 16-四烯

與實施例17(3)一樣之操作，使30mg(0.048毫莫耳〔{1α, 3β-雙(第三丁基二甲基矽烷氧基)-9, 10-閉聯孕甾-5, 7, 10(19), 16-四烯-20(S)-基}氧基〕乙酸，4.8mg(0.048毫莫耳)1-甲基環戊醇，9.9mg(0.048毫莫耳)N, N´-二環己基碳二醯亞胺，3.7mg(0.03毫莫耳)4-(二甲胺基)吡啶，0.3ml二氯甲烷反應(室溫，15小時)，經後處理，以分取用薄層層析(0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯=10：1，展開2次)精製，得20.0mg含標記

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準(CNS)A4規格(210×297公釐)

五、發明說明 (160)

化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－甲基環戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３２（１）所得含２０ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－甲基環戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．５ｍｌ四氫呋喃，０．２９ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫５０℃，１．５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開３次）精製，得７．６６６ｍｇ（５４．３％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９２，２９６５，２９３３，２８７３，２８５０，１７４７，１４４４，１３７５，１２２２，１１８０，１１２２，１０５２ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），

１．３６（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），

２．１９－２．５１（ｍ，３Ｈ），

２．５６－２．６８（ｍ，１Ｈ），

２．７７－２．８９（ｍ，１Ｈ），

３．８３（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（161）

3．95（d，J＝16．3Hz，1H），
4．02－4．14（m，1H），
4．21－4．31（m，1H），
4．41－4．51（m，1H），
5．01（bbrs，1H），
5．34（brs，1H），
5．60（brs，1H），
6．11（d，J＝11．4Hz，1H），
6．37（d，J＝11．1Hz，1H）．
MS　m／z：470（M^+），312（M^+-$HOCH_2COOC_6H_{11}$），83（100％）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例33）
（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（環辛氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使21．3mg（0．035毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，14．0mg（0．109毫莫耳）環辛醇，24．0mg（0．116毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，10．0mg（0．082毫莫耳）4－（二甲胺基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（162）

）吡啶，０．３ｍｌ二氯甲烷反應（室溫℃，１５小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝１５：１，展開２次）精製，得１６．６ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（環辛氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３０（１）所得含１６．５ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（環辛氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．２５ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫４５℃，３０分鐘），反應液以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１５：１，展開２次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１，展開４次））精製，得３．５ｍｇ（２０％，二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９２，２９２８，２８５６，１７４４，１４６８，１２０４，１１２４，１０５２ ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），１．３６（ｄ，Ｊ＝６．７Ｈｚ，３Ｈ），２．５６－２．６６（ｍ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（163）

2．78－2．89（m，1H），
3．89（d，J＝16．3Hz，1H），
4．00（d，J＝16．3Hz，1H），
4．07（q，J＝6．7Hz，1H），
4．19－4．31（m，1H），
4．41－4．50（m，1H），
4．96－5．10（m，1H），
5．02（brs，1H），
5．34（brs，1H），
5．60（brs，1H），
6．10（d，J＝11．7Hz，1H），
6．37（d，J＝11．7Hz，1H）．

MS　m／z：480（M^+-H_2O），69（100％）．

UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例34）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－丁基戊氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣操作，使22．0mg（0．036毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（164）

14.0mg（0.097毫莫耳）壬烷－5－醇，24.0mg（0.116毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，10.0mg（0.082毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0.3ml二氯甲烷反應（室溫，15小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝15：1，展開2次）精製，得17.4mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－丁基戊氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例34（1）所得含16.4mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－丁基戊氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.25ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應，（外溫45℃，30分鐘）反應液以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝15：1，展開2次後，繼而以0.25mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1，展開4次，繼而以0.25mm×1枚，甲苯：乙酸乙酯＝1：1，展開2次後，繼而以0.25mm×1枚，二氯甲烷：乙酸乙酯＝3：1，展開1次）精製，得1.7mg（10%，二步驟）無色油狀標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（165）

IR（neat）：3384，2932，2860，
1746，1444，1370，1204，1124，
1054cm^{-1}.
^{1}H NMRδ：0.77（s，3H），
0.87（t，J＝6.9Hz，3H），
0.88（t，J＝6.9Hz，3H），
1.37（d，J＝6.6Hz，3H），
2.56－2.66（m，1H），
2.78－2.89（m，1H），
3.93（d，J＝16.5Hz，1H），
4.04（d，J＝16.5Hz，1H），
4.08（q，J＝6.6Hz，1H），
4.20－4.30（m，1H），
4.40－4.50（m，1H），
4.96（quint.，J＝6.3Hz，1H），
5.01（brs，1H），
5.34（brs，1H），
5.60（brs，1H），
6.10（d，J＝11.5Hz，1H），
6.38（d，J＝11.5Hz，1H）.
MS m／z：312（M^+-$CH_3CO_2CH(CH_2CH_2CH_2CH_3)_2$），
57（100%）.
UV λ_{max} nm：263。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（166）

（實施例３５）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使１３．０ｍｇ（０．０２１毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，７．０ｍｇ（０．０７９毫莫耳）第三戊醇，７．０ｍｇ（０．０３４毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，３．０ｍｇ（０．０２５毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．２ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝１５：１，展開２次）精製，得９．２ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３５（１）所得含１０．０ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．１５ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（167）

銨四氫呋喃溶液反應（外溫45℃，40分鐘），反應液以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝15：1，展開1次，再以二氯甲烷：乙醇＝10：1，展開1次）精製，得3.6mg（34%，二步驟）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3392，2972，2932，2848，1744，1444，1370，1220，1122，1054 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.77（s，3H），
0.87（t，J＝7.4Hz，3H），
1.36（d，J＝6.5Hz，3H），
1.43（s，6H），
2.55－2.66（m，1H），
2.76－2.87（m，1H），
3.82（d，J＝16.3Hz，1H），
3.94（d，J＝16.3Hz，1H），
4.07（q，J＝6.5Hz，1H），
4.19－4.29（m，1H），
4.39－4.49（m，1H），
5.01（brs，1H），
5.34（brs，1H），
5.60（brs，1H），
6.10（d，J＝11.8Hz，1H），
6.37（d，J＝11.8Hz，1H）.

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（168）

ＭＳ　ｍ／ｚ：３１２（M^+-$CH_3CO_2C(CH_3)_2CH_2CH_3$），７１（１００％）。

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６３。

（實施例３６）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（金剛烷－２－基氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使３０ｍｇ（０．０４８毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，１２ｍｇ（０．０７６８毫莫耳）２－金剛烷醇，１６ｍｇ（０．０７６８毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，６ｍｇ（０．０４８毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，１．０ｍｌ二氯甲烷反應（室溫℃，１４小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝６：１，展開１次）精製，得１５．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（金剛烷－２－基氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３６（１）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（169）

所得含15.0mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（金剛烷－2－基氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，1.0ml四氫呋喃，1.0ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫45℃，1小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1，展開2次）精製，得1.024mg（4%，二步驟）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3325，2927，2850，1626，1576，1448，1122，1045 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.78（s，3H），
2.56－2.67（m，1H），
2.77－2.87（m，1H），
3.92－4.17（m，3H），
4.20－4.30（m，1H），
4.40－4.50（m，1H），
4.98－5.04（m，2H），
5.34（s，1H），
5.62（brs，1H），
6.11（d，J＝11.6Hz，1H），
6.38（d，J＝11.6Hz，1H）.

MS m／z：504（M^+-H_2O），135（100

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 170

％）．

ＵＶ　λ max　ｎｍ：２６３。

（實施例３７）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使２６ｍｇ（０．０４２毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，０．１ｍｌ（０．６９９毫莫耳）２－甲基－２－己醇，１４ｍｇ（０．０６７毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，５ｍｇ（０．０４２毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，１．０ｍｌ四氫呋喃反應（室溫℃，１４小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝６：１，展開１次）精製，得１５．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３７（１）所得含１５．０ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 171）

矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，１．０ｍｌ四氫呋喃，１．０ｍｌ１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫４５℃，１小時），經後處理，所得殘體以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開２次）精製，得１．７８４ｍｇ（９％，２步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３２３，２９２７，２８５２，１７４９，１６２６，１５５８，１４４８，１２５４，１２０９，１１２２，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），
０．９０（ｔ，Ｊ＝７．０Ｈｚ，３Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ，３Ｈ），
２．５５－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７７－２．８８（ｍ，１Ｈ），
３．８２（ｄ，Ｊ＝１６．２Ｈｚ，１Ｈ），
３．９４（ｄ，Ｊ＝１６．２Ｈｚ，１Ｈ），
３．９９－４．１２（ｍ，１Ｈ），
４．２０－４．２９（ｍ，１Ｈ），
４．４１－４．５０（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｓ，１Ｈ），
５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．６０（ｂｒｓ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（172）

6．11（d，J＝11．3Hz，1H），
6．37（d，J＝11．3Hz，1H）．
MS　m／z：468（M^+-H_2O），57（100%）．
UV　λ_{max}　nm：262。

（實施例38）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1，2－三甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使20．5mg（0．033毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，7．5mg（0．073毫莫耳）2，3－二甲基丁烷－2－醇，18．0mg（0．087毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，6．8mg（0．056毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1．0ml二氯甲烷反應（室溫，16小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×3枚，己烷：乙酸乙酯＝15：1，展開1次）精製，得6．6mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1，1

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（173）

，２－三甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３８（１）所得含６．０ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１，２－三甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．１ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫４５℃，２０分鐘），反應液以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝１５：１，展開１次）精製，得１．６ｍｇ（１０％，二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８４，２９７２，２９３２，２８５２，１７４４，１４４４，１３７２，１２１８，１１２４，１０５４ｃｍ$^{-1}$。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），
０．８９（ｄ，Ｊ＝７．２Ｈｚ，６Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．７Ｈｚ，３Ｈ），
１．４１（ｓ，３Ｈ），１．４２（ｓ，３Ｈ），
２５４－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７６－２．８７（ｍ，１Ｈ），
３．８２（ｄ，Ｊ＝１６．５Ｈｚ，１Ｈ），
３．９４（ｄ，Ｊ＝１６．５Ｈｚ，１Ｈ），
４．０７（ｑ，Ｊ＝６．７Ｈｚ，１Ｈ），
４．１８－４．２９（ｍ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（174）

4．41－4．49（m，1H），
5．01（brs，1H），
5．34（brs，1H），
5．59（brs，1H），
6．11（d，J＝11．0Hz，1H），
6．37（d，J＝11．0Hz，1H）．
MS　m／z：387（M^+-$CH(CH_3)_2CH(CH_3)_2$），85（100%），85（100%）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例39）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－乙基環己氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣操作，使27mg（0．044毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，17mg（0．133毫莫耳）1－乙基環己醇，18mg（0．087毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，16mg（0．131毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0．4ml二氯甲烷反應（室溫℃，15小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝5：1，展開1次）精製，得25mg含標記化合

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（175）

物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基環己氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例３９（１）所得含２５ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基環己氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．６６ｍｌ四氫呋喃，０．３３ｍｌ１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫６０℃，１．５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次）精製，得７．１５７ｍｇ（３３％，二步驟）標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８０，２９３１，２８５２，１７４５，１４４８，１２１１，１１２２，１０５３ｃｍ$^{-1}$。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），
０．８２（ｔ，Ｊ＝７．６Ｈｚ，３Ｈ），
１．３７（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），
２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），
２．７８－２．８４（ｍ，１Ｈ），
３．８６（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（176）

3.99（d，J＝16.3Hz，1H），
4.09－4.20（m，1H），
4.20－4.30（m，1H），
4.40－4.49（m，1H），
5.01（brs，1H），
5.34（s，1H），5.60（brs，1H），
6.11（d，J＝11.4Hz，1H），
6.37（d，J＝11.4Hz，1H）.
MS m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2C_8H_{15}$)，69（100%）.
UV λ_{max} nm：264。

（實施例40）
（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－甲基環辛氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使19mg（0.031毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，13mg（0.091毫莫耳）1－甲基環辛醇，13mg（0.063毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，11mg（0.090毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0.3ml二氯甲烷反應（室溫，15小時），經後處理

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（177）

，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得１５ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－甲基環辛氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例４０（１）所得含１５ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－甲基環辛氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．４６ｍｌ四氫呋喃，０．２３ｍｌ１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫６０℃，１．５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次）精製，得５．５２７ｍｇ（３５％，二步驟）無色泡沫狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，２９２７，２８５２，１７４３，１４４８，１３７３，１２０５，１１１５，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），
２．５７－２．６３（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８４（ｍ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（178）

3．81（d，J＝16．3Hz，1H），

3．94（dJ＝16．3Hz，1H），

4．04－4．16（m，1H），

4．20－4．30（m，1H），

4．40－4．49（m，1H），

5．01（brs，1H），

5．34（s，1H），

5．60（brs，1H），

6．11（d，J＝11．2Hz，1H），

6．37（d，J＝11．2Hz，1H）．

MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2C_9H_{17}$)，69（100%）．

UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例41）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－｛4－甲基－1－（3－甲基丁基）戊氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使26mg（0．042毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，0．1g（0．580毫莫耳）2，8－二甲基－5－壬醇，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（179）

14mg（0.067毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，5mg（0.042毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1.0ml二氯甲烷反應（室溫，14小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝6：1，展開1次）精製，得30.0mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－｛4－甲基－1－（3－甲基丁基）戊羰基甲氧基｝－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例41（1）所得含30.0mg　1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－｛4－甲基－1－（3－甲基丁基）戊氧羰基甲氧基｝－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，1.0ml四氫呋喃，0.8ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫50℃，1小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1，展開2次）精製，得8.820mg（39%，二步驟）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：2953，2931，2870，2852，1749，1732，1653，1558，1468，1367，1201，1122，1053 cm^{-1}.

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（180）

^{1}H NMR δ：0.78（s，3H），
0.86（t，J＝6.4Hz，12H），
1.37（d，J＝6.5Hz，3H），
2.54－2.67（m，1H），
2.76－2.90（m，1H），
3.93（d，J＝17.6Hz，1H），
4.04（d，J＝17.6Hz，1H），
4.09（q，J＝6.8Hz，1H），
4.20－4.29（m，1H），
4.41－4.49（m，1H），
4.86－4.98（m，1H），
5.01（s，1H），5.34（s，1H），
5.61（brs，1H），
6.11（d，J＝10.8Hz，1H），
6.38（d，J＝10.8Hz，1H）.
MS m／z：524（M^+-H_2O），57（100％）.
UV λ_{max} nm：264。

（實施例42）
（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1，2，2－四甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（181）

與實施例17（3）一樣操作，使26mg（0.042毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，0.1g（0.861毫莫耳）1，1，2，2－四甲基丙醇，14mg（0.067毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，5mg（0.042毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1.0ml二氯甲烷反應（室溫℃，14小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝6：1，展開1次）精製，得25.0mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1，1，2，2－四甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例42（1）所得含25.0mg　1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1，2，2－四甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，1.0ml四氫呋喃，0.8ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫50℃，1小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1，展開2次）精製，得1.558mg（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（182）

8%，二步驟）標記化合物。

IR（neat）：2960，2929，2850，1747，1724，1371，1120，1053 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.77（s，3H），0.96（s，9H），1.36（d，J＝6.5Hz，3H），2.54－2.66（m，1H），2.75－2.88（m，1H），3.81（d，J＝16.2Hz，1H），3.94（d，J＝16.2Hz，1H），4.08（q，J＝5.9Hz，1H），4.19－4.30（m，1H），4.40－4.49（m，1H），5.02（s，1H），5.34（s，1H），5.60（brs，1H），6.11（d，J＝11.3Hz，1H），6.37（d，J＝11.3Hz，1H）.

MS m／z：387（$M^+ - C_7H_{15}$），57（100%）.

UV λ_{max} nm：264。

（實施例43）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（183）

－２０（Ｓ）－（１－乙基環戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使２２．０ｍｇ（０．０３６毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，１１．３ｍｇ（０．０９９毫莫耳）１－乙基環戊醇，１３．１ｍｇ（０．０６４毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，４．７ｍｇ（０．０３９毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．５ｍｌ二氯甲烷反應（室溫℃，４小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×３枚，己烷：乙酸乙酯＝１５：１，展開１次）精製，得１３．５ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基環戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例４３（１）所得含１２．５ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基環戊氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．２ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫４５℃，２０分鐘），反應液以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（184）

15：1，展開2次）精製，得4.2mg（26%，二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3400，2932，2876，1742，1446，1370，1218，1120，1054cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.77（s，3H），0.85（t，J=7.4Hz，3H），1.36（d，J=6.6Hz，3H），2.55-2.64（m，1H），2.76-2.89（m，1H），3.84（d，J=16.3Hz，1H），3.96（d，J=16.3Hz，1H），4.08（q，J=6.6Hz，1H），4.19-4.30（m，1H），4.40-4.50（m，1H），5.01（brs，1H），5.34（brs，1H），5.59（brs，1H），6.10（d，J=11.1Hz，1H），6.37（d，J=11.1Hz，1H）.

MS m／z：484（M^+），55（1005）.

UV λ_{max} nm：263。

（實施例44）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（185）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－環丙基－１－甲基乙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使５８．４ｍｇ（０．０９５毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，２９ｍｇ（０．２９０毫莫耳）２－環丙基－２－丙醇，３９ｍｇ（０．１８９毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，３５ｍｇ（０．２８６毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．９５ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１５小時），施予後處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝１０：１）精製，得５４ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－環丙基－１－甲基乙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例４４（１）所得含４９ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－環丙基－１－甲基乙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，１．４ｍｌ四氫呋喃，０．７ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 186）

６０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×４枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次，再以０．５ｍｍ×２枚，甲苯：乙酸乙酯＝５：６，展開１次）精製，得３．５６ｍｇ（９％，二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８８，２９７２，２９３１，２８５０，１７４５，１４４２，１３７１，１２２１，１１１９，１０５３ｃｍ$^{-1}$

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．４０－０．４９（ｍ，４Ｈ），
０．７７（ｓ，３Ｈ），
２．２１－２．４５（ｍ，３Ｈ），
２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８４（ｍ，１Ｈ），
３．８１（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），
３．９３（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），
４．０３－４．２２（ｍ，１Ｈ），
４．２０－４．３０（ｍ，１Ｈ），
４．４０－４．５０（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），
５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．６０（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ），
６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：３１２（M^{+}-$HOCH_2CO_2C_6H_{11}$），８３（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（187）

１００％）．

ＵＶ　λ max　ｎｍ：２６４。

（實施例４５）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１，２－三甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使４３．１ｍｇ（０．０７０毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，０．１ｇ（０．８６１毫莫耳）２，４－二甲基－２－戊醇，２３ｍｇ（０．１１２毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，１０ｍｇ（０．０７０毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，１．０ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１４小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝６：１，展開２次）精製，得２８．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１，２－三甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例４５（１）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（188）

所得含28.0mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1，2－三甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，1.0ml四氫呋喃，1.0ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫50℃，1小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝5：5：1，展開1次）再以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，二氯甲烷：甲醇＝20：1展開1次）精製，得2.195mg（7%，二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：2952，2929，1747，1456，1369，1215，1124，1053 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.77（s，3H），
0.93（d，J＝6.5Hz，6H），
1.36（d，J＝6.8Hz，3H），
2.56－2.66（m，1H），
2.77－2.87（m，1H），
3.80（d，J＝16.2Hz，1H），
3.92（d，J＝16.2Hz，1H），
4.07（q，J＝6.2Hz，1H），
4.20－4.30（m，1H），
4.40－4.50（m，1H），
5.02（s，1H），5.34（s，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（189）

5．60（brs，1H），
6．11（d，J＝11．1Hz，1），
6．38（d，J＝11．1Hz，1H）．
MS　m／z：468（M^+-H_2O），57（100％）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例46）
（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－甲基環庚氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯
與實施例17（3）一樣之操作，使29．4mg（0．0488毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，11．3mg（0．088毫莫耳）1－甲基環庚醇，29．0mg（0．141毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，6．9mg（0．056毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0．6ml二氯甲烷反應（室溫，14小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×3枚，己烷：乙酸乙酯＝15：1，展開2次）精製，得10．4mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－甲

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（190）

基環庚氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例46（1）所得含9.3mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－甲基環庚氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.15ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（48℃，20分鐘），反應液以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝15：1，展開2次，再以0.25mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1，展開2次）精製，得3.0mg（14%，二步驟）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3376，2928，2852，1744，1444，1372，1220，1122，1050cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.77（s，3H），
1.36（d，J＝6.5Hz，3H），
2.54－2.65（m，1H），
2.75－2.87（m，1H），
3.83（d，J＝16.5Hz，1H），
3.95（d，J＝16.5Hz，1H），
4.08（q，J＝6.5Hz，1H），
4.19－4.29（m，1H），
4.40－4.49（m，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（191）

5．01（brs，1H），
5．34（brs，1H），
5．60（brs，1H），
6．10（d，J＝12．1Hz，1H），
6．37（d，J＝12．1Hz，1H）．
MS m／z：387（$M^+-C_8H_{15}$），67（100%）．
UV λ_{max} nm：264。

（實施例47）
（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－｛3，3－二甲基－1－（2，2－二甲基丙基）丁氧羰基甲氧基｝－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使30mg（0．049毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，26mg（0．156毫莫耳）2，2，6，6－四甲基－庚烷－4－醇，16mg（0．078毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，6．0mg（0．049毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0．5ml二氯甲烷反應（室溫，2小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×3枚，己烷：乙酸乙酯＝10：1，展開1次）精製，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（192）

得２０．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－｛３，３－二甲基－１－（２，２－二甲基丙基丁氧羰基甲氧基｝－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例４７（１）所得含２０ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－｛３，３－二甲基－１－（２，２－二甲基丙基）丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．５２ｍｌ四氫呋喃，０．２６ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫６０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開２次）精製，得１２．１２２ｍｇ（４５．６％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，２９５２，２８６９，２８５２，１７４７，１７２７，１３６７，１１９１，１１２６，１０５１ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７６（ｓ，３Ｈ），０．９１（ｓ，６Ｈ），０．９２（ｓ，６Ｈ），１．３７（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），２．１７－２．４７（ｍ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（193）

2.55－2.66（m，1H），
2.76－2.88（m，1H），
3.84（d，J＝16.7Hz，1H），
3.96（d，J＝16.5Hz，1H），
4.09（q，J＝6.4Hz，1H），
4.18－4.30（m，1H），
4.41－4.49（m，1H），
5.01（brs，1H），
5.16－5.27（m，1H），
5.34（brs，1H），
5.58（brs，1H），
6.10（d，J＝11.4Hz，1H），
6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS　m／z：527（M^+－Me），57（100%）

.

UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例48）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1，3，3－四甲基丁氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使63.1mg（0.102毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（194）

矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，21.5mg（0.165毫莫耳）2，4，4－三甲基戊烷－2－醇，34.0mg（0.165毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，12.5mg（0.102毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1.5ml二氯甲烷反應（室溫，15小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×4枚，己烷：乙酸乙酯＝15：1，展開2次）精製，得7.7mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1，1，3，3－四甲基丁氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例48（1）所得含7.7mg　1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1，1，3，3－四甲基丁氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.1ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫43℃，30分鐘），反應液以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝15：1，展開1次）精製，得2.0mg（4%，二步驟）無色油狀標記化合物。

IR（neat）：3400，2932，1744，1444，1368，1220，1112，1054

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（195）

cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.77（s，3H），

0.99（s，9H），

1.36（d，J＝6.6Hz，3H），

1.52（s，6H），1.80（s，2H），

2.55－2.66（m，1H），

2.77－2.88（m，1H），

3.79（d，J＝16.3Hz，1H），

3.91（d，J＝16.3Hz，1H），

4.07（q，J＝6.6Hz，1H），

4.19－4.30（m，1H），

4.39－4.50（m，1H），

5.01（brs，1H），

5.34（brs，1H），

5.59（brs，1H），

6.10（d，J＝11.1Hz，1H），

6.37（d，J＝11.1Hz，1H）.

MS m／z：482（M^+-H_2O），57（100%）.

UV λmax nm：263。

（實施例49）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－第三丁基－2，2－二甲基丙氧羰

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 196 ）

基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（3）一樣之操作，使18.7mg（0.030毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，0.5ml 0.1M－2，2，4，4－四甲基戊烷－3－醇二氯甲烷溶液，10.0mg（0.048毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，4.0mg（0.033毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶反應（室溫，17小時）反應液以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝15：1，展開2次）精製，得23.4mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－第三丁基－2，2－二甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例49（1）所得含23.0mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－第三丁基－2，2－二甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.3ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液，反應（外溫42℃，30分鐘），反應液以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（　）

二氯甲烷：乙醇＝１５：１，展開２次）精製，得７．１ｍｇ（４６％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８４，２９３２，１７５０，１４７８，１４４４，１３７０，１２２６，１１２４，１０５４ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），０．９９（ｓ，９Ｈ），１．００（ｓ，９Ｈ），１．３８（ｄ，Ｊ＝６．３Ｈｚ，３Ｈ），２．５４－２．６５（ｍ，１Ｈ），２．７５－２．８８（ｍ，１Ｈ），３．９８（ｄ，Ｊ＝１６．８Ｈｚ，１Ｈ），４．０９（ｄ，Ｊ＝１６．８Ｈｚ，１Ｈ），４．０７－４．１６（ｍ，１Ｈ），４．１６－４．３０（ｍ，１Ｈ），４．３９－４．５０（ｍ，１Ｈ），４．６６（ｓ，１Ｈ），５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），５．３４（ｂｒｓ，１Ｈ），５．６１（ｂｒｓ，１Ｈ），６．１１（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ），６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４９６（$M^{+}-H_2O$），５７（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６４。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

198

五、發明說明（　）

（實施例５０）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１，１－二乙基－２－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（３）一樣之操作，使６００ｍｇ（０．９７毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，３８０ｍｇ（２．９２毫莫耳）３－乙基－２－甲基－３－戊醇，６０２ｍｇ（２．９２毫莫耳）Ｎ，Ｎ´－二環己基碳二醯亞胺，３５７ｍｇ（２．９２毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，９．７ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１５小時，經後處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝２０：１）精製，得４６０ｍｇ粗製物。其中１００ｍｇ以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開１次）精製，得６．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二乙基－２－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例５０（１）所得含６ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

199

五、發明說明（　）

基）－２０（Ｓ）－（１，１－乙基－２－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，１．０ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，１．５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開２次，再以０．２５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開２次）精製，得２．１８９ｍｇ（２．０７％，二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，２９６９，２９３１，２８８３，２８５０，１７４５，１７２７，１４６１，１３７１，１２８８，１２０９，１１２２，１０５２ ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），
０．８３－０．９８（ｍ，１２Ｈ），
１．３７（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），
２．５５－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７６－２．８８（ｍ，１Ｈ），
３．８６（ｄ，Ｊ＝１６．５Ｈｚ，１Ｈ），
３．９９（ｄ，Ｊ＝１６．５Ｈｚ，１Ｈ），
４．０５－４．１６（ｍ，１Ｈ），
４．１９－４．３１（ｍ，１Ｈ），
４．４０－４．５０（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

200

五、發明說明（　）

5．34（brs，1H），

5．59（brs，1H），

6．11（d，J＝11．4Hz，1H），

6．37（d，J＝11．0Hz，1H）．

MS　m／z：387(M^+-C(Et)$_2$(i-Pr))，57（100％）．

UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例51）

（1）製造〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基}氧基〕－N－（2，2－二甲基丙基）乙醯胺

與實施例22（1）一樣操作，使15mg（0．0243毫莫耳）〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基}氧基〕乙酸，11mg（0．126毫莫耳）2，2－二甲基丙胺，23mg（0．120毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽3mg（0．024毫莫耳）1－羥基苯并三唑・1水合物，1．5ml二氯甲烷，反應（室溫，13小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝2：1，展開1次）分離，得14mg含目的化合物之無色油狀混合

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

201

五、發明說明（　）

物。

（２）製造｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－（２，２－二甲基丙基）乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使１３ｍｇ實施例５１（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（２，２－二甲基丙基）乙醯胺之混合物，０．２ｍｌ四氫呋喃，０．２ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５５℃，１小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開１次）精製，得４．１７４ｍｇ（４０％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４２１，２９３１，２８５２，１６７０，１５４１，１３６７，１０５５ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．８０（ｓ，３Ｈ），
０．９３（ｓ，９Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．３Ｈｚ，３Ｈ），
２．２０－２．４５（ｍ，３Ｈ），
２．５５－２．６４（ｍ，１Ｈ），
２．７８－２．９０（ｍ，１Ｈ），
３．０５－３．１５（ｍ，２Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 202）

3．79－4．08（m，3），
4．20－4．30（br，1H），
4．39－4．49（br，1H），
5．01（brs，1H），
5．35（s，1H），
5．61（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．37（d，J＝11．2Hz，1H），
6．70（bs，1H）．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CONHCH_2C(CH_3)_3$)，57（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例52）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－（1－乙基丙基）乙醯胺

與實施例22（3）一樣操作，使15mg（0．0243毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，11mg（0．126毫莫耳）1－乙基丙胺，23mg（0．120毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 203

基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽3mg（0.024毫莫耳）1－羥基苯并三唑・1水合物，1.5ml二氯甲烷，反應（室溫，13小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝2：1，展開1次）分離，得15mg含目的化合物之無色油狀混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基）氧基｝－N－（1－乙基丙基）乙醯胺

與實施例17（4）一樣操作，使14mg實施例52（1）所得含〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－（1－乙基丙基）乙醯胺之混合物，0.2ml四氫呋喃，0.2ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫55℃，1小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝10：1，展開1次）精製，得5.136mg（50%，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

IR（neat）：3401，2964，2931，2875，2850，1662，1533，1458，1107，1057cm^{-1}.

^{1}H　NMRδ：0.80（s，3H），0.90（t，J＝7.3Hz，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 204）

1．35（d，J＝6．3Hz，3H），
2．18－2．47（m，3H），
2．58－2．62（m，1H），
2．79－2．84（m，1H），
3．80－4．08（m，4H），
4．24（brs，1H），
4．39－4．49（br，1H），
5．01（brs，1H），
5．35（s，1H），5．60（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．37－6．38（m，2H）．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CONHCH(C_2H_5)CH_2CH_3$)，58（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例53）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－異丙基－N－甲基乙醯胺

與實施例22（3）一樣操作，使14．2mg（0．023毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，8．4

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 205

mg（0.115毫莫耳）異丙基甲胺，22mg（0.115毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽3.5mg（0.023毫莫耳）1－羥基苯并三唑・1水合物，0.4ml二氯甲烷，烷反應（室溫，13小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝2：1，展開1次）分離，得7mg含目的化合物之無色油狀混合物。

（2）製造｛（1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基）氧基｝－N－異丙基－N－甲基乙醯胺

與實施例17（4）一樣操作，使6mg實施例53（1）所得含〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－異丙基－N－甲基乙醯胺之混合物，0.18ml四氫呋喃，0.09ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫55℃，2小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝10：1，展開1次）精製，得2.330mg（27%，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

IR（neat）：3408，2970，2931，2875，2850，1628，1367，1101，1054cm^{-1}.

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 209）

^{1}H NMR δ：0.77（s，3H），
1.09（d，J＝6.6Hz，3H），
1.13－1.38（m，6H），
2.79（d，J＝6.6Hz，3H），
3.9－4.30（m，5H），
4.39－4.49（br，1H），
5.01（bs，1H），
5.34（s，1H），
5.61（brs，1H），
6.10（d，J＝11.3Hz，1H），
6.37（d，J＝11.3Hz，1H）.
MS m／z：312(M^+-$HOCH_2CON(CH_3)(i\text{-}Pr)$)，58（100%）.
UV λ_{max} nm：264。

（實施例54）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－（1－丙基丁基）乙醯胺

與實施例22（3）一樣操作，使20.0mg（0.03毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，14mg

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 207）

（０．１２毫莫耳）４－庚基胺，２３ｍｇ（０．１２毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽３ｍｇ（０．０２４毫莫耳）１－羥基苯并三唑・１水合物，１．５ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１３小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝２：１，展開２次）分離，得１８ｍｇ含目的化合物之無色油狀混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－（１－丙基丁基）乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使１８ｍｇ實施例５４（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（１－丙基丁基）乙醯胺之混合物，０．５ｍｌ四氫呋喃，０．２５ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５５℃，１．５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開三次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１，展開４次，再以０．５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開２次）精製，得７．０８９ｍｇ（４８．７％，二步驟）無色油狀標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 208

IR（neat）：3401，2956，2931，2871，1666，1533，1440，1106，1054cm^{-1}.

^{1}H NMR δ：0.80（m，3H），0.91（t，J＝6.8Hz，6H），2.18－2.48（m，3H），2.54－2.67（m，1H），2.77－2.89（m，1H），3.80（d，J＝15.2Hz，1H），3.92（d，J＝15.2Hz，1H，3.95－4.07（m，2H），4.19－4.29（m，1H），4.41－4.50（m，1H），5.01（brs，1H），5.35（brs，1H），5.59（brs，1H），6.11（d，J＝11.2Hz，1H），6.30（d，J＝9.4Hz，1H），6.36（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：485（M^{+}），294（100%）.

UV λ_{max} nm：264。

（實施例52）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（209）

基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－（2－乙基丁基）乙醯胺

與實施例22（3）一樣操作，使21.9mg（0.035毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，18mg（0.178毫莫耳）2－乙基丁胺，13mg（0.068毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽5mg（0.033毫莫耳）1－羥基苯并三唑・1水合物，0.4ml二氯甲烷，反應（室溫，5小時），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝3：1，展開1次）分離，得20mg含目的化合物之無色油狀混合物。

（2）製造｛（1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基）氧基｝－N－（2－乙基丁基）乙醯胺

與實施例17（4）一樣操作，使15mg實施例55（1）所得含〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－（2－乙基丁基）乙醯胺之混合物，0.42ml四氫呋喃，0.21ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 210

外溫６０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次）精製，得６．９５４ｍｇ（５５％，二步驟）無色泡沫狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４１９，２９６２，２９２９，２８７５，１６６８，１５４０，１４４６，１１０６，１０５５ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），
０．９０（ｔ，Ｊ＝７．３Ｈｚ，６Ｈ），
２．２－２．４７（ｓ，３Ｈ），
２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８４（ｍ，１Ｈ），
３．１９－３．２７（ｍ，２Ｈ），
３．７７－４．０２（ｍ，３Ｈ），
４．２０－４．３０（ｂｒ，１Ｈ），
４．３９－４．４９（ｂｒ，１Ｈ），
５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），
５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．５９（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．Ｈｚ，１Ｈ），
６．３６（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ），
６．５８（ｂｒｓ，ｑＨ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４７１（Ｍ$^{+}$），１６０（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６３。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 21）

（實施例５６）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｒ）－羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例２５（４）一樣操作，使５．２４ｇ（９．３７毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｒ）－羥基孕甾－５，７，１６－三烯，５００ｍｌ四氫呋喃反應（光照射７小時４５分鐘，熱異構化２５℃，１０天），減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝１０：１）精製，得１．９５ｇ含無色泡沫狀標記化合物之餾份。

（２）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｒ）－（第三丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（１）一樣操作，使５７２ｍｇ實施例５６（１）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｒ）－羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之餾份，１０ｍｌ四氫呋喃，２４６ｍｇ（６．１３８毫莫耳）油性，６０％氫化鈉，２２５ｍｇ（１．０２３毫莫耳）１５－冠－５－醚，１．２０ｇ（６．１４毫莫耳）溴代乙酸第三丁酯反應（加熱回流，５．５小時），施予後處理，以管柱層析（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 212

己烷：乙酸乙酯＝１５：１）精製，得０．９０ｍｇ含目的物之無色油狀標記化合物的餾份。

（３）製造〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｒ）－基｝氧基〕乙酸

與實施例１７（２）一樣反應，使０．９０ｇ實施例５６（２）所得含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｒ）－（第三丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之餾份，１０．２ｍｌ四氫呋喃，１０．２ｍｌ　１Ｍ甲醇鈉甲醇溶液，０．２６ｍｌ水反應（室溫３０分鐘，然後於室溫１０分鐘），經後處理，以管柱層析（二氯甲烷：甲醇＝１５：１）精製，得４８２ｍｇ（１８％，三步驟）含目的物之無色泡沫狀標記化合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．０７（ｓ，６Ｈ），
０．７４（ｓ，３Ｈ），０．８８（ｓ，９Ｈ），
０．８８（ｓ，９Ｈ），
１．３９（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），
２．４０－２．５１（ｍ，２Ｈ），
２．７６－２．８７（ｍ，１Ｈ），
３．９６－４．４２（ｍ，５Ｈ），
４．８７（ｂｒｓ，１Ｈ），
５．１９（ｂｒｓ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 213

5．68（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．23（d，J＝11．2Hz，1H），
6．60－7．80（br，1H）．

（4）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（R）－（1－乙基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例21（1）一樣之操作，使35．3mg〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（R）－基}氧基〕乙酸，15ml（0．170毫莫耳）3－戊醇，22mg（0．115毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲胺基丙基）碳二醯亞・鹽酸鹽，21mg（0．172毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0．6ml二氯甲烷反應（室溫，5小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝10：1，展開1次）精製，得28mg含標記化合物之混合物。

（5）製造1α，3β－二羥基－20（R）－（1－乙基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例56（4）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 214

所得含20mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（R）－（1－乙基丙氧羰基甲氧基）9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.58ml四氫呋喃，0.29ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫60℃，2小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1，展開1次，再以0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝8：8：1，展開1次）精製，得4.302mg（23%，二步驟）無色玻璃狀之標記化合物。

IR（neat）：3392，2968，2933，2879，2850，1749，1371，1286，1203，1126，1055 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.76（s，3H），
0.88（t，J＝7.1Hz，6H），
1.37（d，J＝6.6Hz，3H），
2.21－2.50（m，3H），
2.57－2.62（m，1H），
2.78－2.84（m，1H），
3.96（d，J＝16.3Hz，1H），
4.05（d，J＝16.3Hz，1H），
4.09－4.20（m，1H），
4.20－4.30（m，1H），
4.40－4.49（m，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 219

5．01（brs，1H），5．34（s，1H），
5．65（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．37（d，J＝11．2Hz，1H）．
MS　m／z：458（M^+），133（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例57）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－（2，2，2－三氟化乙基）乙醯胺

與實施例22（3）一樣操作，使36mg（0．058毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，29mg（0．293毫莫耳）2，2，2－三氟乙胺，22mg（0．115毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽9mg（0．047毫莫耳）1－羥基苯并三唑・1水合物，0．58ml二氯甲烷，反應（室溫，10分鐘），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝2：1，展開1次）分離，得38mg含目的化合物之無色油狀混合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 219

（２）製造１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－（２，２，２－三氟化乙基）乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使３３ｍｇ實施例５７（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（２，２，２－三氟化乙基）乙醯胺之混合物，０．９４ｍｌ四氫呋喃，０．４７ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫６５℃，１．５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次）精製，得１７．３０５ｍｇ（７３％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４１５，２９３３，２８５０，１６８２，１５３３，１２７９，１１６３，１１１５，１０５５ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），
２．２１－２．４１（ｍ，３Ｈ），
２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８３（ｍ，１Ｈ），
３．８２－４．０５（ｍ，５Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 217

4．20－4．29（m，1H），
4．39－4．50（m，1H），
5．01（brs，1H），
5．34（s，1H），
5．61（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．36（d，J＝11．2Hz，1H），
6．93（brs，1H）．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CONHCH_2CF_3$)，91（100%）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例58）
（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（環丁氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例21（1）一樣操作，使50mg（0．0811毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，18mg（0．250毫莫耳）環丁醇，31mg（0．162毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽30mg（0．246毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0．8ml二氯甲烷反應（室溫，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 219

２小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得５３ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（環丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例５８（１）所得含５３ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（環丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．７９ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，２．５小時），施予後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開２次，再以０．５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開２次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１展開１次）精製，得１．７１８ｍｇ（５％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４００，２９２９，２８５０，１７５１，１５９７，１２００，１１２４，１０５３ ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），１．３６（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 219

2．21－2．43（m，3H），
2．57－2．62（m，1H），
2．78－2．84（m，1H），
3．87－4．19（m，3H），
4．20－4．30（br，1H），
4．40－4．49（br，1H），
5．01－5．07（m，2H），
5．34（s，1H），
5．61（brs，1H），
6．10（d，J＝11．4Hz，1H），
6．37（d，J＝11．4Hz，1H）．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2C_4H_7$)，55（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例59）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（1－乙基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例21（1）一樣之操作，使53mg（0．086毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，23mg（0．258毫莫耳）3－戊醇，33mg（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 220）

０．１７２毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，３２ｍｇ（０．２５８毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．９ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，２小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得５１ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例５９（１）所得含４５ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．７ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，２．５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次）精製，得１２．１２６ｍｇ（３５％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，２９７０，２９３１，２８７９，２８５０，１７４９，１４５８，１２０５，１１２４，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），

０．８８（ｄｔ，Ｊ＝７．４，２．１Ｈｚ，６Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 22）

1．37（d，J＝6．4Hz，3H），
2．21－2．45（m，3H），
2．57－2．62（m，1H），
2．79－2．84（m，1H），
3．91－4．13（m，3H），
4．20－4．30（br，1H），
4．40－4．50（br，1H），
5．01（brs，1H），5．34（s，1H），
5．61（brs，1H），
6．11（d，J＝11．2Hz，1H），
6．37（d，J＝11．2Hz，1H）．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2CH(C_2H_5)_2$)，71（100%）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例60）
（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（環戊氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯
與實施例21（1）一樣之操作，使65．1mg（0．106毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，30．0mg（0．348毫莫耳）環戊醇，40．0

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 224

mg（0.209毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，40.0mg（0.327毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0.8ml二氯甲烷反應（室溫，1小時30分），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝20：1，展開3次）精製，得50.4mg含標記化合物之混合物。

（2）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（環戊氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例60（1）所得含23.7mg　1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（環戊氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.35ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫47℃，50分鐘），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝20：1，展開3次，再以0.25mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1，展開3次，）精製，得4.1mg（23%，二步驟）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：3392，2932，2872，1746，1440，1370，1208，1122，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 223

1052cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.77（s，3H），

1.36（d，J＝6.6Hz，3H），

2.54－2.65（m，1H），

2.76－2.86（m，1H），

3.89（d，J＝16.2Hz，1H），

4.00（d，J＝16.2Hz，1H），

4.06（q，J＝6.6Hz，1H），

4.20－4.30（m，1H），

4.40－4.50（m，1H），

5.01（brs，1H），

5.19－5.29（m，1H），

5.34（brs，1H），5

5.61（brs，1H），

6.10（d，J＝10.6Hz，1H），

6.37（d，J＝10.6Hz，1H）.

MS m／z：438（$M^{+}-H_2O$），69（100％）.

UV λ_{max} nm：264。

（實施例61）

（1）製造〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（環丙基甲氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 224

與實施例２１（１）一樣之操作，使３１．３ｍｇ（０．０５１毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，１１．０ｍｇ（０．１５３毫莫耳）環丙基甲醇，２０．０ｍｇ（０．１０４毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，２０．０ｍｇ（０．１６４毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．４ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１６小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝２０：１，展開１次，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開１次），精製，得２５．６ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（環丙基甲氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例６１（１）所得含２４．０ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（環丙甲氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．４ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫４７℃，５０分鐘），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開２次，再以０．２５ｍｍ×１枚，己烷

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 225

：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１，展開３次，）精製，得２．１ｍｇ（１０％，二步驟）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８８，２９２８，２８５２，１７５０，１４４６，１３７０，１２０５，１１２２，１０５４ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．２５－０．３３（ｍ，２Ｈ），０．５２－０．６１（ｍ，２Ｈ），０．７８（ｓ，３Ｈ），１．３８（ｄ，Ｊ＝６．７Ｈｚ，３Ｈ），２．５４－２．６５（ｍ，１Ｈ），２．７６－２．８８（ｍ，１Ｈ），３．９６（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），４．０８（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），４．０８（ｑ，Ｊ＝６．７Ｈｚ，１Ｈ），４．１８－４．２８（ｍ，１Ｈ），４．４１－４．４８（ｍ，１Ｈ），５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），５．３４（ｂｒｓ，１Ｈ），５．６２（ｂｒｓ，１Ｈ），６．１０（ｄ，Ｊ＝１０．３Ｈｚ，１Ｈ），６．３７（ｄ，Ｊ＝１０．３Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４４２（Ｍ$^{+}$），５５（１００％）．

ＵＶ　λ$_{max}$　ｎｍ：２６４。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 226

（實施例６２）

（１）製造〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（環己氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例２１（１）一樣之操作，使３１ｍｇ（０．０５０毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，１５ｍｇ（０．１５０毫莫耳）環己醇，１９ｍｇ（０．０９９毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，１８ｍｇ（０．１４８毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，２ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，３天），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得２７ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（環己氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例６２（１）所得含２６ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（環己氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 227

物，０．３７ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，１小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次）精製，得５．２１８ｍｇ（２４％，二步驟）無色泡沫狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９０，２９３３，２８５６，１７４７，１４４８，１２０３，１１２０，１０５３ ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），
１．３７（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），
２．２１－２．４５（ｍ，３Ｈ），
２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８４（ｍ，１Ｈ），
３．８８－４．１２（ｍ，３Ｈ），
４．２０－４．３０（ｂｒ，１Ｈ），
４．４０－４．５０（ｂｒ，１Ｈ），
４．７９－４．９０（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｂｒｓ，２Ｈ），５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．６１（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．４Ｈｚ，１Ｈ），
６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．４Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４７０（Ｍ$^{+}$），５５（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６４。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 229

（實施例６３）

（１）製造１－〔〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙醯基｝六氫吡啶

與實施例２１（１）一樣之操作，使３１ｍｇ（０．０５０毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，１３ｍｇ（０．１５０毫莫耳）六氫吡啶，１９ｍｇ（０．０９９毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，１８ｍｇ（０．１４８毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，２ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，３天），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝１：１，展開１次）精製，得２３ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１－〔〔｛１α，３β－－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙醯基｝六氫吡啶

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例６３（１）所得含２２ｍｇ　１－〔〔１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝－氧基〕乙醯基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A7
B7

五、發明說明（ 229

〕六氫吡啶混合物，０．３２ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，２小時），經後處理，所得殘體以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開１次）精製，得７．４９９ｍｇ（３４％，二步驟）無色泡沫狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８４，２９３３，２８５４，１６３０，１４４６，１２５４，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），

１．３５（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），

２．２０－２．４４（ｍ，３Ｈ），

２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），

２．７９－２．８４（ｍ，１Ｈ），

３．３５－３．６１（ｍ，４Ｈ），

３．９３－４．１４（ｍ，３Ｈ），

４．２０－４．３０（ｂｒ，１Ｈ），

４．４０－４．４９（ｂｒ，１Ｈ），

５．０１（ｂｒｓ，２Ｈ），

５．３４（ｓ，１Ｈ），

５．６０（ｂｒｓ，１Ｈ），

６．１１（ｄ，Ｊ＝１１．４Ｈｚ，１Ｈ），

６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．４Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：３１２（M^{+}-$HOCH_2COC_5H_{10}N$），１４４（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６４。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 230）

（實施例６４）

（１）製造〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（金剛烷－１－基氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例２１（１）一樣之操作，使４０ｍｇ（０．０６５毫莫耳〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，３０ｍｇ（０．１９７毫莫耳）１－金剛烷醇，２５ｍｇ（０．１３０毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，２４ｍｇ（０．１９６毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０６５ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１５小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得１８ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（金剛烷－１－基氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例６４（１）所得含１７ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（金剛烷－１－基氧羰基甲氧基）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 23）

－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．４６ｍｌ四氫呋喃，０．２３ｍｌ１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫６０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次）精製，得７．４７１ｍｇ（２３％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８０，２９１６，２８５２，１７４５，１４５６，１２０９，１１２２，１０５３ ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７７（ｓ，３Ｈ），
１．３６（ｄ，Ｊ＝６．３Ｈｚ，３Ｈ），
２．５７－２．２６（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８４（ｍ，１Ｈ），
３．８２（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），
３．９２（ｄ，Ｊ＝１６．３Ｈｚ，１Ｈ），
４．０４－４．１６（ｍ，１Ｈ），
４．２０－４．３０（ｍ，１Ｈ），
４．４１－４．４９（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．５９（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．０Ｈｚ，１Ｈ），
６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．０Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：５２２（Ｍ$^{+}$），１３５（１００５）．

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 232）

ＵＶ　λｍａｘ　ｎｍ：２６４。

（實施例６５）

（１）製造〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基）甲氧基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例２１（１）一樣之操作，使３４ｍｇ（０．０５５毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，２８ｍｇ（０．２７５毫莫耳）３－甲基－３－戊醇，２１ｍｇ（０．１１０毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，２０ｍｇ（０．１６４毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．５５ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，５小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開１次）精製，得１０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｒ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例６５（１）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 233）

所得含9mg 1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（R）－（1－乙基－1－甲基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0.1ml四氫呋喃，0.2ml 1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫55℃，2小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1，展開1次）精製，得3.102mg（13%，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

IR（neat）：3380，2971，2929，2850，1747，1460，1373，1213，1124，1055 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.76（s，3H），
0.85（t，J＝7.4Hz，6H），
1.25（s，3H），
1.36（d，J＝6.6Hz，3H），
1.39（s，3H），
2.20－2.49（m，3H），
2.57－2.62（m，1H），
2.79－2.84（m，1H），
3.87（d，J＝16.3Hz，1H），
3.95（d，J＝16.3Hz，1H），
4.08－4.16（m，1H），
4.20－4.30（m，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 234

4．40－4．49（m，1H），

5．01（brs，1H），

5．34（s，1H），

5．63（brs，1H），

6．10（d，J＝11．2Hz，1H），

6．37（d，J＝11．2Hz，1H）．

MS m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2C(C_2H_5)_2CH_3$)，85（100%）．

UV λ_{max} nm：265。

（實施例66）

（1）製造〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基}氧基〕－N－甲氧基－N－甲基乙醯胺

於室溫，攪拌15分鐘，13．5mg（0．0219毫莫耳）〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基}氧基〕乙酸，11mg（0．109毫莫耳）N－甲氧基－N－甲胺・鹽酸鹽，21mg（0．110毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，3mg（0．024毫莫耳）1－羥基苯并三唑・1水合物22mg（0．217毫莫耳）三乙胺之混合物。混合物中加

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 235

入檸檬酸水溶液，二氯甲烷，分液後，所得有機層依序以飽和碳酸氫鈉水溶液，以飽和食鹽水洗淨，在無水硫酸鈉上乾燥，過濾，減壓下餾去，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝２：１，展開１次）分離，得１３ｍｇ含目的物之無色油狀混合物。

（２）製造｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－甲氧基－Ｎ－甲基乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使１２ｍｇ實施例６６（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－甲氧基－Ｎ－甲基乙醯胺之混合物，０．３６ｍｌ四氫呋喃，０．１８ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５５℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開１次）精製，得３．８００ｍｇ（４４％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３９９，２９３３，２８５），１６６８，１４３６，１０５２ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０７８（ｓ，３Ｈ），１．３８（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），２．１８－２．４７（ｍ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 239）

2．57－2．62（m，1H），
2．79－2．84（m，1H），
3．18（s，3H），3．66（s，3H），
4．07－4．27（m，4H），
4．39－4．49（m，1H），
5．01（brs，1H），5．34（s，1H），
5．63（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．37（d，J＝11．2Hz，1H）．
MS　m／z：312(M^+-$HOCH_2CON(OCH_3)CH_3$)，91（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例67）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕－N－甲氧基乙醯胺

與實施例66（1）一樣操作，使13．6mg（0．0220毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，9mg（0．108毫莫耳）N－甲氧胺・鹽酸鹽，21mg（0．110毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 237

胺丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，３ｍｇ（０．０２４毫莫耳）１－羥基苯并三唑・１水合物２２ｍｇ（０．２１７毫莫耳）三乙胺，０．８８ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，１５小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝２：１，展開１次）分離，得１２ｍｇ，含目的物之無色油狀混合物。

（２）製造｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－甲氧基乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使１１ｍｇ實施例６７（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－甲氧基乙醯胺之混合物，０．３４ｍｌ四氫呋喃，０．１７ｍｌ１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５５℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開１次）精製，得３．１８９ｍｇ（３８％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８４，２９２９，２８５０，１６７４，１４４１，１１１７，１０５３ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），

１．３４（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 238

2．18－2．46（m，3H），
2．57－2．62（m，1H），
2．79－2．83（m，1H），
3．81（s，3H），
3．81－4．07（m，3H），
4．20－4．30（m，1H），
4．41－4．48（m，1H），
5．01（brs，1H），5．34（s，1H），
5．59（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．36（d，J＝11．2Hz，1H），
8．92（brs，1H）．
MS m／z：312(M^+-$HOCH_2CONHOMe$)，91（100%）．UV λ_{max} nm：264。

（實施例68）

製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（乙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

於氮氣氛下，於室溫，在43．0g（0．07毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸之0．8ml二氯甲烷溶液中加入5mg（0．1毫莫耳）乙醇，17mg（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 239

０．１毫莫耳）氯化２－氯－１，３－二甲基咪唑鎓鹽，１７ｍｇ（０．２１毫莫耳）吡啶，攪拌１５小時。反應液倒入水中，以乙酸乙酯萃取，依序以飽和碳酸氫鈉水溶液，食鹽水，水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥後減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝１０：１，展開１次）精製，得２８．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（乙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例６８（１）所得含２８ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－乙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，２．０ｍｌ四氫呋喃，０．６５ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開２次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１，展開３次）精製，得３．１６７ｍｇ（１０．９％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３４７，２９７５，２９３１，２８４８，１７５１，１４４２，１３６９，１２８８，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 240）

1203，1124，1052cm^{-1}.

^{1}H NMRδ：0.78（s，3H），

1.27（t，J＝7.3Hz，3H），

1.37（d，J＝6.3Hz，3H），

2.19－2.48（m，3H），

2.55－2.66（m，1H），

2.78－2.87（m，1H），

3.93（d，J＝16.2Hz，1H），

4.05（d，J＝16.2Hz，1H），

4.03－4.12（m，1H），

4.15－4.30（m，3H），

4.39－4.50（m，1H），

5.01（brs，1H），

5.34（brs，1H），

5.62（brs，1H），

6.11（d，J＝11.5Hz，1H），

6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：416（M^{+}），133（100%）.

UV λ_{max} nm：264。

（實施例69）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（異丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 24）

與實施例６８（１）一樣之操作，使６４１ｍｇ（１．０３９毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，０．６４１（９．３５０毫莫耳）異丙醇，２６３ｍｇ（１．５５８毫莫耳）氯化２－氯－１，３－二甲基咪唑鎓鹽，２６０μｌ（３．１１７毫莫耳）吡啶，１０ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，２小時），施予後處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝１０：１）精製，得６６９ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（異丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例６９（１）所得含６６９ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（異丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，５．０ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，３小時），經後處理，所得殘渣以管柱層析（二氯甲烷：甲醇＝１０：１）精製，得含２４６ｍｇ　１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（異丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯－５，７，１０（１９），１６－四烯－之混合物，與１３７ｍｇ（３３％，二步驟

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 242 ）

）無色油狀之〔｛１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基乙酸。繼而以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×８枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開１次）精製含１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（異丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，得１６９ｍｇ（３７％，二步驟），無色油狀之１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（異丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯。此化合物係與實施例１５所得化合物之ＩＲ，ＭＡＳＳ，^{1}Ｈ　ＮＭＲ，ＵＶ一樣。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），

１．３９（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ，３Ｈ），

２．５３－２．６５（ｍ，１Ｈ），

２．７５－２．８７（ｍ，１Ｈ），

３．９２（ｄ，Ｊ＝１．６５Ｈｚ，１Ｈ），

４．０３－４．１６（ｍ，２Ｈ），

４．２１－４．２９（ｍ，１Ｈ），

４．４１－４．５０（ｍ，１Ｈ），

５．０１（ｓ，１Ｈ），５．３４（ｓ，１Ｈ），

５．６４（ｂｒｓ，１Ｈ），

６．１１（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ），

６．３６（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：３８８（M^{+}），９１（１００％）．

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 243

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６４。

（實施例７０）

（１）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（２－甲基丙基）乙醯胺

與實施例６８（１）一樣操作，使６０ｍｇ（０．０９７毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，０．１ｍｌ（０．９７０毫莫耳）２－甲基丙胺，２５ｍｇ（０．１４６毫莫耳）氯化２－氯－１，３－二甲基咪唑鎓鹽，８０μｌ（０．９７０毫莫耳）吡啶，１．０ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開１次）精製，得１０．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造〔｛１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（２－甲基丙基）乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使１０ｍｇ實施例７０（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 244

矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（２－甲基丙基）乙醯胺之混合物，１．０ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫４０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１）精製，得０．８５９ｍｇ（２％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４２１，２９５６，２８５０，１６６８，１５４１，１４３７，１３６９，１１０７，１０５５ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），
０．９３（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ，６Ｈ），
１．３５（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ，３Ｈ），
２．５０－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７４－２．８８（ｍ，１Ｈ），
３．０２－３．２０（ｍ，Ｈ），
３．６４－４．０６（ｍ，３Ｈ），
４．１３－４．３０（ｍ，１Ｈ），
４．３４－４．４９（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｓ，１Ｈ），５．３５（ｓ，１Ｈ），
５．６０（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１０．８Ｈｚ，１Ｈ），
６．３６（ｄ，Ｊ＝１０．８Ｈｚ，１Ｈ），
６．５８－６．７１（ｍ，１Ｈ），．

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 249

ＭＳ　ｍ／ｚ：４２５（M^+-H_2O），５７（１００％）．

ＵＶ　λ_{max}　ｎｍ：２６３。

（實施例７１）

（１）製造〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－異丙基乙醯胺

與實施例６８（１）一樣操作，使６０ｍｇ（０．０９７毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，０．１ｍｌ（０．９７０毫莫耳）異丙基胺，２５ｍｇ氯化２－氯－１，３－二甲基咪唑鎓鹽，８０μｌ（０．９７０毫莫耳）吡啶，１．０ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，２小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次）精製，得４４．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造〔｛１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－異丙基乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使４４ｍｇ實施例

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 246

７１（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－異丙基乙醯胺之混合物，１．０ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫４０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開１次）精製，得１３．１７ｍｇ（３１％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４０６，２９７２，２９３１，２８５０，１６６２，１５３１，１４４６，１３６７，１１０９，１０５５ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），
１．１７（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ，６Ｈ），
１．３５（ｄ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，３Ｈ），
２．４８－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７４－２．８７（ｍ，１Ｈ），
３．５８－４．２９（ｍ，４Ｈ），
４．３８－４．５０（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｓ，１Ｈ），５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．５９（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．１Ｈｚ，１Ｈ），
６．２５－６．４９（ｍ，２Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４２９（Ｍ$^{+}$），１１８（１００％）．

ＵＶ　λ$_{max}$　ｎｍ：２６４。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 247

（實施例７２）

（１）製造〔１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基〕氧基乙醯胺

於氮氣氛下冷卻１５．０ｍｇ（０．０２４毫莫耳）〔〔１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基〕氧基〕乙酸之０．６四氫呋喃溶液爲０℃，加入１８．３ｍｇ（０．１８毫莫耳）三乙胺，１５．６ｍｇ（０．１４毫莫耳）氯代甲酸乙酯，攪拌３０分鐘後，以氨氣使其起泡，同時再攪拌２０分鐘。過濾反應液，減壓下餾去溶媒後，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：甲醇＝１０：１，展開１次）精製，得１４．５ｍｇ含目的物之無色油狀混合物。

（２）製造〔〔１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使１４．５ｍｇ實施例７２（１）所得含〔〔１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基〕氧基乙醯胺之混合物，０．５ｍｌ四氫呋喃，０．２４ｍｌ　１Ｍ氟化四

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 248

正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，２小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．２５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：甲醇＝１０：１，展開３次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：２，展開２次）精製，得５．２４９ｍｇ（５６．４％，二步驟）無色油狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３５３，２９６０，２９３１，２８７３，１７２７，１６８１，１４５７，１２８８，１１１８，１０５６ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），

１．３５（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），

２．１８－２．４７（ｍ，３Ｈ），

２．５５－２．６６（ｍ，１Ｈ），

２．７６－２．８８（ｍ，１Ｈ），

３．７８（ｄ，Ｊ＝１５．５Ｈｚ，１Ｈ），

３．９６（ｄ，Ｊ＝１５，１Ｈ），

３．９６－４．０６（ｍ，１Ｈ），

４．１９－４．３０（ｍ，１Ｈ），

４．４０－４．４９（ｍ，１Ｈ），

５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），

５．３４（ｂｒｓ，１Ｈ），

５．５２（ｂｒｓ，１Ｈ），

５．６１（ｂｒｓ，１Ｈ），

６．１１（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 249

6．36（d，J＝11．2Hz，1H），
6．56（brs，1H）．
MS　m／z：387（M^+），312（100%）．
UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例73）

（1）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－三氟甲基－2，2，2－三氟乙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例21（1）一樣之操作，使9．6mg（0．025毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，420ml（2．5毫莫耳）1，1，1，3，3，3－六氟－2－丙醇，19mg（0．10毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺基丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，12mg（0．10毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0．25ml二氯甲烷反應（室溫，4小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯＝1：3，展開2次）精製，得2．867mg含無色玻璃狀標記化合物。

IR（neat）：3360，2931，2850，1803，1386，1290，1234，1203，1113cm^{-1}．

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 250

^{1}H NMRδ：0.77（s，3H），
1.38（d，J＝6.6Hz，3H），
2.20－2.41（m，3H），
2.57－2.62（m，1H）
2.79－2.84（m，1H），
4.05－4.30（m，4H），
4.39－4.49（br，1H），
5.01（brs，1H），5.34（s，1H），
5.63（brs，1H），
5.75－5.85（m，1H），
6.11（d，J＝11.4Hz，1H），
6.37（d，J＝11.4Hz，1H）.
MS m／z：312(M^+-$HOCH_2CO_2CH(CF_3)_2$)，83（100%）.
UV λ_{max} nm：264。

（實施例74）

製造1α，3β－二羥基－20（S）－（異丙硫羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例21（1）一樣之操作，使15mg（0.0386毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 251）

３６μｌ（０．３８６毫莫耳）２－丙烷硫醇，７４ｍｇ（０．３８６毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺基丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，４７ｍｇ（０．３８６毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．５ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，２小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開１次）精製，得１．１５７ｍｇ，無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３５６，２９２７，２８５０，１６８２，１４４２，１３６７，１２５４，１１２８，１０５１ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７９（ｓ，３Ｈ），
１．４０（ｄ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，３Ｈ），
２．５４－２．６５（ｍ，１Ｈ），
２．７２－２．８８（ｍ，１Ｈ），
３．５５－３．７２（ｍ，１Ｈ），
３．８４－４．１３（ｍ，３Ｈ），
４．１７－４．３０（ｍ，１Ｈ），
４．３７－４．５０（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｓ，１Ｈ），５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．６３（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．１Ｈｚ，１Ｈ），
６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．１Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４２８（Ｍ$^{+}$－Ｈ$_{2}$Ｏ），５５（１００％

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 252）

）．

ＵＶ　λｍａｘ　ｎｍ：２６３。

（實施例７５）

製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（第三丁硫羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例２１（１）一樣之操作，使１５ｍｇ（０．０３８６毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸，４４μｌ（０．３８６毫莫耳）２－甲基－２－丙烷硫醇，７４ｍｇ（０．３８６毫莫耳）１－乙基－３－（３－二甲基胺基丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，４７ｍｇ（０．３８６毫莫耳）４－（二甲胺基）吡啶，０．５ｍｌ二氯甲烷反應（室溫，２小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝５：５：１，展開１次），再以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×１枚，甲苯：乙酸乙酯＝１：１，展開１次）精製，得０．２３６ｍｇ無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：２９２７，２８５２，１６７６，１４５６，１３６３，１１２６，１０５１ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．７８（ｓ，３Ｈ），

１．３９（ｄ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 253）

2．52－2．66（m，1H），
2．74－2．88（m，1H），
3．84（d，J＝15．9Hz，1H），
3．93－4．08（m，2H），
4．19－4．29（m，1H），
4．37－4．49（m，1H），
5．01（s，1H），5．34（s，1H），
5．62（brs，1H），
6．11（d，J＝11．6Hz，1H），
6．37（d，J＝11．6Hz，1H）．
MS　m／z：422（M^+-H_2O），57（100％）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例76）

（1）製造乙酸〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）孕甾－5，7－二烯－20（S）－基｝氧基〕第三丁酯

與實施例17（1）一樣操作，使150mg（0．267毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－羥基孕甾－5，7－二烯，2．7ml四氫呋喃，65mg（1．625毫莫耳）油性，60％氫化鈉，16mg（0．268毫莫耳）15－冠－5－醚，316mg（1．62毫莫耳）溴代乙酸

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 254）

第三丁酯反應（加熱回流，１７小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×５枚，己烷：乙酸乙酯＝５：１，展開１次，再以０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝７：１，展開２次）分離，得３０ｍｇ（１７％）無色泡沫狀之標記化合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．０５（ｓ，３Ｈ），
０．０６（ｓ，６Ｈ），０．１１（ｓ，３Ｈ），
０．６１（ｓ，３Ｈ），０．８９（ｓ，１８Ｈ），
１．２０（ｄ，Ｊ＝５．９Ｈｚ，３Ｈ），
１．４８（ｓ，９Ｈ），
２．７３－２．８５（ｍ，１Ｈ），
３．３２－３．４６（ｍ，１Ｈ），
３．６４－４．１３（ｍ，４Ｈ），
５．２９－５．３８（ｂｒ，１Ｈ），
５．５５－５．６１（ｂｒ，１Ｈ）．

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－三烯

與實施例４（３）一樣操作，使１１０ｍｇ（０．２６７毫莫耳）〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）孕甾－５，７－二烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕乙酸第三丁酯，２００ｍｌ四氫呋喃反應（光照射６分１５秒，加熱回流２小時）後，餾去溶媒。所得殘渣中

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 259）

加入5ml四氫呋喃2.31g　70%氫化氫一吡啶，與實施例8（3）一樣操作反應（室溫，30分鐘），經後處理，以分取用薄層層析（0.5mm×3枚，二氯甲烷：乙醇＝10；1，展開1次，再以0.5mm×2枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1，展開2次）分離，得6.252mg（9%）無色泡沫狀標記化合物。

IR（neat）：3380，2929，2875，1749，1369，1223，1128，1055 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.54（s，3H），
1.18（d，J＝6.1Hz，3H），
1.47（s，9H），
2.31（dd，J＝13.4，6.4Hz，1H），
2.57－2.63（m，1H），
2.80－2.86（m，1H），
3.31－3.41（m，1H），
3.90（d，J＝16.0Hz，1H），
3.98（d，J＝16.0Hz，1H），
4.21－4.30（br，1H），
4.40－4.49（br，1H），
4.99（brs，1H），5.33（s，1H），
6.03（d，J＝11.4Hz，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 259

6．36（d，J＝11．4Hz，1H）．

MS　m／z：446（M^+），57（100%）．

UV　λ_{max}　nm：264。

（實施例77）

（1）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）孕甾－5，7－二烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸

在9mg（0．013毫莫耳）〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－5，7－二烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸第三丁酯之0．13ml四氫呋喃溶液中，加入0．13ml　1M甲醇鈉甲醇溶液於室溫攪拌20分鐘，再加入0．26ml水，於室溫攪拌30分鐘。以乙酸乙酯稀釋反應液，以飽和磷酸二氫鈉水溶液洗淨，以無水硫酸鈉乾燥減壓下餾去溶媒，6mg（73%）無色固體之標記化合物。

^{1}H　NMRδ：0．05（s，3H），

0．07（s，6H），0．11（s，3H），

0．61（s，3H），0．88（s，9H），

0．89（s，9H），

2．26－2．42（m，2H），

2．74－2．85（m，1H），

3．40－3．55（m，1H），

3．65－3．73（br，1H），

3．91－4．21（m，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 257）

5．31－5．37（br，1H），
5．54－5．61（m，1H）．

（2）製造〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）孕甾－5，7－二烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸1－乙基丙酯

與實施例17（3）一樣之操作，使91mg（0．147毫莫耳〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－閉聯孕甾－5，7－二烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，39mg（0．443毫莫耳）3－戊醇，61mg（0．296毫莫耳）N，N´－二環己基碳二醯亞胺，54mg（0．443毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，1．5ml二氯甲烷反應（室溫℃，15小時，經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×3枚，己烷：乙酸乙酯＝5：1，展開1次）精製得37mg（37％）無色油狀標記化合物。

^{1}H NMR δ：0．05（s，3H），
0．06（s，6H），0．11（s，3H），
0．61（s，3H），0．89（s18H），
1．21（d，J＝5．9Hz，3H），
2．29－2．41（m，2H），
2．73－2．85（m，1H），
3．35－3．48（m，1H），
3．66－3．73（br，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 258）

3．94－4．16（m，3H），
4．78－4．91（m，1H），
5．30－5．37（br，1H），
5．54－5．63（m，1H）．

（3）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（1－乙基丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯

與實施例4（3）一樣操作，使35mg（0．0511毫莫耳）〔{（1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）孕甾－5，7－二烯－20（S）－基}氧基〕乙酸1－乙基丙酯，200ml四氫呋喃反應（光照射4分45秒，加熱回流2小時）後，餾去溶媒。所得殘渣中加入2ml四氫呋喃，0．51g　70％氟化氫－吡啶，與實施例8（3）一樣反應（室溫，1小時），經後處理，以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，二氯甲烷：乙醇＝10：10），展開1次，再以0．5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：10：1，展開1次）精製，得2．506mg（11％）無色玻璃狀之標記化合物。

IR（neat）：3390，2931，2877，1751，1458，1375，1286，1203，1055cm^{-1}．

^1H　NMR δ：0．54（s，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（259）

0．88（t，J＝7．4Hz，6H），
1．20－（d，J＝6．1Hz，3H），
2．31（dd，J＝13．4，6．4Hz，1H），
2．57－2．63（m，1H），
2．80－2．86（m，1H），
3．35－3．43（m，1H），
4．02（d，J＝16．2Hz，1H），
4．10（d，J＝16．2Hz，1H），
4．21－4．30（br，1H），
4．40－4．49（br，1H），
4．79－4．88（m，1H），
4．99（brs，1H），5．33（s，1H），
6．03（d，J＝11．4Hz，1H），
6．36（d，J＝11．4Hz，1H）．
MS　m／z：460（M^+），55（100%）．
UV　λ_{max}　nm：265。

（實施例78）

（1）製造〔{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基}氧基〕－N－（第三丁基）乙醯胺

與實施例17（1）一樣操作，使41mg（0．073毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 260）

烷氧基）－２０（Ｓ）－羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，０．７ｍｌ四氫呋喃，１８ｍｇ（０．４４毫莫耳）油性，６０％氫化鈉，１６ｍｇ（０．０７３毫莫耳）１５－冠－５－醚，８５ｍｇ（０．４４毫莫耳）２－溴－Ｎ－（第三丁基）乙醯胺反應（加熱回流，６小時），經後處理，以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×３枚，只用二氯甲烷，展開１次）分離，得３３ｍｇ含目的物之淺黃色油狀混合物。

（２）製造｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－（第三丁基）乙醯胺

與實施例１７（４）一樣操作，使３１ｍｇ實施例７８（１）所得含〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕－Ｎ－（第三丁基）乙醯胺之混合物，０．５ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫６０℃，１小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開１次）精製，得１０．０２８ｍｇ（３３％，二步驟）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４００，２９６８，２９３１，１６６２，１５３３，１３６５，１１０３，１０５７

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 261）

cm^{-1}.

^{1}H NMR δ：0.75（s，3H），
1.37（s，9H），
2.20－2.44（m，3H），
2.57－2.62（m，1H），
2.79－2.84（m，1H），
3.79（s，2H），
4.02－4.15（m，1H），
4.21－4.45（m，1H），
4.40－4.49（m，1H），
5.00（brs，1H），5.34（s，1H），
5.64（brs，1H），
6.11（d，J＝11.4Hz，1H），
6.36（d，J＝11.4Hz，1H），
6.46（brs，1H）.
MS m／z：443（M^{+}），57（100%）.
UV λ_{max} nm：263。

（實施例79）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（甲氧羰基丙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（1）一樣之操作，使147.4mg（0.264毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（262）

矽烷氧基）－２０（Ｓ）－羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，１１２．０ｍｇ（２．８００毫莫耳）油性６０％氫化鈉，５８０．０ｍｇ（２．６３３毫莫耳）１５－冠－５－醚，３４６．０ｍｇ（１．５２３毫莫耳）４－溴－１，１，１－三甲氧基丁烷，０．５ｍｌ四氫呋喃反應（外溫６８℃，１７小時３０分），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝１５：１，展開１次，再以０．５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯＝２０：１，展開１次）精製，得４３．０ｍｇ含標記化合物之混合物。

（２）製造４－〔｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基｝氧基〕丁酸

與實施例１７（２）一樣操作，使２１．８ｍｇ（０．０３３毫莫耳）含１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－甲氧羰基丙氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．２ｍｌ　２Ｍ氫氧化鈉水溶液，０．２ｍｌ甲醇，０．５ｍｌ四氫呋喃反應（室溫，１６小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．２５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝３０：１，展開２次），精，得６．９ｍｇ（４９％）無色油狀之標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（263）

IR（neat）：2936，1712，1462，1362，1252，1214，1166，1080 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.06（s，6H），0.07（s，3H），0.76（s，3H），0.88（s，18H），1.30（d，J＝6.3Hz，3H），2.16－2.28（m，2H），2.34－2.55（m，2H），2.75－2.87（m，1H），3.25－3.39（m，1H），3.44－3.56（m，1H），3.87－3.98（m，1H），4.14－4.25（m，1H），4.35－4.40（m，1H），4.88（brs，1H），5.20（brs，1H），5.57（brs，1H），6.10（d，J＝11.0Hz，1H），6.23（d，J＝11.0Hz，1H）.

UV λ_{max} nm：263。

（3）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（第三丁氧羰基丙氧基）－9，10－閉

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（264）

聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例21（1）一樣操作，使7.5mg（0.012毫莫耳）4－〔｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基｝氧基〕乙酸，288.0mg（3.886毫莫耳）第三丁基醇，70.0mg（0.365毫莫耳）1－乙基－3－（3－二甲基胺基丙基）碳二醯亞胺・鹽酸鹽，71.0mg（0.581毫莫耳）4－（二甲胺基）吡啶，0.05ml二氯甲烷反應（室溫，30分鐘），反應液以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝15：1，展開2次，二氯甲烷：乙醇＝10：1，展開2次）精製，得3.5mg（43%）無色油狀標記化合物，回收2.1mg（28%）原料。

IR（neat）：2952，2932，2856，1732，1462，1366，1254，1156，1088cm^{-1}.

^1H NMRδ：0.06（s，6H），0.07（s，6H），0.76（s，3H），0.87（s，9H），0.88（s，9H），1.28（d，J＝6.6Hz，3H），1.44（s，9H），2.76－2.86（m，1H），3.20－3.34（m，1H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（265）

3．34－3．48（m，1H），
3．86（q，J＝6．6Hz，1H），
4．15－4．26（m，1H），
4．34－4．42（m，1H），
4．88（brs，1H），
5．18（brs，1H），
5．55（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．35（d，J＝11．2Hz，1H）．
MS　m／z：700（M^+），73（100%）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（4）製造1α，3β－二羥基－20（S）－（第三丁氧羰基丙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例17（4）一樣操作，使實施例79（3）所得含1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－20（S）－（第三丁氧羰基丙氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之混合物，0．1ml　1M氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫43℃，20分鐘）反應液以分取用薄層層析（0．25mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝15：1，展開2次）精製，得1．1mg（10%，二步驟）無色油狀標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（266）

IR（neat）：3388，2928，2852，1728，1446，1368，1252，1156，1106，1058 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.77（s，3H），1.28（d，J＝6.6Hz，3H），1.44（s，9H），2.30（t，J＝7.3Hz，2），2.56－2.65（m，1H），2.78－2.88（m，1H），3.22－3.33（m，1H），3.35－3.48（m，1H），4.19－4.30（m，1H），4.40－4.50（m，1H），5.01（brs，1H），5.34（brs，1H），5.55（brs，1H），6.10（d，J＝11.3Hz，1H），6.37（d，J＝11.3Hz，1H）.

MS m／z：472（M^+），57（100%）.

UV λ_{max} nm：263。

（實施例80）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－甲基雄甾－5，7，17－三烯4－苯基－1，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（267）

2，4－三唑啉－3，5－二酮加成物

在70.0g（99毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－氧雜雄甾－5，7－二烯4－苯基－1，2，4－三唑啉－3，5－二酮加成體之300ml四氫呋喃溶液中加入14.50g（129毫莫耳）第丁醇鉀，再加入46.05g（129毫莫耳）溴化甲基三苯鏻後，加熱回流2小時。冷卻反應混合物爲室溫，加入乙酸乙酯及食鹽水予以分液，以無水硫酸鎂乾燥有機層，減壓下餾去溶媒。所得殘渣中加入250ml乙腈，於室溫攪拌30分鐘後濾取。所得固體再次以乙腈洗淨後乾燥，得61.78g（89%）無色固體之標記化合物．

^{1}H NMR δ：0.06（s，3H），
0.08（s，3H），0.09（s，3H），
0.13（s，3H），0.87（s，9H），
0.89（s，9H），
2.35－2.72（m，5H），
3.23－3.30（m，1H），
3.85（brs，1H），
4.70（s，2H），
4.70－4.83（m，1H），
6.23（d，J＝7.9Hz，1H），
6.39（d，J＝7.9Hz，1H），
7.23－7.36（m，5H）．

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（268）

（２）製造１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１６β－羥基－１７－甲基雄甾－５，７，１７－三烯

在４．８７ｇ（４３．９毫莫耳）二氧化硒之３００ｍｌ二氯甲烷懸濁液中，加入２５ｍｌ　７０％第三丁基過氧化氫之７０％水溶液，於室溫攪拌２０分鐘。加入６１．７５ｇ（８７．７毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１７－甲基雄甾－５，７，１７－三烯４－苯基－１，２，４－三唑啉－３，５－二酮加成物之３００ｍｌ二氯甲烷溶液，於３０℃攪拌１５小時。反應混合物以２Ｍ氫氧化鈉水溶液，再以水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥，減壓下餾去溶媒。所得殘渣以管柱層析（己烷：二氯甲烷：丙酮＝５：５：１）精製，得４１．７３ｇ（１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１６羥基－１７－甲基雄甾－５，７，１７－三烯４－苯基－１，２，４－三唑啉－３，５－二酮加成物。在其中加入８１０ｍｌ　１，３－二甲基－２－咪唑啶酮，於１６０℃攪拌５０分鐘。冷卻反應混合物爲室溫後，加入乙酸乙酯及食鹽水予以分液。以飽和食鹽水洗淨二次有機層以無水硫酸鈉乾燥，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝９：１）得１２．３０ｇ（３９％，二步驟）淺黃色固體之標記化合物及１４．３５ｇ（４５％，二步驟）淺黃色泡沫狀之１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１６α－羥基－１７－甲基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 269）

雄甾－5，7，17－三烯。

1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－17－甲基雄甾－5，7，17－三烯

^{1}H NMRδ：0.05（s，3H），
0.06（s，3H），0.07（s，3H），
0.11（s，3H），0.87（s，9H），
0.88（s，9H），0.92（s，3H），
0.94（s，3H），
2.78－2.88（m，1H），
3.71（brs，1H），
4.00－4.15（m，1H），
4.60（brs，1H），
4.94（d，J＝1.7Hz，1H），
5.09（d，J＝1.3Hz，1H），
5.36－5.39（m，1H），
5.59（d，J＝5.6Hz，1H）.

1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16α－羥基－17－甲基雄甾－5，7，17－三烯

^{1}H NMRδ：0.06（s，3H），
0.07（s，6H），0.11（s，3H），
0.74（s，3H），0.88（s，9H），
0.89（s，9H），0.92（s，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（270）

2．80－2．91（m，1H），
3．68－3．75（br，1H），
3．98－4．14（m，1H），
4．67－4．76（m，1H），
4．93（brs，1H），
5．11（brs，1H），
5·33－5．39（m，1H），
5．56－5．62（m，1H）．

（3）製造｛1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）｝－16β－羥基－17－甲基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例4（3）一樣操作，使2．00g（3．67毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－17－甲基雄甾－5，7，17－三烯，650ml乙醇反應（光照射2．5小時，加熱回流2小時），經後處理，以管柱層析（己烷：二氯甲烷＝2：3，然後，以己烷：乙酸乙酯＝9：1），及以分取用薄層層析（0．5mm×枚，己烷：乙酸乙酯＝9：1，展開三次）精製，得0．40g含無色泡沫狀標記化合物之餾份。

（4）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－甲基－16－氧基－9，10－閉聯孕甾－5，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（271）

7，10（19），16－四烯

在400mg實施例80（3）所得含1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－17－甲基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯之餾份之20ml二氯甲烷溶液中加入2g分子篩4A，超音波照射1分鐘。反應混合物中加入2.40g二氧化錳，於室溫攪拌10分鐘。過濾不溶物後，減壓下餾去溶媒，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝9：1）精製，得342mg含標記化合物之餾份。

（5）17β－乙醯基硫甲基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16－氧基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

在340mg實施例80（4）所得含1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－17－甲基－16－氧基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），17－四烯餾份之5ml二氯甲烷溶液中，加入0.6ml吡啶，以氬取代。在其中加入480mg（6.3毫莫耳）硫代乙酸，於室溫攪拌10分鐘後減壓下餾去溶媒。所得殘渣以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝10：1）精製，得286mg含標記化合物之餾份。

（6）17β－乙醯基硫甲基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－9，10－閉聯孕

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（272）

甾－5，7，10（19）－三烯

在285mg實施例80（5）所得含17β－乙醯基硫甲基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16－氧基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯餾份的15ml四氫呋喃溶液中，加入0.92ml　1M氫化三第三丁氧基鋁鋰四氫呋喃溶液，於室溫攪拌30分鐘。反應混合物中加入50ml己烷，0.5ml飽和氯化銨水溶液，攪拌30分鐘後過濾不溶，減壓下濃縮濾液以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝9：1）精製，得220mg含標記化合物之餾份。

（7）17β－乙醯基硫甲基－1α，3β，16β－三羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯

與實施例6（3）一樣，使220mg實施例80（6）所得含17β－乙醯基硫甲基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯餾份，1.5g Amberlist　15，3ml甲醇，3ml四氫呋喃反應（室溫，2小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，乙酸乙酯，展開1次）精製，得13mg（66%，五步驟）無色玻璃狀標記化合物。

^{1}H　NMR δ：0.71（s，3H），

2.36（s，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（273）

2.54－2.66（m，1H），
2.80－2.94（m，2H），
3.07－3.22（m，1H），
4.05－4.47（m，4H），
4.99（brs，1H），
5.32（brs，1H），
6.04（d，J＝11.5Hz，1H），
6.36（d，J＝11.5Hz，1H）.

（8）製造17β－第三丁氧羰基甲硫基甲基－1α，3β－16β－三羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯

與實施例16（2）一樣之操作，使5mg（0.013毫莫耳）17β－乙醯基硫甲基－1α，3β－16β－三羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯，0.13ml 1M氫氧化鉀甲醇溶液，76mg（0.390毫莫耳）溴代乙酸第三丁酯，2ml四氫呋喃反應（室溫，16小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×2枚，二氯甲烷：乙腈＝3：2，展開1次）精製，得3.056mg（52%）無色玻璃狀之標記化合物。

IR（neat）：3400，2933，2838，1716，1296，1257，1053cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.67（s，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（274）

1.48（s，9H），

2.57－2.92（m，5H），

3.16（d，J＝15.5Hz，1H），

3.24（d，J＝15.5Hz，1H），

4.20－4.30（m，1H），

4.38－4.60（m，2H），

4.99（brs，1H），5.31（s，1H），

6.05（d，J＝11.2Hz，1H），

6.36（d，J＝11.2Hz，1H）．

MS　m／z：464（M^+），57（100%）．

UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例81）

（1）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16－氧基－閉聯孕甾－5，7，10（19），（17E）－四烯

與實施例80（4）一樣操作，使2.0g（3.578毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），（17E）－四烯，100ml二氯甲烷，10g分子篩4A，12g（138.1毫莫耳）二氧化錳反應（室溫，10分鐘），施行處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝30：1）精製，得1.56g（78%）白色泡沫狀標記化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 275）

^{1}H NMR（C_6D_6）δ：0.78（s，3H），
1.43（d，J＝7.6Hz，3H），
2.69－2.82（m，1H），
4.18－4.29（m，1H），
4.39－4.47（m，1H），
5.02（brs，1H），
5.28（brs，1H），
6.25（d，J＝11.6Hz，1H），
6.41（d，J＝11.6Hz，1H），
6.66（q，J＝7.6Hz，1H）.

（2）製造20（S）乙醯硫基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16－氧基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）

與實施例80（5）一樣操作，使1.56g（2.80毫莫耳）1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16－氧基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），17（E）－四烯，50ml二氯甲烷，2.27ml（28.0毫莫耳）吡啶，201ml（28.0毫莫耳）硫代乙酸反應（室溫，1.5小時），經後處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝10：1，2次）精製，得1.20g含標記化合物之混合物。

（3）製造20（S）－乙醯硫基－1α，3β－雙（第

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（276）

三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯

與實施例80（6）一樣操作，使1.20g實施例81（2）所得含20（S）－乙醯硫基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16－氧基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯之混合物，3.8ml 1M氫化三第三丁氧基鋁鋰四氫呋喃溶液，45ml四氫呋喃反應（室溫，1小時），施予後處理，以管柱層析（己烷：乙酸乙酯＝10：1）精製，得1.02g含標記化合物之混合物。

（4）製造1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－20（S）－（第三丁氧羰基甲硫基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯

氬氣氛下，於20mg實施例81（3）所得含20（S）－乙醯硫基－1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－16β－羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19）－三烯之混合物的0.2ml四氫呋喃溶液中加入0.2ml甲醇，0.16ml 2M氫氧化鈉水溶液，於室溫攪拌30分鐘後，加入0.046ml溴代乙酸第三丁酯，再於室溫攪拌1小時。反應液中加入乙酸乙酯，以水，飽和食鹽水洗淨，以無水硫酸鈉乾燥，濾別固體後，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯＝6：1，展開1

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（277）

次）精製，得１２ｍｇ無色油狀之標記化合物。

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．０６（ｓ，６Ｈ），

０．０７（ｓ，６Ｈ），０．８４（ｓ，３Ｈ），

０．８７（ｓ，９Ｈ），０．８８（ｓ，９Ｈ），

１．４７（ｓ，９Ｈ），

２．７７－２．８８（ｍ，１Ｈ），

３．１０（ｄ，Ｊ＝１４．６Ｈｚ，１Ｈ），

３．２２－３．３４（ｍ，２Ｈ），

４．１３－４．２５（ｍ，１Ｈ），

４．３４－４．５０（ｍ，２Ｈ），

４．８７（ｓ，１Ｈ），５．２０（ｓ，１Ｈ），

６．０１（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ），

６．２２（ｄ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ）．

（５）製造１α，３β，１６β－三羥基－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲硫基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９）－三烯

氮氣氛下，在１６ｍｇ（０．０２２８毫莫耳）１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－１６β－羥基－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲硫基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９）－三烯之０．５ｍｌ四氫呋喃溶液中，加入０．５ｍｌ　１Ｍ氟化四丁基銨四氫呋喃溶液，於室溫攪拌２天。反應液倒入水中，以乙酸乙酯萃取，依序以０．５Ｍ鹽酸，飽和碳酸氫鈉水溶液，飽和

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（278）

食鹽水洗淨後，，以無水硫酸鈉乾燥有機層。濾別固體後，減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（0.5mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝5：5：1，展開1次）精製，得5.821mg（53%）無色油狀之標記化合物。

IR（neat）：2925，2863，2358，2332，1699，1647，1296，1128，1053cm^{-1}.

^1H NMRδ：0.85（s，3H），
1.47（s，9H），
2.77－2.87（m，1H），
3.09（d，J＝14.0Hz，1H），
3.22－3.35（m，2H），
4.18－4.29（m，1H），
4.38－4.49（m，2H），
5.01（s，1H），5.33（s，1H），
6.01（d，J＝11.3z，1H），
6.37（d，J＝11.3Hz，1H）.

MS m／z：478（M^+），57（100%）.

UV λ_{max} nm：264。

（實施例82）

（1）製造{1α，3β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）}－20（S）－（第三丁氧羰基甲硫基）－9，10

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（279）

－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

在氬氣氛下於２０ｍｇ（０．０２２０毫莫耳）｛１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）｝－２０（Ｓ）－苯氧羰基硫基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，０．３４ｍｌ四氫呋喃，０．３４ｍｌ甲醇之混合液中，加入０．１７ｍｌ　２Ｍ氫氧化鈉水溶液，再加入５６ｍｇ（０．２８８毫莫耳）溴代乙酸第三丁酯，於室溫下攪拌３０分鐘。以乙酸乙酯稀釋反應混合物，以食鹽水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥有機層，經過濾減壓下餾去溶媒，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，己烷：乙酸乙酯＝１００：９，展開一次）分離，得１０ｇ目的之無色油狀混合物。

（２）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲硫基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１７（４）一樣操作，使實施例８２（３）所得含１０ｍｇ　１α，３β－雙（第三丁基二甲基矽烷氧基）－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲硫基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯之混合物，０．５ｍｌ四氫呋喃，１．０ｍｌ　１Ｍ氟化四正丁基銨四氫呋喃溶液反應（外溫５０℃，１小時），施予後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙腈＝３：２，展開１次，再以０．５

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（280）

ｍｍ×１枚，甲苯：乙酸乙酯＝９：１１，展開２次，再以０．５ｍｍ１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝８：８：１，展開１次）精製，得１．７５４ｍｇ（１３％，二步驟）無色玻璃狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３７９，２９２９，２８５０，１７２４，１３６７，１２９２，１１３２，１０５５ ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．８１（ｓ，３Ｈ），
１．４２（ｄ，Ｊ＝７．３Ｈｚ，３Ｈ），
１．４６（ｓ，９Ｈ），
２．２２－２．４３（ｍ，３Ｈ），
２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８３（ｍ，１Ｈ），
３．１２（ｓ，２Ｈ），
４．２０－４．３０（ｂｒ，１Ｈ），
４．３９－４．４９（ｂｒ，１Ｈ），
５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．６４（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１０（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ），
６．３７（ｄ，Ｊ＝１１．２Ｈｚ，１Ｈ）．

ＭＳ　ｍ／ｚ：４６０（Ｍ$^{+}$），５７（１００％）．

ＵＶ　λ$_{max}$　ｎｍ：２６４。

（實施例８３）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（281)

（１）製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－苯氧羰基硫基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例６（３）一樣操作，使５５ｍｇ（０．０７９１毫莫耳）｛１α，３β－（第三丁基二甲基矽烷氧基）｝－２０（Ｓ）－苯氧羰基硫基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，５ｍｌ四氫呋喃，５ｍｌ甲醇，２ｇ Amberlist １５反應（室溫，３小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×３枚，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開１次）精製，得１７ｍｇ（４６％）無色玻璃狀標記化合物。

^{1}Ｈ ＮＭＲδ：０．８６（ｓ，３Ｈ），
１．５８（ｄ，Ｊ＝６．９Ｈｚ，３Ｈ），
２．５４－２．６６（ｍ，１Ｈ），
２．７７－２．８８（ｍ，１Ｈ），
４．１２（ｑ，Ｊ＝７．３Ｈｚ，１Ｈ），
４·１９－４·２９（ｍ，１Ｈ），
４．４０－４．４８（ｍ，１Ｈ），
５．０１（ｂｒｓ，１Ｈ），５．３４（ｓ，１Ｈ），
５．７４（ｂｒｓ，１Ｈ），
６．１１（ｄ，Ｊ＝１０．９Ｈｚ，１Ｈ），
６．３７（ｄ，Ｊ＝１０．９Ｈｚ，１Ｈ），
７．１２－７．４１（ｍ，５Ｈ）．

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（282）

（２）製造｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）硫基｝－Ｎ－（第三丁基）乙醯胺

與實施例１６（２）一樣操作，使６ｍｇ（０．０１２９毫莫耳）１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－苯氧羰基硫基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，０．５ｍｌ　１Ｍ氫氧化鉀甲醇溶液，１０ｍｇ（０．０５１５毫莫耳）２－溴－Ｎ－（第三丁基）乙醯胺反應（室溫，１５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５ｍｍ×２枚，二氯甲烷：乙腈＝３：２，展開一次）精製，得３．８７４ｍｇ（６６％）無色玻璃狀標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３４０，２９６４，２９３１，１６５３，１５２５，１４５４，１２２３，１０５７ ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．８３（ｓ，３Ｈ），
１．３６（ｓ，９Ｈ），
２．２２－２．４２（ｍ，３Ｈ），
２．５７－２．６２（ｍ，１Ｈ），
２．７９－２．８３（ｍ，１Ｈ），
３．０７（ｓ，２Ｈ），
３．３３－３．４８（ｍ，１Ｈ），
４．２０－４．３０（ｂｒ，１Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（283）

4．39－4．49（br，1H），
5．01（brs，1H），5．34（s，1H），
5．63（brs，1H），
6．10（d，J＝11．2Hz，1H），
6．36（d，J＝11．2Hz，1H），
6．72（brs，1H）．
MS　m／z：459（M^+），57（100%）．
UV　λ_{max}　nm：263。

（實施例84）

（1）製造｛（1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基）硫基｝－N－（第三丁基）－N－甲基－乙醯胺

與實施例16（2）一樣操作，使5mg（0．0107毫莫耳）1α，3β－二羥基－20（S）－苯氧羰基硫基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯，0．5ml　1M氫氧化鉀甲醇溶液，10mg（0．0481毫莫耳）2－溴－N－（第二丁基）－N－甲基乙醯胺反應（室溫，15小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0．5mm×2枚，二氯甲烷：乙腈＝2：1，展開2次）精製，得3．102mg（61%）無色玻璃狀標記化合物。

IR（neat）：3380，2927，2850，1631），1367，1211，1093，1057

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（284）

cm^{-1}.

^{1}H NMR δ：0.82（s，3H），

1.41（s，9H），

1.46（d，J＝6.9Hz，3H），

2.21－2.42（m，3H），

2.57－2.62（m，1H），

2.79－2.83（m，1H），

2.94（s，3H），

3.19－3.29（m，2H），

3.58－3.66（m，1H），

4.20－4.30（br，1H），

4.39－4.49（br，1H），

5.01（brs，1H），5.34（s，1H），

5.66（brs，1H），

6.10（d，J＝11.2Hz，1H），

6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS m／z：473（M^{+}），57（100%）.

UV λ_{max} nm：263。

（實施例85）

製造｛（1α，3β－二羥基－9，10－閉聯－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基）硫基｝－N－甲氧基－N－甲基乙醯胺及｛（1α，3β－二羥基－9，10－閉聯－5，7，10（19），16－四

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（285)

烯－２０（Ｓ）－基）硫基｝－Ｎ－甲基乙醯胺

與實施例１６（２）一樣操作，使５ｍｇ（０．０１０７毫莫耳）１α，３β－二羥基２０（Ｓ）－苯氧羰基硫基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，０．５ｍｌ　１Ｍ氫氧化鉀甲醇溶液，１０ｍｇ（０．０５４９毫莫耳）２－溴－Ｎ－甲氧基Ｎ－甲基乙醯胺反應（室溫，１５小時），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．５１ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：１０：１，展開１次，再以０．５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙腈＝１：１，展開１次）精製，得０．８４７ｍｇ（１８％）無色玻璃狀之｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）硫基｝－Ｎ－甲氧基－Ｎ－甲基乙醯胺，及０．８３９ｍｇ（１９％）無色玻璃狀之｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）硫基｝－Ｎ－甲基乙醯胺。

｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）硫基｝－Ｎ－甲氧基－Ｎ－甲基乙醯胺

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３４０１，２９２２，２８５０，１６４７，１４４６，１０５５ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．８３（ｓ，３Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（286）

1.44（d，J＝6.9Hz，3H），
2.22－2.39（m，3H），
2.57－2.62（m，1H），
2.79－2.38（m，1H），
3.20（s，3H），
3.24－3.38（m，2H），
3.66－3.73（m，1H），
3.73（s，3H），
4.20－4.30（br，1H），
4.39－4.49（br，1H），
5.01（brs，1H），5.34（s，1H），
5.67（brs，1H），
6.10（d，J＝10.9Hz，1H），
6.37（d，J＝10.9Hz，1H）.

MS　m／z：429（M^+-H_2O），91（100%）.

UV　λ_{max} nm：263。

{（1α，3β－二羥基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯－20（S）－基）硫基}－N－甲基乙醯胺

IR（neat）：3326，2924，2850，1653，1417，1122，1055 cm^{-1}.

^1H NMRδ：0.81（s，3H），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（287）

1.41（d，J＝6.9Hz，3H），
2.20－2.36（m，3H），
2.57－2.62（m，1H），
2.79－2.86（m，1H），
2.85（d，J＝4.9Hz，3H），
3.16（s，2H），
3.42－3.49（m，1H），
4.20－4.30（br，1H），
4.39－4.49（br，1H），
5.01（brs，1H），5.35（s，1H），
5.62（brs，1H），
6.10（d，J＝11.2Hz，1H），
6.36（d，J＝11.2Hz，1H）.
MS m／z：399（M^+-H_2O），91（100%）.
UV λ_{max} nm：264。

（實施例86）

製造1α，3β－二羥基－20（s）－第三丁氧羰基乙硫基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯

與實施例16（2）一樣操作，使8.7mg（0.0186毫莫耳）1α，3β－二羥基－20（S）－苯氧羰基硫基－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（288)

19），16－四烯，0.04ml　1M氫氧化鉀甲醇溶液120.0mg（0.936毫莫耳）丙烯酸第三丁酯反應（室溫，30分鐘），經後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（0.25mm×1枚，二氯甲烷：乙醇＝15：1，展開3次，再以0.25mm×1枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝10：5：1，展開3次）精製，得3.6mg（40%）無色玻璃狀標記化合物。

IR（neat）：3400，2928，1728，145），1368，1252，1152，1056 cm^{-1}.

^1H NMR δ：0.82（s，3H），
1.41（d，J＝6.9Hz，3H），
1.45（s，9H），
2.75－2.88（m，1H），
3.46（q，J＝6.9Hz，1H），
4.20－4.30（m，1H），
4.40－4.50（m，1H），
5.01（brs，1H），
5.34（brs，1H），
5.61（brs，1H），
6.10（d，J＝11.4Hz，1H），
6.37（d，J＝11.4Hz，1H）.

MS　m／z：474（M^+），57（100%）.

UV　λ_{max} nm：263。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（289)

（實施例８７）

製造１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－第三丁氧羰基丙硫基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯

與實施例１６（２）一樣操作，使６．２ｍｇ（０．０１３３毫莫耳）１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－苯氧羰基硫基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯，６５μｌ　２Ｍ氫氧化鈉水溶液，１５５．０ｍｇ（０．６９５毫莫耳）４－溴代丁酸第三丁酯反應，施予後處理，所得殘渣以分取用薄層層析（０．２５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙醇＝２０：１，展開１次，二氯甲烷：乙醇＝１０：１，展開一次後，繼而以０．２５ｍｍ×１枚，二氯甲烷：乙酸乙酯＝３：１，展開一次，二氯甲烷：乙酸乙酯＝１：１展開１次後，繼而以０．２５ｍｍ×１枚，己烷：乙酸乙酯：乙醇＝１０：５：１，展開二次）精製，得２．９ｍｇ（４５％）無色油狀之標記化合物。

ＩＲ（ｎｅａｔ）：３３８４，２９６８，２９２８，２８４８，１７２８，１４４８，１３６８，１２４０，１１６０，１０５６ｃｍ$^{-1}$．

^{1}Ｈ　ＮＭＲδ：０．８２（ｓ，３Ｈ），

１．４１（ｄ，Ｊ＝７．０Ｈｚ，３Ｈ），

１．４４（ｓ，９Ｈ），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（290）

1.84（t，J＝7.3Hz，2H），

2.32（t，J＝7.3Hz，2H），

2.45（dt，J＝3.3，7.3Hz，2H），

2.55－2.65（m，1H），

2.75－2.86（m，1H），

3.44（q，J＝7.0Hz，1H），

4.19－4.30（m，1H），

4.40－4.50（m，1H），

5.01（brs，1H），

5.34（brs，1H），

5.58（brs，1H），

6.10（d，J＝11.2Hz，1H），

6.37（d，J＝11.2Hz，1H）.

MS　m／z：470（M^+-H_2O），57（100%）.

UV　λ_{max}　nm：263。

（試驗例1）

以溶解125μg／mℓ活性型維他命D_3（1α，25（OH）$_2$維他命D_3）於乙醇，或500μg／mℓ上述實施例所得維他命D衍生物之化合物1～15，或做爲對照群的只爲乙醇者，投予約1.5×2.0cm^2 8週齡雄性Bal b／c鼠的背部皮膚，進行單次經皮投予。投予液量係2mℓ／kg，爲避免經口投予，頸部裝置項

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（291）

圈。投予後翌日拆除項圈擦拭投予部位，投予2天後抽血，以離子選擇電極法測定血中離子化鈣值。實驗係對各群3例實施。結果示於表45。表中之離子化鈣之測定值係平均值。

（試驗例2）

在96孔槽盤（COSTAR 3595）中播種2×10^3／孔細胞數來自人新生兒包皮之角質化形成細胞（Clonetics公司）。然後在各孔槽添加各濃度之活性型維他命D_3（1α，25（OH）$_2$維他命D_3）或化合物1～15，以KGM－2培養基，於各孔槽爲細胞濃度2×10^3個／200μl，於37℃，5% CO＝2，95%空氣下培養3天。每一孔添加7.4KBq〔^{3}H〕胸腺核苷，再培養1天。以不含鈣，鎂之磷酸緩衝液（Dulbecco PBS(-)，日水公司，code 05913，pH7.3～7.65）洗孔槽一次後，以0.25%胰蛋白酸剝開細胞，以液體閃爍計數器（1450microβ，Wallac公司）測定。結果示於表45。表中之抑制人角質化形成細胞之增殖係以各化合物對活性型維他命D_3的相對值＝（活性型維他命D_3之IC_{50}（mol／l）值）／各化合物之IC_{50}（mol／l）值表示。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（292）

表４５

	投予量 (μg/kg)	試驗例 1 血中離子化鈣濃度 (mmol/l)	試驗例 2 抑制人角質化形成細胞之增殖 (相對值)
對照群	-----	1.35	-----
1α,25(OH)$_2$D$_3$	250	2.66	1.0
化合物 1	1000	1.65	2.0
化合物 2	1000	2.27	5.9
化合物 3	1000	1.54	0.5
化合物 4	1000	2.16	7.0
化合物 5	1000	1.35	0.3

表中化合物係各示：

化合物１係實施例８（３）所得２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基甲氧基）－１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯；

化合物２係實施例１３所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（Ｎ－第三丁基－Ｎ－甲胺羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯；

化合物３係實施例１１（２）所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（第三丁氧羰基乙氧基）－９，１０－

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（293）

閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

化合物4係實施例14所得1α，3β－二羥基－20（S）－（N－第三丁胺羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

化合物5係實施例15所得1α，3β－二羥基－20（S）－（異丙氧羰基甲氧基）－9，10－閉聯孕甾－5，7，10（19），16－四烯；

（試驗例3）

除使用化合物6～12做爲維他命衍生物以外，其他則均與上述試驗例1一樣測定老鼠血中離子化鈣值，結果示於表46。表中離子化鈣測定值係平均值。

（試驗例4）

在96孔槽盤（COSTAR 3595）中播種2×10^3／孔細胞數來自人新生兒包皮之角質化形成細胞（Clonetics公司）。然後在各孔槽添加各濃度之活性型維他命D_3（1α，25（OH）$_2$維他命D_3）或化合物6～12，以KGM－2培養基，於各孔槽爲細胞濃度2×10^3個／200μl，於37℃，5% CO＝2，95%空氣下培養3天。每一孔添加7.4KBq〔^{3}H〕胸腺核苷，再培養1天。除去培養基後，以0.05%胰蛋白酶／0.53mM EDTA剝開細胞，以液體閃爍計數器（1450 microβ，Wallac公司）測定。結果示於表45。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（294）

表中之抑制人角質化形成細胞之增殖係以各化合物對活性型維他命D_3的相對值＝（活性型維他命D_3之IC_{50}（mol／l）值）／各化合物之IC_{50}（mo／l）值表示。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 295）

表４６

	投予量（μg/kg）	試驗例３ 血中離子化鈣濃度（mmol/l）	試驗例４ 抑制人角質化形成細胞之增殖（相對值）
對照群	-----	1.35	-----
1α,25(OH)$_2$D$_3$	250	2.66	1.0
化合物６	1000	1.57	12.0
化合物７	1000	1.28	0.4
化合物８	1000	1.39	2.5
化合物９	1000	1.55	0.7
化合物１０	1000	1.43	1.6
化合物１１	1000	1.42	0.4
化合物１２	1000	1.58	8.3

表中化合物係示：

化合物６係實施例１７（４）所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯；

化合物７係實施例２１（２）所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－異丙基－２－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 296）

１６－四烯；

化合物８係實施例１８（２）所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丁氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯；

化合物９係實施例２３（４）所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯；

化合物１０係實施例１９（２）所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基己氧羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯；

化合物１１係實施例２０（３）所得１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－｛２－（１－乙基－１－甲基丙氧羰基）乙氧基｝－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯；

化合物１２係實施例２２（２）所得｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－（２，２，３，３，３－五氟化丙基）乙醯胺。

產業上之可利用性

本發明之維他命Ｄ衍生物係具有良好之生理活性，另

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ 297）

外，鈣上昇作用比以往之維他命D衍生物低，對以往因高鈣血症之關係限制其投予之疾病等可做爲極爲有用之治療藥者。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

I288131

公告本

申請日期	90 年 6 月 14 日 修正 93.4.6 補充
案號	90114462
類別	C07C401/00, C07J7/00, 9/00, A61K31/592, 31/593, A61P3/02, 17/00

（以上各欄由本局填註）

發明 新型 專利說明書

一、發明 新型 名稱	中文	維他命D衍生物、及含其之醫藥組成物
	英文	
二、發明 創作 人	姓名	(1) 森川一實 (2) 大森正幸 (3) 清水香月
	國籍	(1) 日本國靜岡縣御殿場市駒門一丁目一三五番地中外製薬株式会社内
	住、居所	(2) 日本國靜岡縣御殿場市駒門一丁目一三五番地中外製薬株式会社内 (3) 日本國靜岡縣御殿場市駒門一丁目一三五番地中外製薬株式会社内
三、申請人	姓名（名稱）	(1) 中外製藥股份有限公司 中外製薬株式会社
	國籍	(1) 日本
	住、居所（事務所）	(1) 日本國東京都北區浮間五丁目五番一號
	代表人 姓名	(1) 永山治

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

I288131

申請日期	90 年 6 月 14 日
案號	90114462
類別	

A4
C4

9346

（以上各欄由本局填註）

發明 新型 專利說明書

一、發明 新型 名稱	中文	
	英文	
二、發明 創作 人	姓名	⑷ 川瀨朗 ⑸ 江村岳
	國籍	⑷ 日本國靜岡縣御殿場市駒門一丁目一三五番地中外製藥株式会社內 ⑸ 日本國靜岡縣御殿場市駒門一丁目一三五番地中外製藥株式会社內
	住、居所	
三、申請人	姓名（名稱）	
	國籍	
	住、居所（事務所）	
	代表人姓名	

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

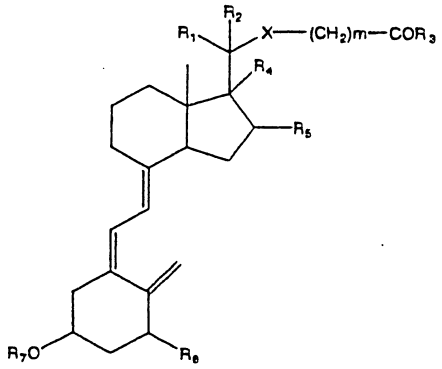
A5
B5

97466

四、中文發明摘要（發明之名稱：維他命D衍生物、及含其之醫藥組成物）

本發明係以提供醫藥，尤其做爲乾癬等皮膚疾病治療藥具有極佳之生理活性，且可降低鈣上昇作用之維他命D衍生物爲目的。

經由本發明可提供式（1）所示維他命D衍生物



式（1）

{式（1）中X示氧原子或硫原子；
m示1～3之數，
R1及R2示氫原子或烷基；

英文發明摘要（發明之名稱：　　）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A5
B5

四、中文發明摘要（發明之名稱：　　）

R_4及R_5示氫原子或羥基等；
R_3示－YR_8等；
R_6示氫原子等；
R_7示氫原子等｝

英文發明摘要（發明之名稱：　　）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

公告本

A8
B8
C8
D8

96.4.26

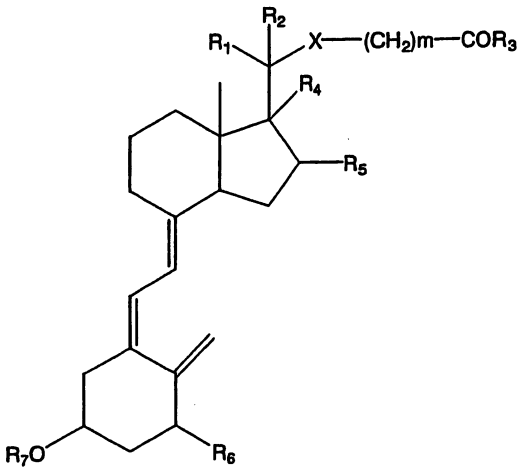
六、申請專利範圍 1

第90114462號專利申請案

中文申請專利範圍修正本

民國96年4月26 日修正

1．一種以式（1）所示維他命D衍生物，



式（1）

｛X示氧原子或硫原子；

m示1～3之數；

R_1及R_2示氫原子或C_1～C_4烷基；

R_4及R_5示氫原子或羥基，惟R_4及R_5雙方不同時表示氫原子、或R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，；

R_3示－YR_8（Y示氧原子或硫原子，R_8示氫原子，或可被氟原子或C_3～C_{10}環狀烷基所取代之C_1～C_{15}直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_{15}環狀烷基）或－NR_9R_{10}（R_9及R_{10}示氫原子，或可被氟原子或C_3～C_{10}環狀烷基所取代之C_1～C_{15}直鏈或支鏈

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍 2

狀烷基，或可被氟原子所取代之C3～C15環狀烷基，或R4及R5爲一起在16位與17位形成雙鍵時R9及R10係與氮原子一起形成爲3～10節環），R6示氫原子或羥基，R7示氫原子｝。

2．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中，式（1）中X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R1及R2示氫原子或甲基，R4示氫原子且R5示羥基，或R4及R5爲一起在16位與17位形成雙鍵，R3示－YR8（Y示氧原子或硫原子，R8示氫原子，或可被氟原子或C3～C8環狀烷基所取代之C1～C10直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C3～C12環狀烷基）或－NR9R10（R9及R10示氫原子，或可被氟原子或C3～C8環狀烷基所取代之C1～C10直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C3～C12環狀烷基，或R4及R5爲一起在16位與17位形成雙鍵結合時，R9及R10係與氮原子一起形成爲3～10節環），R6示羥基，R7示氫原子。

3．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中式（1）中X示氧原子或硫原子，m係1～2之數，R1及R2示氫原子或甲基，R4及R5爲一起在16位與17位形成雙鍵，R3示－YR8（Y示氧原子或硫原子，R8示氫原子，或可被氟原子或C3～C8環狀烷基所取代之C1～C8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C3～C8環狀烷基）或－NR9R10（R9及R10示氫原子，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍 3

或可被氟原子或C_3～C_8環狀烷基所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_8環狀烷基，或R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵結合時，R_9及R_{10}係與氮原子一起形成爲3～8節環），R_6示羥基，R_7示氫原子。

4．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中式（1）中，X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－YR_8（Y示氧原子或硫原子，R_8示氫原子，或可被氟原子或C_3～C_6環狀烷基所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_8環狀烷基），R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

5．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中式（1）中X示氧原子或硫原子，m示1，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_4及R_5可一起在16位與17位形成雙鍵結合，R_3示－NR_9R_{10}（R_9及R_{10}示氫原子，或氟原子或可被C_3～C_6環狀烷基所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基，或可被氟原子所取代之C_3～C_8環狀烷基，或R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵時，R_9及R_{10}係與氮原子一起形成3～6節環），R_6示羥基，R_7示氫原子。

6．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中式（1）中X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－OR_8（R_8示C_3～C_8支

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍 4

鏈狀烷基），R_4及R_5一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

7．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中式（1）中係X示氧原子或硫原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－SR_8（R_8示C_3～C_8支鏈狀烷基），R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

8．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中式（1）中，X示氧原子或硫原子，m示1，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－NR_9R_{10}（R_9示氫原子或C_1～C_4直鏈或支鏈狀烷基，R_{10}示可被氟原子所取代之C_1～C_8直鏈或支鏈狀烷基），R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

9．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其中式（1）中X示氧原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，R_3示－OR_8（R_8示C_6～C_8支鏈狀烷基），R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

10．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其式（1）中X示氧原子，m示1～2之數，R_1及R_2示氫原子或甲基，且其一爲甲基，R_3示－OR_8（R_8示C_6～C_8支鏈狀烷基），R_4及R_5爲一起在16位與17位形成雙鍵，R_6示羥基，R_7示氫原子。

11．如申請專利範圍第1項之維他命D衍生物，其

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝 訂 線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍 5

式（１）中Ｘ示氧原子，ｍ示１，Ｒ１及Ｒ２示氫原子或甲基，且其一爲甲基，Ｒ３示－ＮＲ９Ｒ１０（Ｒ９示氫原子，甲基、Ｒ１０係可被氟原子所取代之Ｃ１～Ｃ４直鏈或支鏈狀烷基），

Ｒ４及Ｒ５爲一起在１６位１７位形成雙鍵，Ｒ６示羥基，Ｒ７示氫原子。

１２．如申請專利範圍第１項之維他命Ｄ衍生物，其中式（１）中Ｘ示氧原子，ｍ示１，Ｒ１及Ｒ２示氫原子或甲基，且其一爲甲基，Ｒ３示－ＮＲ９Ｒ１０（Ｒ９示氫原子，Ｒ１０示可被氟原子所取代之丙基），Ｒ４及Ｒ５爲一起在１６位１７位形成雙鍵，Ｒ６示羥基，Ｒ７示氫原子。

１３．一種維他命Ｄ衍生物，其爲１α，１β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－乙基－１－甲基丙氧基羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯。

１４．一種維他命Ｄ衍生物，其爲１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１－異丙基－２－甲基丙氧基羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯。

１５．一種維他命Ｄ衍生物，其爲１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基丁氧基羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯。

１６．一種維他命Ｄ衍生物，其爲１α，３β－二羥

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍 6

基－２０（Ｓ）－（１，１－二甲基己氧基羰基甲氧基）－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯。

１７．一種維他命 D 衍生物，其爲１α，３β－二羥基－２０（Ｓ）－｛２－（１－乙基－１－甲基丙氧基羰基）乙氧基｝－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯。

１８．一種維他命 D 衍生物，其爲｛（１α，３β－二羥基－９，１０－閉聯孕甾－５，７，１０（１９），１６－四烯－２０（Ｓ）－基）氧基｝－Ｎ－（２，２，３，３，３－五氟化丙基）乙醯胺。

１９．一種醫藥品組成物，其特徵爲含如申請專利範圍第１項至第１８項中任一項之維他命Ｄ衍生物者。

２０．一種皮膚疾病治療劑，其特徵爲含如申請專利範圍第１項至第１８項中任一項之維他命Ｄ衍生物者。

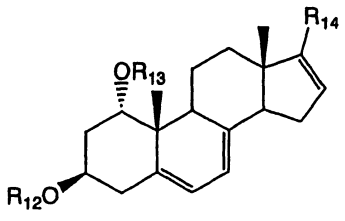
２１．如申請專利範圍第２０項之皮膚疾病治療劑，其中皮膚疾病爲乾癬。

２２．一種製造式（３）所示化合物之方法，其特徵爲在有機溶媒中，有機鋁試藥及鈀觸媒存在下，於一氧化碳環境中使式（２）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A8
B8
C8
D8

六、申請專利範圍 7



（2）

（式中R12及R13各示甲基、甲氧基甲基、甲硫基甲基，第三丁硫基甲基、（苯基二甲基矽烷基）甲氧基甲基、苯甲氧基甲基、對甲氧基苯甲氧基甲基、對氯苯甲氧基甲基、（4－甲氧基苯氧基）甲基、第三丁氧基甲基、2－甲氧基乙氧基甲基、2，2，2－三氯乙氧基甲基、2－（三甲基矽烷基）乙氧基甲基、苯硫基甲基、環丙基甲基，四氫吡喃基、四氫硫基吡喃基、1－甲氧基環己基、4－甲氧基四氫吡喃基、4－甲氧基四氫硫基吡喃基、S，S－二氧化4－甲氧基四氫硫基吡喃基、1，4－二噁烷－2－基、四氫呋喃基、四氫硫基呋喃基、苯甲醯甲基、對溴苯甲醯甲基、1－乙氧基乙基、甲氧基異丙基、1－（2－氯乙氧基）乙基、1－甲基－1－甲氧基乙基、1－甲基－苯甲氧基乙基、1－甲基－1－苯甲氧基－2－氟乙基、2，2，2－三氯乙基、2－三甲基矽烷基乙基、2，2－二氯－1，1－二氟乙基、烯丙基、第三丁基、對氯苯基、對甲氧基苯基、2，4－二硝基苯基、苯甲基、對甲氧基苯甲基、3，4－二甲氧基苯甲基、鄰硝基苯基、對硝基苯甲基、對氯苯甲基、對溴苯甲基、2，6－二氯苯甲基、對氰基苯甲基、對苯基苯甲基、4－（二甲

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

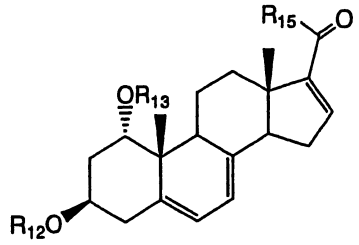
六、申請專利範圍 8

基胺羰基）苯甲基、2－吡啶甲基、4－吡啶甲基、二苯基甲基、p，p´－二硝基二苯甲基、5－二苯并環庚基、三苯基甲基、對甲氧苯基二苯基甲基、二（對甲氧基苯基）苯甲基、三（對甲氧苯基）甲基、9－蒽基、1，3－苯并二（四氫噻吩）－2－基、S，S－二氧化苯異噻唑基、三甲基矽烷基、三乙基矽烷基、三異丙基矽烷基、二甲基異丙基矽烷基、二乙基異丙基矽烷基、二甲基己基矽烷基、第三丁基二甲基矽烷基、第三丁基二苯基矽烷基、三苯甲基矽烷基、三對二甲苯基矽烷基、三苯基矽烷基、二苯基甲基矽烷基、第三丁基甲氧基矽烷基、甲醯基、乙醯基、氯乙醯基、二氯乙醯基、三氯乙醯基、三氟乙醯基、甲氧基乙醯基、丙醯基、丁醯基、異丁醯基、三甲基乙醯基、金剛烷基、環己烷羰基、苯甲醯基、4－硝基苯甲醯基、4－氯苯甲醯基、4－甲氧苯甲醯基、萘甲醯基、甲苯甲醯基、9－芴羰基、甲氧羰基、乙氧羰基、第三丁氧羰基、苯甲氧羰基、4－甲氧基苯甲氧羰基、9－芴基甲氧基羰基、2，2，2－三氯乙氧羰基、2－（三甲基矽烷基）乙氧羰基、2－（甲硫基甲氧基）乙氧羰基、丙氧羰基、異丙氧羰基、異丁氧羰基、乙烯氧羰基，烯丙氧羰基、對硝基苯氧羰基、3，4－二甲氧基苯甲氧羰基、鄰硝苯甲氧羰基、對硝苯甲氧羰基、苯甲硫羰基、4－乙氧基－1－萘氧羰基、（甲硫基）硫羰基、異丁胺羰基或苯基胺羰基，R_{14}示氯原子、溴原子、碘原子、甲磺醯氧基、乙磺醯氧基、正丙磺醯氧基、異丙磺醯氧基、正丁磺

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍 9

醯氧基、異丁磺醯氧基、第二丁磺醯氧基、第三丁磺醯氧基、β-三甲基矽烷基乙磺醯氧基、三氟甲磺醯氧基、五氟乙磺醯氧基、九氟丁磺醯氧基、苯磺醯氧基、甲苯磺醯氧基、2,3,6-三甲基-4-甲氧基苯磺醯氧基、2,4,6-三甲氧基苯磺醯氧基、2,6-二甲基-4-甲氧基苯磺醯氧基、五甲基苯磺醯氧基、2,3,5,6-四甲基-4-甲氧基苯磺醯氧基、4-甲氧基苯磺醯氧基、2,4,6-三甲基苯磺醯氧基、2,6-二甲氧基-4-甲基苯磺醯氧基、苯甲磺醯氧基、二甲基磷醯氧基、二乙基磷醯氧基、二正丙基磷醯氧基、二異丙基磷醯氧基、二正丁基磷醯氧基、二異丁基磷醯氧基、二第二磷醯氧基、二第三丁基磷醯氧基、二環己基磷醯氧基、或二苯基磷醯氧基）所示化合物，於 0～150℃的溫度、一氧化碳環境中，常壓至加壓下，進行 10 分鐘～12 小時的羰基化反應，以製造式（3）



(3)

（式中R_{12}及R_{13}係如同上述同意，R_{15}示烷基，芳基，烯基或炔基）所示化合物者。

23．如申請專利範圍第22項之方法，其中有機鋁試藥爲以式（4）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

A8
B8
C8
D8

六、申請專利範圍 10

$(R_{15})_nA1W_{3-n}$ （4）

（式中n示1～3整數，R_{15}示烷基，芳基，烯基或炔基，W示鹵素原子）所示者。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製