

申請日期	2000, 9, 13
案 號	89118689
類 別	C07D ^{277/18} , ^{279/66} , A61K ^{31/626} , ^{31/541}

A4
C4

0016197N

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書

一、發明 名稱	中 文	具大麻素 2 受體親和性或大麻素 2 受體作用性之醫藥組成物 (92 年 7 月 28 日修正頁)
	英 文	A PHARMACEUTICAL COMPOSITION HAVING THE AFFINITY FOR CANNABINOID 2 RECEPTOR (CB2R) AND THE FUNCTION AS CANNABINOID 2 RECEPTOR (CB2R)
二、發明 創作人	姓 名	1.花崎浩二 2.村司孝己 3.甲斐浩幸
	國 籍	1-3 皆屬日本
	住、居所	1.大阪府大阪市福島區鷺洲 5 丁目 12 番 4 號 鹽野義製藥株式會社內 2.滋賀縣甲賀郡甲賀町大字五反田1405 番地 鹽野義製藥株式會社內 3.同上所
三、申請人	姓 名 (名稱)	鹽野義製藥股份有限公司 (鹽野義製藥株式會社)
	國 籍	日本
	住、居所 (事務所)	大阪府大阪市中央區道修町 3 丁目 1 番 8 號
	代 表 人 姓 名	鹽野元三(塩 野元三)

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
I P C分類：

A6

B6

本案已向：

日本 國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ，☒有 ☐無主張優先權
1999年09月14日特願平11-260780號

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()

技術領域

本發明為關於 2-亞胺基-1,3-噁吡衍生物。更詳言之，為關於對於大麻素 2 受體具有拮抗作用或激動作用之 2-亞胺基-1,3-噁吡衍生物及其醫藥用途。

背景技術

大麻素為於 1960 年以大麻活性物質之本體型式被發現，其作用為在表現中樞神經系作用(幻覺、多幸福感、時間空間感覺紊亂)、及末梢細胞系作用(免疫抑制、消炎、鎮痛作用)。

其後，由含有花生四烯酸之磷脂質中所產生之 Anandamide 和 2-花生四烯醯甘油，發現內在性大麻素受體激動劑。此些內在性激動劑已知表現中樞神經系作用及末梢細胞系作用。更且，於 Hypertension(1997) 29,1204-1210 中，已報告 Anandamide 對於心血管的作用。

大麻素受體於 1990 年發現大麻素 1 受體，且已知其分布於脂等之中樞神經系中，其激動劑已知為抑神經傳遞物質的釋出，並且顯示出幻覺等之中樞作用。又，於 1993 年發現大麻素 2 受體，且已知其分布於脾臟等之免疫系組織中，其激動劑已知為抑制免疫系細胞和炎症系細胞的活化，並且顯示出免疫抑制作用、消炎作用、鎮痛作用(Nature, 1993, 365, 61-65)。

因此，大麻素 2 受體之選擇性拮抗劑或激動劑可迴避來自大麻素 1 受體之中樞神經系的副作用(幻覺等)，且亦未引起關連於大麻素 1 受體之依賴性，並且可期待作

五、發明說明(二)

為免疫抑制劑、消炎劑、鎮痛劑(Nature, 1998, 349, 277-281)。

具有大麻素 2 受體拮抗作用或激動作用之化合物已知有異吲哚滿酮衍生物(W097/29097、W099/02499)、吡啶衍生物(W098/41519)等。

另一方面，具有 2-亞胺基-1,3-噻吡啶骨架之有機磷化合物已知具有殺蟲作用(特開昭 61-65849、特開昭 62-29594)。

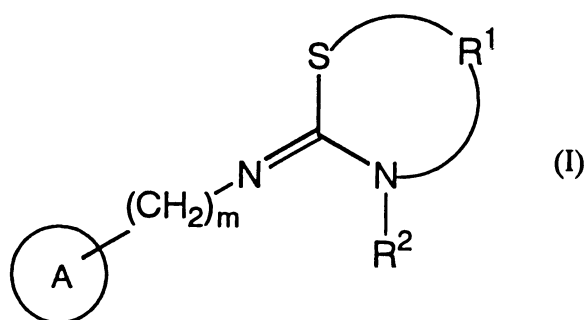
但是，並未知 2-亞胺基-1,3-噻吡啶衍生物為具有大麻素 2 受體拮抗作用或激動作用。

發明之揭示

發現對於大麻素 2 受體具有選擇性拮抗作用或激動作用之新穎化合物，為 2-亞胺基-1,3-噻吡啶衍生物等。

即，本發明為關於

1)一種含有式 I)所示之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物之醫藥組成物：

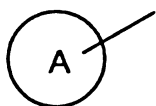


(式中， R^1 為表示亦可經取代之伸烷基， R^2 為表示烷基、式：
 $-C(=R^5)-R^6$ (式中， R^5 為表示 O 或 S， R^6 為表示烷基、烷

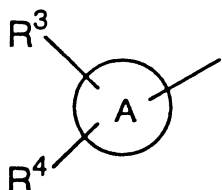
五、發明說明 (3)

氧基、烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳烷氧基、亦可經取代之芳烷硫基、亦可經取代之芳烷胺基、烷氧烷基、烷硫烷基、或亦可經取代之胺烷基)所示之基、或式： $-SO_2R^7$ (式中， R^7 為表示烷基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之雜芳基)所示之基， m 為表示 $0\sim 2$ 之整數， A 為表示亦可經取代之芳香族碳環或亦可經取代之芳香族雜環)、

2) 如上述 1)記載之醫藥組成物，其中式：



所示之基為表示式：



(式中， R^3 及 R^4 分別獨立表示氫、烷基、烷氧基、烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、亦可經取代之芳氧基、環烷基、鹵素、羥基、硝基、鹵烷基、鹵烷氧基、亦可經取代之胺甲鹽基、羧基、烷氧基、烷亞磺鹽基、烷磺鹽基、烷氧烷基、烷硫烷基、亦可經取代之胺烷基、烷氧烷氧基、烷硫烷氧基、亦可經取代之雜芳基、亦可經取代之非芳香族雜環基、烷氧亞胺烷基、或式： $-C(=O)-R^H$ (R^H 為氫、烷基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之非芳香族雜環基)所示之基，或 R^3 及 R^4 為共同表示伸烷二氧基， A 為表示亦可經取代之芳香族

五、發明說明(4)

碳環或亦可經取代之芳香族雜環、

3) 如上述 1) 或 2) 記載之醫藥組成物，其為大麻素 2 受體親和性、

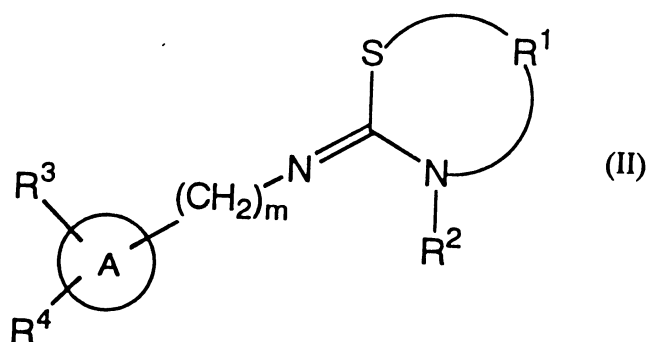
4) 如上述 3) 記載之醫藥組成物，其為大麻素 2 受體作動性、

5) 如上述 3) 記載之醫藥組成物，其為消炎劑、

6) 如上述 3) 記載之醫藥組成物，其為免疫抑制劑、

7) 如上述 3) 記載之醫藥組成物，其為腎炎治療劑、

8) 一種式(II)所示之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物



(式中， R^1 為表示亦可經取代之伸烷基， R^2 為表示烷基、式： $-C(=R^5)-R^6$ (式中， R^5 為表示 O 或 S， R^6 為表示烷基、烷氧基、烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳烷氧基、亦可經取代之芳烷硫基、亦可經取代之芳烷胺基、烷氧烷基、烷硫烷基、或亦可經取代之胺烷基) 所示之基、或式： $-SO_2R^7$ (式中， R^7 為表示烷基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之雜芳基) 所示之基，且 R^3 及 R^4 分別獨立表示氫、烷基、烷氧基、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(5)

烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、亦可經取代之芳氧基、環烷基、鹵素、羥基、硝基、鹵烷基、鹵烷氧基、亦可經取代之胺甲醯基、羧基、烷氧基、烷亞磺醯基、烷磺醯基、烷氧烷基、烷硫烷基、亦可經取代之胺烷基、烷氧烷氧基、烷硫烷氧基、亦可經取代之雜芳基、亦可經取代之非芳香族雜環基、烷氧亞胺烷基、或式： $-C(=O)-R^H$ (R^H 為氫、烷基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之非芳香族雜環基)所示之基，或 R^3 及 R^4 為共同表示伸烷二氧基， m 為表示 0~2 之整數， A 為表示亦可經取代之芳香族碳環或亦可經取代之芳香族雜環)、

9) 如上述 8)記載之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物，其中 m 為 0、

10) 如上述 8)或 9)記載之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物，其中 R^1 為亦可經伸烷基所取代之碳數 2~9 個之直鏈狀或分支狀伸烷基、

11) 如上述 8)~10)任一項記載之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物，其中 R^1 為經伸烷基所取代之碳數 2~9 個之直鏈狀伸烷基、或碳數 2~9 個之分支狀伸烷基、

12) 如上述 8)~11)任一項記載之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物，其中 R^6 為烷氧基或烷硫基， R^7 為亦可經取代之芳基、

13) 如上述 8)~11)任一項記載之化合物、其前體藥物

五、發明說明(6)

、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物，其中 R^3 及 R^4 分別獨立為氫、烷基、烷氧基、或烷硫基，A 為亦可經取代之芳香族雜環、

14) 如上述 8) 記載之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物，其中 R^1 為 2,2-二甲基伸丙基、2,2-二乙基伸丙基、2,2-伸乙基伸丙基、1-甲基伸丙基、2-甲基伸丙基、伸丙基、2,2-二-正丙基伸丙基、2,2-伸丁基伸丙基、2,2-伸戊基伸丙基、1,1-二甲基伸乙基、或 1-甲基伸乙基， R^6 為甲基、乙基、正丙基、異丙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、異丁硫基、第二丁硫基、戊氧基、己硫基、甲氧甲基、乙氧甲基、甲硫甲基、乙硫甲基、或乙胺基， R^7 為甲基、乙基、4-甲苯基、4-硝苯基、3-硝苯基、2-硝苯基、4-甲氧苯基、4-三氟甲基苯基、2-噻吩基、或 2-萘基， R^3 為氫、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、二甲胺基、乙醯胺基、N-乙醯甲胺基、二乙胺基、乙基甲胺基、丙基甲胺基、苯基、苯氧基、氟、氯、溴、硝基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、N-甲基胺甲醯基、甲氧羰基、甲烷亞磺醯基、乙烷亞磺醯基、甲烷磺醯基、乙烷磺醯基、乙醯基、甲氧甲基、1-甲氧乙基、3-吡啶基、嗎啉基、吡咯烷基、哌啶基、2-氧基吡咯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明（7）

烷基、1-甲氧亞胺乙基、或嗎啉羰基， R^4 為氫、甲基、乙基、氟、氯、硝基、甲氧基、或乙氧基，或 R^3 及 R^4 共同表示 $-O-CH_2-O-$ ，A 為苯環、萘環、吡啶環、或喹啉環、

15) 一種含有如上述 8)~14)任一項記載之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽、或其溶劑化物之醫藥組成物、

16) 如上述 15)記載之醫藥組成物，其為大麻素 2 受體親和性、

17) 如上述 16)記載之醫藥組成物，其為大麻素 2 受體作動性、

18) 如上述 16)記載之醫藥組成物，其為消炎劑、

19) 如上述 16)記載之醫藥組成物，其為免疫抑制劑、

20) 如上述 16)記載之醫藥組成物，其為腎炎治療劑、

21) 一種炎症之治療方法，其特徵為投與上述 1)記載之醫藥組成物、

22) 一種免疫抑制之方法，其特徵為投與上述 1)記載之醫藥組成物、

23) 一種腎炎之治療方法，其特徵為投與上述 1)記載之醫藥組成物、

24) 一種如上述 1)記載之化合物之使用，其係用於製造消炎劑、

25) 一種如上述 1)記載之化合物之使用，其係用於製造免疫抑制劑、

五、發明說明（ 8 ）

26) 一種如上述 1) 記載之化合物之使用，其係用於製造腎炎治療劑。

用以實施發用之最佳型態

以下說明式 (I) 及式 (II) 所示化合物定義中所使用之各用語之意義。各用語在說明書中為統一使用。

所謂「伸烷基」為意指碳數 2~10 個之直鏈狀或分支狀伸烷基，可列舉例如伸乙基、1-甲基伸乙基、1-乙基伸乙基、1,1-二甲基伸乙基、1,2-二甲基伸乙基、1,1-二乙基伸乙基、1,2-二乙基伸乙基、1-乙基-2-甲基伸乙基-伸丙基、1-甲基伸丙基、2-甲基伸丙基、1,1-二甲基伸丙基、1,2-二甲基伸丙基、2,2-二甲基伸丙基、1-乙基伸丙基、2-乙基伸丙基、1,1-二乙基伸丙基、1,2-二乙基伸丙基、2,2-二乙基伸丙基、2-乙基-2-甲基伸丙基、伸丁基、1-甲基伸丁基、2-甲基伸丁基、1,1-二甲基伸丁基、1,2-二甲基伸丁基、2,2-二甲基伸丁基、2,2-二-正丙基伸丙基等。特別以碳數 2~9 個之直鏈狀或分支狀伸烷基、及碳數 2~9 個之分支狀伸烷基為佳。具體而言，以 2,2-二甲基伸丙基、2,2-二乙基伸丙基、1-甲基伸丙基、2-甲基伸丙基、伸丙基、2,2-二-正丙基伸丙基、1,1-二甲基伸乙基、或 1-甲基伸乙基為佳。其位置編號為意指以 N-R¹-S 之順序附上之情況、及以 S-R¹-N 之順序附上之情況。

「亦可經取代之伸烷基」的取代基為伸烷基（例如，亞甲基、伸乙基、伸丙基、伸丁基、伸戊基等）、環烷

五、發明說明(9)

基(例如,環丙基、環丁基、環戊基、環己烷等)、烷氧基(例如,甲氧基、乙氧基等)、烷硫基(例如,甲硫基、乙硫基等)、烷胺基(例如,甲胺基、乙胺基、二甲胺基等)、醯胺基(例如,乙醯胺基等)、芳基(例如,苯基等)、芳氧基(例如,苯氧基等)、鹵素(氟、氯、溴、碘)、羥基、胺基、硝基、烷磺醯基(例如,甲烷磺醯基、乙烷磺醯基等)、芳磺醯基(例如,苯磺醯基等)、氰基、羥胺基、羧基、烷氧羰基(例如,甲氧羰基、乙氧羰基等)、醯基(例如,乙醯基、苄醯基等)、芳烷基(例如,苄基等)、氫硫基、胼基、脒基、胍基等,此些取代基可在1~4個任意位置經取代。「亦可經取代之伸烷基」的取代基特別以伸烷基為佳。

尚,以伸烷基所取代之伸烷基中,包含透過螺原子且經伸烷基所取代之伸烷基(例如,2,2-伸乙基伸丙基、2,2-伸丙基伸丙基、2,2-伸丁基伸丙基、2,2-伸戊基伸丙基等)、及不同位置為經伸烷基所取代之伸烷基(例如,1,2-伸丁基伸乙基、1,2-伸乙基伸丙基等)。具體而言,以2,2-伸乙基伸丙基、2,2-伸丙基伸丙基、2,2-伸丁基伸丙基、2,2-伸戊基伸丙基為佳,且特別以2,2-伸乙基伸丙基、2,2-伸丁基伸丙基,2,2-伸戊基伸丙基為佳。

所謂「烷基」為意指碳數1~10個之直鏈狀或分支狀烷基,可列舉例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、正戊基、異戊基、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明（一〇）

新戊基、正己基、正庚基、正辛基、正壬基、正癸基等。特別以碳數 1~4 個之直鏈狀或分支狀烷基為佳，且具體而言，以甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基為佳。

所謂「烷氧基」為意指以氧原子取代上述「烷基」之基，可列舉例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、正戊氧基、正己氧基、正庚氧基、正辛氧基等。特別以 1~4 個之直鏈狀或分支狀烷氧基為佳，且以甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基為佳。

所謂「烷硫基」為意指以硫原子取代上述「烷基」之基，可列舉例如甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、正丁硫基、異丁硫基、第二丁硫基、第三丁硫基、正戊硫基、正己硫基等。特別以碳數 1~4 個之直鏈狀烷基為佳，且以甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、正丁硫基、異丁硫基、第二丁硫基、第三丁硫基為佳。

「亦可經取代之胺基」的取代基可列舉烷基（例如，甲基、乙基、正丙基、異丙基等）、醯基（例如，甲醯基、乙醯基、丙醯基、苯甲醯基等）等。胺基之氮原子可經此些取代基所單取代或雙取代亦可。

「亦可經取代之胺基」以胺基、甲胺基、乙胺基、正丙胺基、異丙胺基、二甲胺基、二乙胺基、乙基甲胺基

五、發明說明(11)

、乙醯胺基、N-乙醯甲胺基、丙基甲胺基等為佳。

所謂「芳基」為意指碳數6~14個之芳香族碳環基，可列舉例如苯基、萘基、蒽基、菲基等。

所謂「芳烷基」為意指以上述「烷基」取代上述「芳基」之基，可列舉例如苄基、苯乙基(例如，1-苯乙基、2-苯乙基)、苯丙基(例如，1-苯丙基、2-苯丙基、3-苯丙基等)、萘甲基(例如，1-萘甲基、2-萘甲基等)等。

所謂「芳烷氧基」為意指以氧原子取代上述「芳烷基」之基，可列舉例如苄氧基、苯乙氧基(例如，1-苯乙氧基、2-苯乙氧基)、苯丙氧基(例如，1-苯丙氧基、2-苯丙氧基、3-苯丙氧基等)、萘甲氧基(例如，1-萘甲氧基、2-萘甲氧基等)、二苄胺基等。

所謂「烷氧烷基」為意指以上述「烷基」取代上述「烷氧基」之基，可列舉例如甲氧甲基、乙氧甲基、正丙氧甲基、1-甲氧乙基、2-甲氧乙基、1-乙氧乙基、2-乙氧乙基、1-正丙氧基、2-正丙氧乙基、1-甲氧基-正丙基、2-甲氧基-正丙基、3-甲氧基-正丙基、1-乙氧基-正丙基、2-乙氧基-正丙基、3-乙氧基-正丙基、1-正丙氧基-正丙基、2-正丙氧基-正丙基、3-正丙氧基-正丙基等。

所謂「烷硫烷基」為意指以上述「烷基」取代上述「烷硫基」之基，可列舉例如甲硫甲基、乙硫甲基、正丙硫甲基、1-甲硫乙基、2-甲硫乙基、1-乙硫乙基、2-乙硫乙基、1-正丙硫乙基、2-正丙硫乙基、3-正丙硫乙基、1-甲硫正丙基、2-甲硫正丙基、3-甲硫正丙基、1-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(12)

乙硫正丙基、2-乙硫正丙基、3-乙硫正丙基、1-正丙硫正丙基、2-正丙硫正丙基、3-正丙硫正丙基等。

所謂「亦可經取代之胺烷基」為意指以上述「亦可經取代之胺基」取代上述「烷基」之基，可列舉例如 N-甲胺甲基、N-乙醯胺甲基、N,N-二甲胺甲基等。

所謂「烷氧烷氧基」為意指以上述「烷氧基」所取代之上述「烷氧基」，可列舉例如甲氧甲氧基、乙氧甲氧基、正丙氧甲氧基、異丙氧甲氧基、1-甲氧乙氧基、2-甲氧乙氧基等。

所謂「烷硫烷氧基」為意指以上述「烷硫基」所取代之上述「烷氧基」，可列舉例如甲硫甲氧基、乙硫甲氧基、正丙硫甲氧基、異丙硫甲氧基、1-甲硫乙氧基、2-甲硫乙氧基等。

所謂「雜芳基」為意指含有 1~4 個氮原子、氧原子和／或硫原子之碳數 1~9 個之雜芳基，可列舉例如呋喃基(例如，2-呋喃基、3-呋喃基)、噻吩基(例如，2-噻吩基、3-噻吩基)、吡咯基(例如，1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基)、咪唑基(例如，1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基)、吡唑基(例如，1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基)、三唑基(例如，1,2,4-三唑-1-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-4-基)四唑基(例如，1-四唑基、2-四唑基、5-四唑基)、噁唑基(例如，2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基)、異噁唑基(例如，3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基)、噻唑基(例如，2-噻唑基、4-噻唑基、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (13)

5-噻唑基)、噻二唑基、異噻唑基(例如, 3-異噻唑基、4-異噻唑基、5-異噻唑基)、吡啶基(例如, 2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基)、嗒咭基(例如, 3-嗒咭基、4-嗒咭基)、噻啉基(例如, 2-噻啉基、4-噻啉基、5-噻啉基)、呋咭基(例如, 呋咭基)、吡咭基(例如, 2-吡咭基)、嘮二唑基(例如, 1,3,4-嘮二唑-2-基)、苯並呋喃基(例如, 2-苯並[b]呋喃基、3-苯並[b]呋喃基、4-苯並[b]呋喃基、5-苯並[b]呋喃基、6-苯並[b]呋喃基、7-苯並[b]呋喃基)、苯並噻吩基(例如, 2-苯並[b]噻吩基、3-苯並[b]噻吩基、4-苯並[b]噻吩基、5-苯並[b]噻吩基、6-苯並[b]噻吩基、7-苯並[b]噻吩基)、苯並咪唑基(例如, 1-苯並咪唑基、2-苯並咪唑基、4-苯並咪唑基、5-苯並咪唑基)、二苯並呋喃基、苯並嘮唑基、喹啉基(例如 2-喹啉基、5-喹啉基、6-喹啉基)、噻啉基(例如, 3-噻啉基、4-噻啉基、5-噻啉基、6-噻啉基、7-噻啉基、8-噻啉基)、噻唑基(例如, 2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、6-噻唑基、7-噻唑基、8-噻唑基)、噻啉基(例如, 2-噻啉基、3-噻啉基、4-噻啉基、5-噻啉基、6-噻啉基、7-噻啉基、8-噻啉基)、酞咭基(例如, 1-酞咭基、5-酞咭基、6-酞咭基)、異噻啉基(例如, 1-異噻啉基、3-異噻啉基、4-異噻啉基、5-異噻啉基、6-異噻啉基、7-異噻啉基、8-異噻啉基)、嘮咭基、蝶啶基(例如, 2-蝶啶基、4-蝶啶基、6-蝶啶基、7-蝶啶基)、呋唑基、菲啶基、吡啶基(例如, 1-吡啶基、2-

「亦可經取代之芳烷氧基」、「亦可經取代之芳烷硫基」、「亦可經取代之芳烷胺基」、「亦可經取代之芳基」、「亦可經取代之雜芳基」、「亦可經取代之芳氧基」、「亦可經取代之芳香族碳環」、「亦可經取代之

線

五、發明說明(15)

芳香族雜環」及「亦可經取代之非芳香族雜環基」的取代基為烷基、烷氧基、烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、亦可經取代芳氧基、環烷基、鹵素、羥基、硝基、鹵烷基、鹵烷氧基、亦可經取代之胺甲醯基、羧基、烷氧羰基、烷亞磺醯基、烷磺醯基、烷氧烷基、烷硫烷基、亦可經取代之胺烷基、烷氧烷氧基、烷硫烷氧基、亦可經取代之雜芳基、亦可經取代之非芳香族雜環基、烷氧亞胺烷基、式： $-C(=O)-R^H$ (R^H 為氫、烷基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之非芳香族雜環基)所示之基、芳磺醯基(例如，苯磺醯基等)、氰基、羥胺基、芳烷基(例如，苄基等)、氫硫基、胼基、脒基、胍基、異氰基、異氰醯基、硫氰醯基、異硫氰醯基、胺磺醯基、甲醯氧基、鹵甲醯基、草酸根基、硫甲醯基、硫羧基、二硫羧基、硫胺甲醯基、亞磺基、磺基、磺胺基、疊氮基、脲基、脒基、胍基、氧基、硫基等。

此些取代基可在任意位置進行取代。又，於環上之相同或鄰接之位置中，亦可經伸烷二氧基所取代。伸烷二氧基可列舉例如 $-O-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_2-O-$ 。

所謂「芳氧基」為意指以氧原子取代上述「芳基」之基，可列舉例如苯氧基、萘氧基(例如，1-萘氧基、2-萘氧基等)、蔥氧基(例如，1-蔥氧基、2-蔥氧基等)、菲氧基(例如，1-菲氧基、2-菲氧基等)等。

所謂「環烷基」為意指碳數 3~7 個之環烷基，可列舉

五、發明說明 (16)

例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基等。

所謂「鹵素」為意指氟、氯、溴、碘。特別以氟、氯、溴為佳。

所謂「鹵烷基」為意指於上述「烷基」中以 1 個以上鹵素所取代之基，可列舉例如氯甲基、二氯甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯乙基（例如，1-氯乙基、2-氯乙基等）、二氯乙基（例如，1,1-二氯乙基、1,2-二氯乙基、2,2-二氯乙基等）等。

所謂「鹵烷氧基」為意指於上述「烷氧基」中以 1 個以上鹵素所取代之基，可列舉例如二氯甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟乙氧基（2,2,2-三氟乙氧基等）等。

「亦可經取代之胺甲醯基」的取代基可列舉烷基（例如，甲基、乙基、正丙基、異丙基等）、醯基（例如，甲醯基、乙醯基、丙醯基、苯甲醯基等）等。胺甲醯基之氮原子亦可經此些取代基所單取代或雙取代。

「亦可經取代之胺甲醯基」以胺甲醯基、N-甲基胺甲醯基、N-乙基胺甲醯基等為佳。

所謂「烷氧羰基」為意指以羰基取代上述「烷氧基」基，且特別以甲氧羰基、乙氧羰基等為佳。

所謂「烷亞磺醯基」為意指以亞磺醯基取代上述「烷基」之基，且特別以甲烷亞磺醯基、乙烷亞磺醯基等為佳。

所謂「烷磺醯基」為意指以磺醯基取代上述「烷基」

五、發明說明(17)

之基，且特別以甲烷磺醯基、乙烷磺醯基為佳。

所謂「非芳香族雜環基」為意指含有～4個氮原子、氧原子、和／或硫原子之碳數1～9個之非芳香環，可列舉例如1-吡咯啉基、2-吡咯啉基、3-吡咯啉基、吡咯烷基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、1-咪唑啉基、2-咪唑啉基、4-咪唑啉基、1-咪唑啉基、2-咪唑啉基、4-咪唑啉基、1-吡啶啉基、3-吡啶啉基、4-吡啶啉基、1-吡啶啉基、3-吡啶啉基、4-吡啶啉基、哌啶基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、哌嗪基、2-哌嗪基、2-嗎啉基、3-嗎啉基、嗎啉基、四氫吡喃基等。特別以嗎啉基、吡咯烷基、哌啶基、哌嗪基為佳。

「烷氧亞胺烷基」為意指經烷氧亞胺基所取代之上述「烷基」。可列舉例如甲氧亞胺甲基、乙氧亞胺甲基、1-甲氧亞胺乙基等。

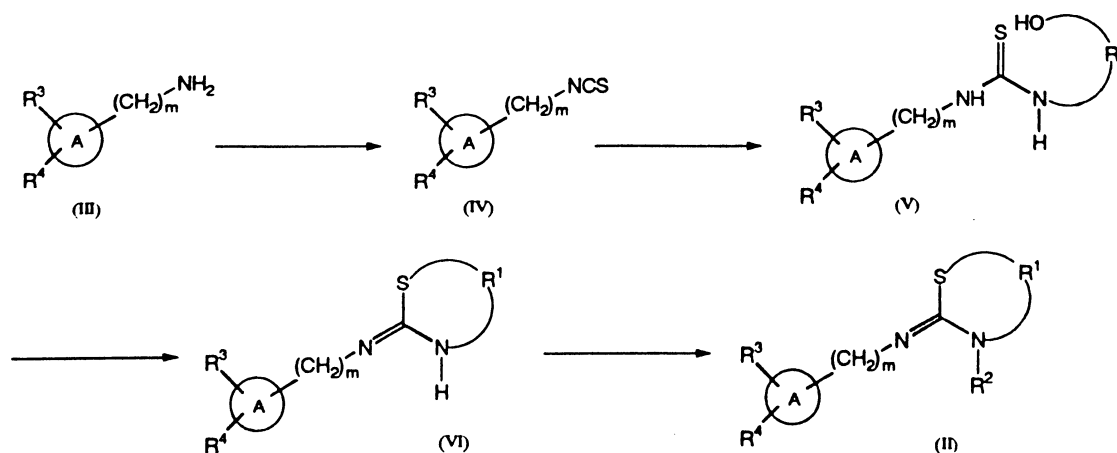
式： $-C(=O)-R^H$ (R^H 為氫、烷基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之非芳香族雜環基)所示之基可列舉例如甲醯基、乙醯基、苯甲醯基、甲苯醯基、嗎啉羰基等。

m 為意指0～2之整數，且特別以 $m=0$ 為佳。

所謂大麻素2受體作動性為意指對於大麻素2受體，顯示出激動作用。

本發明之化合物可根據以下所示之工程進行製造。

五、發明說明 (18)



(式中， R^1 為表示亦可經取代之伸烷基， R^2 為表示烷基、式： $-\text{C}(=\text{R}^5)-\text{R}^6$ (式中， R^5 為表示 O 或 S， R^6 為表示烷基、烷氧基、烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳烷氧基、亦可經取代之芳烷硫基、亦可經取代之芳烷胺基、烷氧烷基、烷硫烷基、或亦可經取代之胺烷基)所示之基、或式： $-\text{SO}_2\text{R}^7$ (式中， R^7 為表示烷基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之雜芳基)所示之基，且 R^3 及 R^4 分別獨立表示氫、烷基、烷氧基、烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、亦可經取代之芳氧基、環烷基、鹵素、羥基、硝基、鹵烷基、鹵烷氧基、亦可經取代之胺甲醯基、羧基、烷氧基、烷亞磺醯基、烷磺醯基、烷氧烷基、烷硫烷基、亦可經取代之胺烷基、烷氧烷氧基、烷硫烷氧基、亦可經取代之雜芳基、亦可經取代之非芳香族雜環基、烷氧亞胺烷基、或式： $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^H$ (R^H 為氫、烷基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之非芳香族雜環基)所示之基，或 R^3 及 R^4 為共同表示伸烷二氧基， m 為表示 0~2 之整數，A

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(19)

爲表示亦可經取代之芳香族碳環或亦可經取代之芳香族雜環)

第 1 工程

將式(Ⅲ)所示化合物之胺基變換成異硫氰酸酯(異硫氰酸酯)，製造式(Ⅳ)所示化合物之工程。

由胺基變換成異硫氰酸酯(異硫氰酸酯)之方法可列舉
① 於氨(NH_3 、 NH_4OH)和三乙胺(Et_3N)等鹼存在下，令二硫化碳(CS_2)作用取得之二硫胺甲醯胺酸鹽，以氯碳酸乙酯(ClCO_2Et)、三乙胺(Et_3N)予以處理之方法、② 將前述之二硫胺甲醯胺酸鹽，以硝酸鉛等金屬鹽予以處理之方法、③ 令硫光氣(CSCl_2)作用之方法、④ 令硫羰基二咪唑作用之方法等。

① 之情況，將鹼(1.0~1.5 當量)及二硫化碳(1.0~1.5 當量)加至化合物(Ⅲ)中，並於非質子性溶劑(例如，二乙醚、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、甲苯、二氯甲烷、氯仿等)中攪拌 0.5 小時~10 小時。其後，加入氯碳酸乙酯(1.0~1.5 當量)及三乙胺(1.0~1.5 當量)，並於非質子性溶劑(例如，二乙醚、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、甲苯、二氯甲烷、氯仿等)中攪拌 0.5~10 小時。反應溫度以 0°C ~ 100°C 爲佳，特別以 0°C ~ 室溫爲佳。

③ 之情況，將硫光氣(1.0~1.5 當量)加至化合物(Ⅲ)中，並於非質子性溶劑(例如，二乙醚、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、二氯甲烷、氯仿等)中攪拌 0.5 小時~

五、發明說明（ $\times 0$ ）

10 小時。反應溫度以 $0^{\circ}\text{C} \sim 100^{\circ}\text{C}$ 為佳，特別以 $0^{\circ}\text{C} \sim$ 室溫為佳。

④之情況，將硫羰基二咪唑（1.0~1.5 當量）加至化合物（Ⅲ）中，並於非質子性溶劑（例如，二乙醚、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、甲苯、二氯甲烷、氯仿等）中攪拌 0.5 小時~10 小時。反應溫度以 $0^{\circ}\text{C} \sim 100^{\circ}\text{C}$ 為佳，特別以 $0^{\circ}\text{C} \sim$ 室溫為佳。

式（Ⅲ）所示之化合物， $m=0$ 之例可列舉苯胺、2-甲基苯胺、2-乙基苯胺、2-正丙基苯胺、2-異丙基苯胺、2-正丁基苯胺、2-第二丁基苯胺、2-第三丁基苯胺、3-甲基苯胺、3-異丙基苯胺、3-異丙基-4-甲基苯胺、3-第三丁基苯胺、4-甲基苯胺、4-異丙基苯胺、2,6-二甲基苯胺、2,3-二甲基苯胺、2,4-二甲基苯胺、3,4-二乙基苯胺、2,5-二甲基苯胺、3,4-二甲基苯胺、3,5-二甲基苯胺、2,6-二乙基苯胺、2,6-二-異丙基苯胺、2-甲氧基苯胺、2-乙氧基苯胺、2-異丙氧基苯胺、3-甲氧基苯胺、3,5-二甲氧基苯胺、3-正丁氧基苯胺、4-正丁氧基苯胺、4-乙氧基苯胺、3,4-二甲氧基苯胺、2-甲硫基苯胺、2-乙硫基苯胺、2-異丙硫基苯胺、2-N,N-二甲胺基苯胺、2-苯基苯胺、3-苯基苯胺、4-苯氧基苯胺、2-環己基苯胺、2-環戊基苯胺、2-硝基苯胺、2,4-二硝基苯胺、2-氟苯胺、2-氯苯胺、4-氯苯胺、2,3-二氯苯胺、3,4-二氯苯胺、2-異丙基-4-硝基苯胺、2-異丙基-6-硝基苯胺、2-羥基苯胺、2-N,N-二甲胺羰基苯胺、2-N-乙醯

五、發明說明(一)

苯胺、2-(1-乙基丙基)苯胺、2-異丙基-4-甲基苯胺、2-異丙基-4-羥基苯胺、2-異丙基-4-氯苯胺、2-異丙基-4-胺基苯胺、2-異丙基-5-甲基苯胺、2-異丙基-5-羥基苯胺、2-異丙基-5-氯苯胺、4-氯-3-甲基苯胺、3,4-甲二氧基苯胺等。

m=1 之例可列舉苯胺、2-甲基苯胺、2-乙基苯胺、2-正丙基苯胺、2-異丙基苯胺、2-正丁基苯胺、2-第二丁基苯胺、2-第三丁基苯胺、3-甲基苯胺、3-異丙基苯胺、3-異丙基-4-甲基苯胺、3-第三丁基苯胺、4-甲基苯胺、4-異丙基苯胺、2,6-二甲基苯胺、2,3-二甲基苯胺、2,4-二甲基苯胺、3,4-二乙基苯胺、2,5-二甲基苯胺、3,4-二甲基苯胺、3,5-二甲基苯胺、2,6-二乙基苯胺、2,6-二-異丙基苯胺、2-甲氧基苯胺、2-乙氧基苯胺、2-異丙氧基苯胺、3-甲氧基苯胺、3,5-二甲氧基苯胺、3-正丁氧基苯胺、4-正丁氧基苯胺、4-乙氧基苯胺、3,4-二甲氧基苯胺、2-甲硫基苯胺、2-乙硫基苯胺、2-異丙硫基苯胺、2-N,N-二甲胺基苯胺、2-苯基苯胺、3-苯基苯胺、4-苯氧基苯胺、2-環己基苯胺、2-環戊基苯胺、2-硝基苯胺、2,4-二硝基苯胺、2-氟苯胺、2-氯苯胺、4-氯苯胺、2,3-二氯苯胺、3,4-二氯苯胺、2-異丙基-4-硝基苯胺、2-異丙基-6-硝基苯胺、2-羥基苯胺、2-N,N-二甲胺羰基苯胺、2-N-乙醯苯胺、2-(1-乙基丙基)苯胺、2-異丙基-4-甲基苯胺、2-異丙基-4-羥基苯胺、2-異丙基-4-氯苯胺、2-異丙基-4-胺基苯胺、2-異丙基

五、發明說明(>>)

-5-甲基苄胺、2-異丙基-5-羥基苄胺、2-異丙基-5-氯苄胺、4-氯-3-甲基苄胺、3,4-甲二氧基苄胺等。

m=2 之例可列舉苯乙胺、2-甲基苯乙胺、2-乙基苯乙胺、2-正丙基苯乙胺、2-異丙基苯乙胺、2-正丁基苯乙胺、2-第三丁基苯乙胺、2-第三丁基苯乙胺、3-甲基苯乙胺、3-異丙基苯乙胺、3-異丙基-4-甲基苯乙胺、3-三丁基苯乙胺、6-甲基苯乙胺、4-異丙基苯乙胺、2,6-二甲基苯乙胺、2,3-二甲基苯乙胺、2,4-二甲基苯乙胺、3,4-二乙基苯乙胺、2,5-二甲基苯乙胺、3,4-二甲基苯乙胺、3,5-二甲基苯乙胺、2,6-二乙基苯乙胺、2,6-二-異丙基苯乙胺、2-甲氧基苯乙胺、2-乙氧基苯乙胺、2-異丙氧基苯乙胺、3-甲氧基苯乙胺、3,5-二甲氧基苯乙胺、3-正丁氧基苯乙胺、4-正丁氧基苯乙胺、4-乙氧基苯乙胺、3,4-二甲氧基苯乙胺、2-甲硫基苯乙胺、2-乙硫基苯乙胺、2-異丙硫基苯乙胺、2-N,N-二甲胺基苯乙胺、2-苯基苯乙胺、3-苯基苯乙胺、4-苯氧基苯乙胺、2-環己基苯乙胺、2-環戊基苯乙胺、2-硝基苯乙胺、2,4-二硝基苯乙胺、2-氟苯乙胺、2-氯苯乙胺、4-氯苯乙胺、2,3-二氯苯乙胺、3,4-二氯苯乙胺、2-異丙基-4-硝基苯乙胺、2-異丙基-6-硝基苯乙胺、2-羥基苯乙胺、2-N,N-二甲胺羰基苯乙胺、2-N-乙醯苯乙胺、2-(1-乙基丙基)苯乙胺、2-異丙基-4-甲基苯乙胺、2-異丙基-4-羥基苯乙胺、2-異丙基-4-氯苯乙胺、2-異丙基-4-胺基苯乙胺、2-異丙基-5-甲基苯乙胺、2-異丙基-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (ㄅ)

5-羥基苯乙胺、2-異丙基-5-氯苯乙胺、4-氯-3-甲基苯乙胺、3,4-甲二氧基苯乙胺等。

第 2 工程

令式 (IV) 所示之化合物的異硫氰酸酯 (異硫氰酸酯)，以 $\text{NH}_2\text{-R}^1\text{-OH}$ 反應，製造式 (V) 所示化合物之工程。

本工程為於非質子性溶劑 (例如，二乙醚、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、甲苯、二氯甲烷、氯仿等) 中進行。

反應溫度以 $0^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ 為佳，且特別以 $0^\circ\text{C} \sim$ 室溫為佳。反應時間以 0.5 小時 $\sim$ 10 小時為佳。

$\text{NH}_2\text{-R}^1\text{-OH}$ (R^1 為亦可經取代之伸烷基) 相對於化合物 (IV) 可使用 1.0 $\sim$ 1.5 當量。

$\text{NH}_2\text{-R}^1\text{-OH}$ 可列舉 2-胺基乙醇、2-胺基-2-甲基乙醇、2-胺基-1-甲基乙醇、2-胺基-1,1-二甲基乙醇、3-胺基丙醇、3-胺基-2,2-二甲基丙醇、3-胺基-1-甲基丙醇、3-胺基-2-甲基丙醇、3-胺基-3-甲基丙醇、3-胺基-2,2-二乙基丙醇、1-胺甲基-1-羥甲基環丙烷、1-胺甲基-1-(羥甲基)環丁烷、2-(胺甲基)環戊醇等。

第 3 工程

令式 (V) 所示化合物閉環、製造式 (VI) 所示化合物之工程。

閉環方法可列舉 ① 以偶氮二羧酸二乙酯 (DEAD) 及三苯膦 (Ph_3P) 處理之方法、② 以鹽酸處理之方法等。

① 之情形，可使用非質子性溶劑 (例如，二乙醚、四

五、發明說明(續)

氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、甲苯、二氯甲烷、氯仿等)等作為溶劑，於 0°C ~ 室溫下進行 0.5 小時 ~ 5 小時。偶氮二羧酸二乙酯 (DEAD) 及三苯膦 (Ph_3P) 分別相對於化合物 (V) 使用 1.0 ~ 1.5 當量即可。

② 之情況為在濃鹽酸中，加熱迴流 0.5 小時 ~ 10 小時即可。

第 4 工程

於式 (VI) 所示之化合物中，導入 R^2 (式： $-\text{C}(=\text{R}^5)-\text{R}^6$ 所示之基或式： $-\text{SO}_2\text{R}^7$ 所示之基)，製造式 (II) 所示化合物之工程。(式中， R^5 為表示 O 或 S， R^6 為表示烷基、烷氧基、烷硫基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳烷氧基、亦可經取代之芳烷硫基、亦可經取代之芳烷胺基、烷氧烷基、烷硫烷基、或亦可經取代之胺烷基、 R^7 為表示烷基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之雜芳基)

本工程為鹼 (例如，三乙胺、吡啶、N,N-二甲胺基吡啶等) 之存在下，以式： $\text{X}-\text{C}(=\text{R}^5)-\text{R}^6$ (式中， R^5 及 R^6 為與前述同義，X 為表示鹵素) 所示之化合物反應則可進行。可根據通常之 N-醯化條件進行，例如，使用非質子性溶劑 (例如，二乙醚、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、甲苯、二氯甲烷、氯仿等) 等作為溶劑，並於 0°C ~ 100°C 下反應 0.5 小時 ~ 10 小時即可。

又，令 R^5 為 S、 R^6 為烷硫基或亦可經取代之芳烷硫基之二硫酸酯化合物，於鹼 (例如，氫化鈉等) 存在下，以二硫化碳 (CS_2) 反應，其次，以鹵化烷基 (例如，碘化甲

五、發明說明 (ㄨ)

烷、碘化乙烷等)或鹵化芳烷基(例如苄基溴等)反應亦可取得。此時,溶劑可使用非質子性溶劑(例如,二乙醚、四氫呋喃、二甲基甲醯胺、苯、甲苯、二氯甲烷、氯仿等),並於 $0^{\circ}\text{C} \sim$ 室溫下進行毫升。

又, R^2 為將式: $-\text{SO}_2\text{R}^7$ (式中, R^7 為表示烷基、亦可經取代之胺基、亦可經取代之芳基、或亦可經取代之雜芳基)所示之基導入時,可令式: $\text{R}^7\text{SO}_2\text{X}$ (式中, X 為鹵素等)所示之化合物於鹼存在下,以式(VI)所示之化合物反應即可。

前體藥物為可在生理學條件下,於生體內變成藥學活性之本發明化合物的化合物。通常之前體藥物衍生物的選擇方法及製造方法例如記載於 Design of Prodrugs, Elsevier, Amsterdam 1985 中。

本發明化合物之前體藥物為在可導入離去基之 A 環上之取代基(例如,胺基、羥基)中,導入離去基則可製造。胺基之前體藥物可列舉胺甲酸酯體(例如,胺甲酸甲酯、胺甲酸環丙基甲酯、胺甲酸第三丁酯、胺甲酸苄酯等)、醯胺體(例如,甲醯胺、乙醯胺等)、N-烷基體(例如, N-芳基胺、N-甲氧基甲胺等)等。羥基之前體藥物可列舉醚體(甲氧基甲醚、甲氧乙氧基甲醚等)、酯體(例如,醋酸酯、特戊酸酯、苯甲酸酯等)等。

製藥上所容許鹽於鹼性鹽可列舉例如鈉鹽、鉀鹽等之鹼金屬鹽;鈣鹽、鎂鹽等之鹼土類金屬鹽;鉍鹽;三甲胺鹽、三乙胺鹽、二環己胺鹽、乙醇胺鹽、二乙醚胺鹽

五、發明說明 (> 6)

、三乙醇胺鹽、普卡因鹽等之脂肪胺鹽；N,N-二苄基乙二胺等之芳烴胺鹽；吡啶鹽、二甲基吡啶鹽、喹啉鹽、異喹啉鹽等之雜環芳香族胺鹽；四甲基銨鹽、四乙基銨鹽、苄基三甲基銨鹽、苄基三乙基銨鹽、苄基三丁基銨鹽、甲基三辛基銨鹽、四丁基銨鹽等之四級銨鹽；精胺酸鹽、離胺酸鹽等之鹼性胺基酸鹽。酸性鹽可列舉例如鹽酸鹽、硫酸鹽、硝酸鹽、磷酸鹽、碳酸鹽、碳酸氫鹽、過氯酸鹽等之無機酸鹽、；醋酸鹽、丙酸鹽、乳酸鹽、順丁烯二酸鹽、反丁烯二酸鹽、酒石酸鹽、蘋果酸鹽、檸檬酸鹽、抗壞血酸鹽等之有機酸鹽；甲烷磺酸鹽、羥乙磺酸鹽、苯磺酸鹽、對-甲苯磺酸鹽等之磺酸鹽；天冬胺酸鹽、麩胺酸鹽等之酸性胺基酸等。

溶劑化物為意指式(I)或式(II)所示之化合物、其前體藥物、其製藥上所容許鹽之溶劑化物，其可列舉例如一溶劑化物、二溶劑化物、一水合物、二水合物等。

本發明化合物為具有大麻素2受體(CB2R)親和性，為選擇性地結合大麻素2受體(CB2R)，並且顯示出CB2R拮抗作用或CB2R激動作用。特別為顯示CB2R激動作用。

又，本發明化合物對於大麻素1受體(CB1R)並無親和性，可迴避來自大麻素1受體(CB1R)之中樞神經系的副作用(幻覺等)，並且亦不會引起大麻素1受體(CB1R)所關連之依賴性。

因此，本發明化合物可於治療或預防大麻素2受體(CB2R)所參與之疾病之目的中使用。例如，於Proc.

五、發明說明 (7)

Natl. Acad. Sci. USA 96, 14228-14223 中, 已記載 CB2 受體激動劑具有消炎作用、鎮痛作用。又, 於 Nature, 1998, 349, 277-281 中已記載 CB2 受體激動劑具有鎮痛作用。又, 於 European Journal of Pharmacology 396(2000)85-92 中已記載 CB2 受體拮抗劑具有鎮痛作用。

即, 本發明化合物為抑制免疫系細胞和發炎系細胞的活化, 並表現末梢細胞系作用(免疫抑制、消炎、鎮痛作用), 可使用作為消炎劑、抗過敏劑、鎮痛劑、免疫不全治療劑、免疫抑制劑、免疫調節劑、自我免疫疾病治療劑、慢性關節風濕病治療劑、多發性硬化症治療劑等。

又, 已知大麻素 2 受體作動劑對於鼠 Thy-1 抗體所惹起之腎炎具有抑制作用, 且亦可用於作為腎炎治療劑。

將本發明化合物使用於治療上, 可作成通常之經口或非經口投與用製劑。含有本發明化合物之醫藥組成物可作成經口及非經口投與用劑型。即, 可作成錠劑、膠囊劑、顆粒劑、散劑、糖漿劑等之經口投與製劑、或、靜脈注射、肌肉注射、皮下注射等之注射用溶液或懸浮液、吸入藥、點眼藥、點鼻藥、栓劑、或軟膏劑等之經皮投與用製劑等之非經口投與製劑。

此些製劑可使用業者熟知的適當載體、賦形劑、溶劑、基劑等予以製造。例如於錠劑之情況, 可將活性成分與輔助成分共同壓縮或者成型。輔助成分為製劑上所容許之賦形劑, 例如可使用黏合劑(例如, 玉米澱粉等)、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (> 8)

充填劑(例如, 乳糖、微結晶性纖維素等)、崩散劑(例如, 澱粉乙醇酸鈉等)或潤滑劑(例如, 硬脂酸鎂等)等。錠劑亦可適當地予以塗層。於糖漿劑、液劑、懸浮劑等之液體製劑之情況, 例如可使用懸浮化劑(例如, 甲基纖維素等)、乳化劑(例如, 卵磷脂等)、保存劑等。於注射用製劑之情況, 可為溶液、懸浮液或油性或水性乳濁液之型態, 且其亦可含有懸浮安定劑或分散劑等。以吸入劑型式供使用時, 可作成適於吸入器之液劑, 以點眼劑使用時亦可作成液劑或懸浮化劑之型式。

本發明化合物之投與量為根據投與型態、患者之症狀、年齡、體重、性別、或所併用之藥物(若有的話)等而異, 但最終為依醫師之判斷而定, 於經口投與之情況, 體重每 1 公斤以 1 日 0.01~100 毫克、較佳為 0.01~10 毫克、更佳為 0.1~10 毫克, 於非經口投與之情況, 體重每 1 公斤以 1 日 0.001~100 毫克、較佳為 0.001~1 毫克、更佳為 0.01~1 毫克。其可分成 1~4 回投與。

實施例

以下列舉實施例詳細說明本發明, 但其單為例示, 並非令本發明限定於此。

尚, 各縮寫為具有以下所示之意義。

Me: 甲基、Et: 乙基、Pr: 丙基、Prⁱ: 異丙基、

Bu: 丁基、Buⁱ: 異丁基、Bu^s: 第二丁基、

Bu^t: 第三丁基、

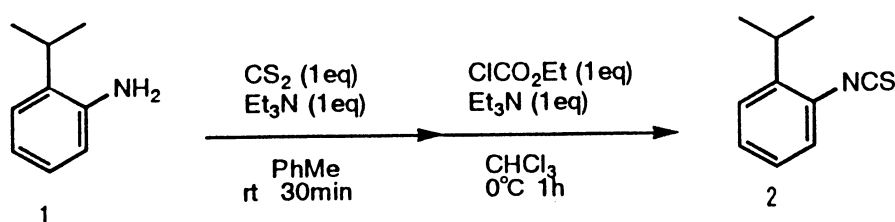
Ph: 苯基、Ac: 乙醯基、Bn: 苄基、

五、發明說明 (9)

DMF: N,N-二甲基甲醯胺、THF: 四氫呋喃、

DEAD: 偶氮二羧酸二乙酯、

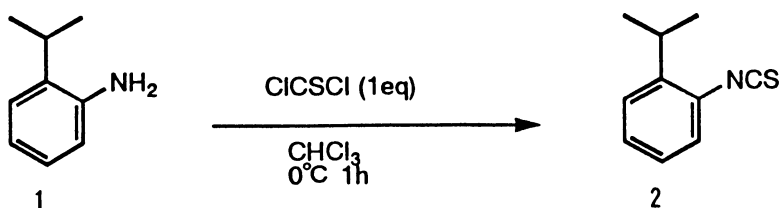
參考例 1-1 異硫氰酸(2-異丙基苯基)酯(化合物 1)之製造



於 2-異丙基苯胺(5.00 克)、三乙胺(3.74 克)、甲苯(10 毫升)之混合液中，將二硫化碳(2.81 克)歷 10 分鐘滴下，且於室溫攪拌 1 小時後，放置 12 小時。將反應液減壓濃縮，加入二氯甲烷(20 毫升)、三乙胺(3.74 克)，並將氯碳酸乙酯(4.01 克)於冰冷下歷 10 分鐘加入，且於室溫攪拌 1 小時。於反應液中加入 10%鹽酸(20 毫升)，以二氯甲烷(60 毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，減壓濃縮，取得黃色油狀物之異硫氰酸(2-異丙基苯基)酯(6.55 克，產率 99%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.25(6H, d, $J=6.7$), 3.25(1H, q, $J=6.7$), 7.14-7.30(4H, m).

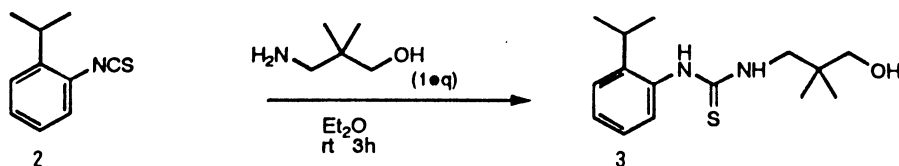
參考例 1-2 異硫氰酸(2-異丙基苯基)酯(化合物 2)之製造



五、發明說明 (30)

於 2-異丙基苯胺 (1.81 克) 之二乙醚 (20 毫升) 溶液中，將硫光氣 (1.54 克) 於冰冷下歷 10 分鐘滴下，且於室溫攪拌 1 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，減壓濃縮，取得褐色油狀物之異硫氰酸 (2-異丙基苯基) 酯 (2.35 克，產率 99%)。

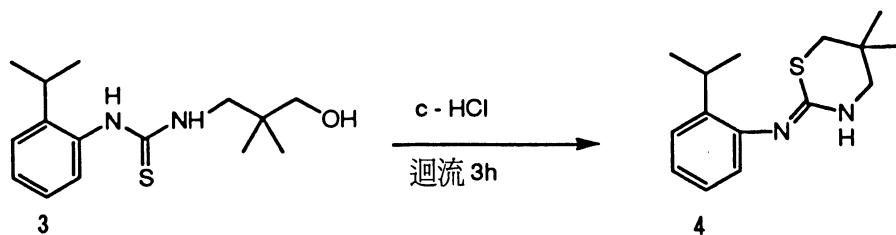
參考例 2 N-(2-異丙基苯基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲 (化合物 3) 之製造



於異硫氰酸 (2-異丙基苯基) 酯 (3.30 克) 之二乙醚 (20 毫升) 溶液中，加入 3-氨基-2,2-二甲基丙醇 (1.92 克)，並於室溫攪拌 1 小時。將反應液減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯) 精製，取得黃色油狀物之 N-(2-異丙基苯基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲 (4.60 克，產率 88%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 0.82(6H, s), 1.25(6H, d, $J=6.7$), 3.11(1H, q, $J=6.7$), 3.25(2H, s), 3.55(2H, d, $J=6.3$), 6.05(1H, m), 7.17-7.40(4H, m).

參考例 3 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噻吡啶 (化合物 4) 之製造



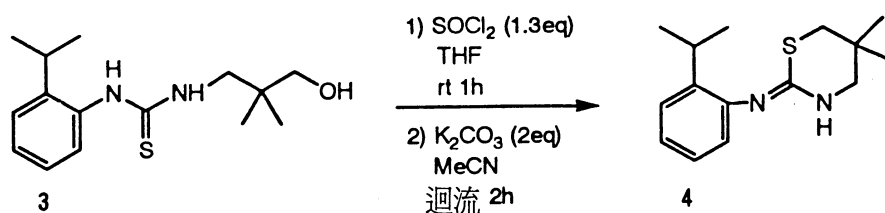
五、發明說明 (31)

於 N-(2-異丙基苯基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲 (10.37 克) 中，加入濃鹽酸 (5 毫升)，並且加熱迴流 3 小時。將反應液冷卻至室溫，並注入 20% 氫氧化鈉水溶液 (25 毫升) 中，濾取析出之結晶，並以醋酸乙酯予以再結晶，取得白色結晶之 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (4.80 克，產率 50%)。

熔點 155-157°C

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.15(6H, s), 1.20(6H, d, $J=6.7$), 2.67(2H, s), 3.09(2H, s), 3.15(1H, q, $J=6.7$), 6.88(1H, m), 7.05-7.11(2H, m), 7.20(1H, m).

參考例 4 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (化合物 4) 之製造

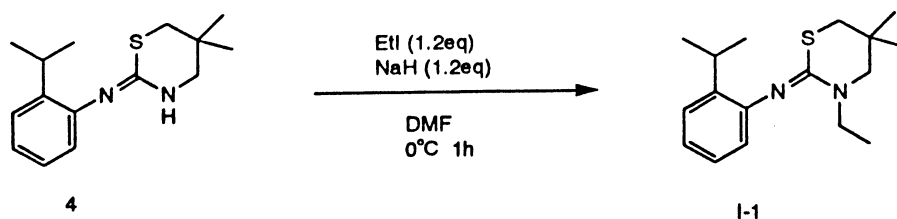


於 N-(2-異丙基苯基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲 (1.00 克) 之四氫呋喃 (6 毫升) 混合液中，滴下亞硫醯氯 (0.60 克)，並於室溫下攪拌 1 小時。將反應液減壓濃縮，且加入乙腈 (20 毫升)、碳酸鉀 (0.93 克)，並加熱迴流 2 小時。於反應液中加入水 (40 毫升)，並以二氯甲烷 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯) 精製，取得白色結晶之 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (0.45 克，產率 48%)。

五、發明說明 (3)

使用參考例 3、4 所得之 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡，進行以下之實施例 1~5。

實施例 1 3-乙基-2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (化合物 I-1) 之製造



於 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (0.26 克)之 N,N-二甲基甲醯胺 (2 毫升)溶液中，將 60% 氫化鈉 (0.05 克)於冰冷下加入，攪拌 30 分鐘後，加入乙基碘 (0.17 克)，並於室溫攪拌 2 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯)精製，取得無色油狀物之 3-乙基-2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (0.21 克，產率 71%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.13 (6H, s), 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.25 (3H, t, $J = 7.4$), 2.61 (2H, s), 3.05 (2H, s), 3.17 (1H, m), 3.64 (2H, q, $J = 6.9$), 6.72-6.80 (1H, m), 6.98-7.07 (2H, m), 7.20-7.32 (1H, m).

實施例 2 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-3-丙醯-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (化合物 I-2) 之製造

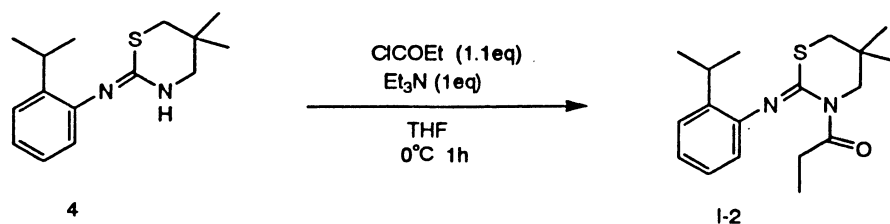
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

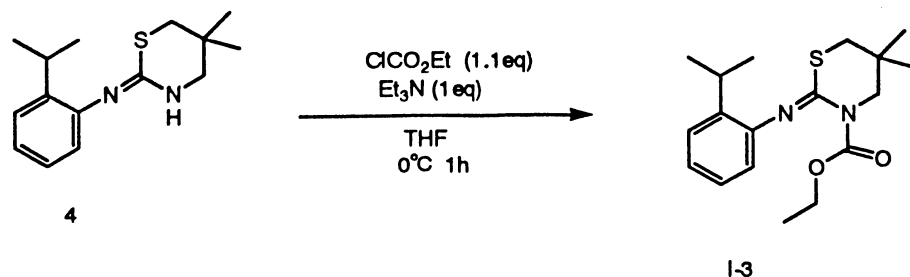
五、發明說明(33)



於 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噻吡
(0.26 克)、三乙胺(0.15 克)、二氯甲烷(5 毫升)之混合
液中，將丙醯氯(0.13 克)歷 5 分鐘滴下，且於室溫攪拌
2 小時。於反應液中加入水(30 毫升)，且以二乙醚(60 毫
升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得
之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷/醋酸乙酯)精製，取得
無色油狀物之 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-3-丙醯
-5,5-二甲基-1,3-噻吡(0.18 克，產率 56%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.22 (3H, t, $J = 7.4$), 2.60 (2H, s), 2.95 (2H, q, $J = 7.4$), 2.96 (1H, q, $J = 6.9$), 3.73 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.10-7.17 (2H, m), 7.25-7.32 (1H, m).

實施例 3 3-(乙氧羰基)-2-(2-異丙基苯基)亞胺基
-5,5-二甲基-1,3-噻吡(化合物 I-3)之製造



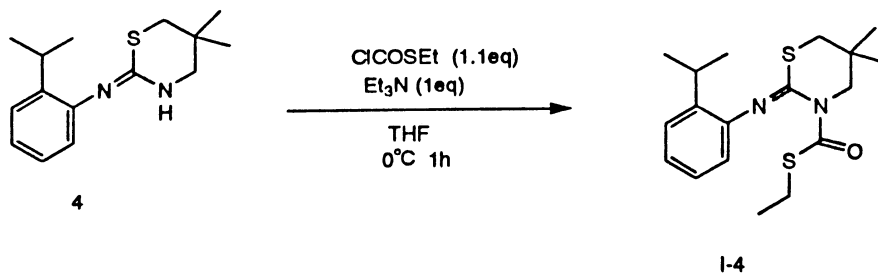
於 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噻吡
(0.26 克)、三乙胺(0.15 克)、二氯甲烷(5 毫升)之混合
液中，將氯碳酸乙酯(0.13 克)歷 5 分鐘滴下，於室溫下

五、發明說明 (34)

攪拌 2 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯) 精製，取得白色結晶之 3-(乙氧羰基)-2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (0.23 克，產率 68%)。熔點 84-86°C。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.16 (6H, s), 1.21 (6H, d, $J = 6.9$), 1.36 (3H, t, $J = 7.1$), 2.59 (2H, s), 3.17 (1H, q, $J = 6.9$), 3.65 (2H, s), 4.32 (2H, q, $J = 7.1$), 6.74-6.78 (1H, m), 7.12-7.16 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).

實施例 4 3-(乙硫羰基)-2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (化合物 I-4) 之製造

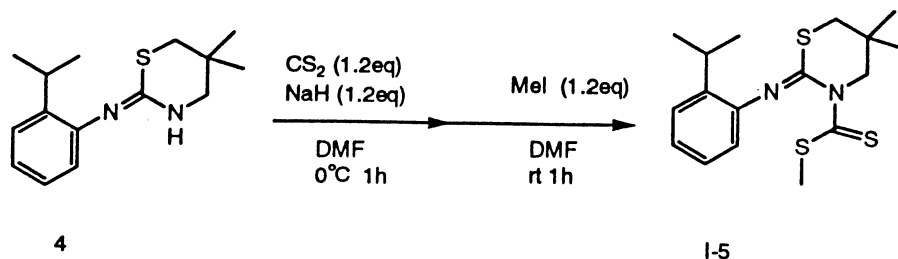


於 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (1.00 克)、三乙胺 (0.58 克)、二氯甲烷 (5 毫升) 之混合液中，將氯硫代碳酸乙酯 (0.56 克) 歷 5 分鐘滴下，且於室溫攪拌 1 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯) 精製，取得無色油狀物之 3-(乙硫羰基)-2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡 (0.74 克，產率 56%)。

五、發明說明 (35)

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.16 (6H, s), 1.21 (6H, d, $J = 6.9$), 1.36 (3H, t, $J = 7.1$), 2.63 (2H, s), 2.89 (2H, q, $J = 7.1$), 3.15 (1H, q, $J = 6.9$), 3.77 (2H, s), 6.79-6.85 (1H, m), 7.12-7.16 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).

實施例 5 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-3-(甲硫基)硫羰基-5,5-二甲基-1,3-噁吡啉(化合物 I-5)之製造



於 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡啉 (0.26 克)、二硫化碳 (0.09 克)、N,N-二甲基甲醯胺 (2 毫升) 之混合液中，將 60% 氫化鈉 (0.05 克) 於冰冷下加入，攪拌 30 分鐘後，加入甲基碘 (0.17 克)，並於室溫攪拌 2 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯) 精製，取得黃色結晶之 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-3-(甲硫基)硫羰基-5,5-二甲基-1,3-噁吡啉 (0.14 克，產率 40%)。熔點 $77-79^\circ\text{C}$ 。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.23 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.11 (1H, q, $J = 6.9$), 4.51 (2H, s), 6.83-6.90 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).

同參考例 2、參考例 3，進行以下之參考例 5。

參考例 5 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-1,3-噁唑烷(化

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

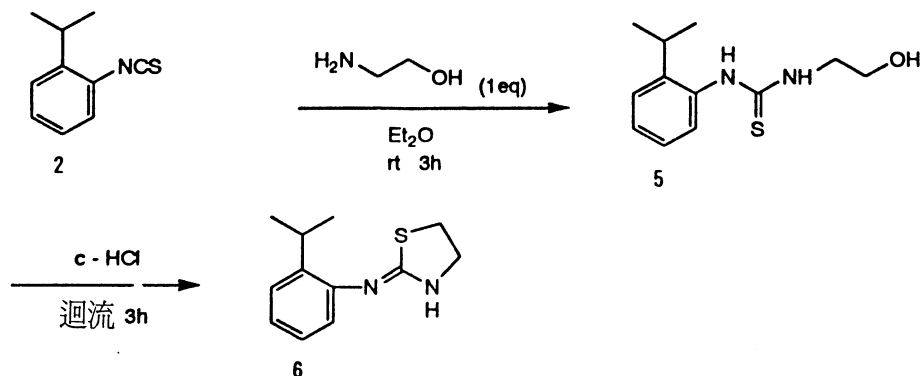
裝

訂

線

五、發明說明 (36)

物 6) 之 製 造



於異硫氰酸(2-異丙基苯基)酯(2.00克)之二乙醚(20毫升)溶液中，加入2-氨基乙醇(0.69克)，並於室溫下攪拌1小時。將反應溶液減壓濃縮所得之油狀物中加入濃鹽酸(5毫升)，並加熱迴流3小時。將反應液冷卻至室溫，注入20%氫氧化鈉水溶液(25毫升)中，並以二氯甲烷(60毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷／醋酸乙酯)精製，取得白色結晶之2-(2-異丙基苯基)亞胺基-1,3-噻唑烷(1.80克，產率73%)。熔點76-77℃。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.20(6H, d, $J=6.7$), 3.15(1H, q, $J=6.7$), 3.27(2H, t, $J=6.7$), 3.67(2H, t, $J=6.7$), 6.95-6.99(1H, m), 7.05-7.19(2H, m), 7.22-7.26(1H, m).

使用參考例5所得之2-(2-異丙基苯基)亞胺基-1,3-噻唑烷，進行以下之實施例6~7。

實施例6 3-(乙硫羰基)-2-(2-異丙基苯基)亞胺基-1,3-噻唑烷(化合物I-6)之製造

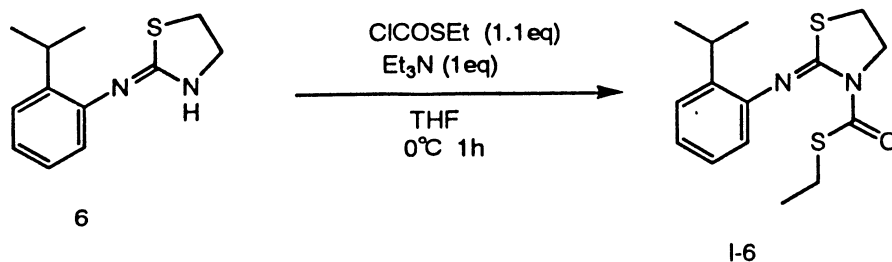
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

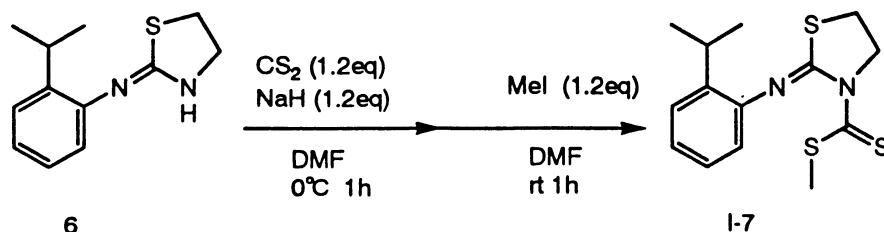
五、發明說明 (37)



於 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-1,3-噁唑烷 (0.25 克)、三乙胺 (0.15 克)、二氯甲烷 (5 毫升) 之混合液中，將氯硫代碳酸乙酯 (0.15 克) 歷 5 分鐘滴下，且於室溫攪拌 2 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯) 精製，取得白色結晶之 3-(乙硫羰基)-2-(2-異丙基苯基)亞胺基-1,3-噁唑烷 (0.27 克，產率 77%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.30 (3H, t, $J = 7.4$), 2.90 (2H, t, $J = 7.4$), 3.15 (2H, t, $J = 7.4$), 3.20 (1H, q, $J = 6.9$), 4.31 (2H, t, $J = 7.4$), 6.79-6.82 (1H, m), 7.07-7.16 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).

實施例 7 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-3-(甲硫基)硫羰基-1,3-噁唑烷 (化合物 I-7) 之製造



於 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-1,3-噁唑烷 (0.22 克)、二硫化碳 (0.09 克)、N,N-二甲基甲醯胺 (2 毫升) 之混合液中，將 60% 氫化鈉 (0.05 克) 於冰冷下加入，攪拌 30

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

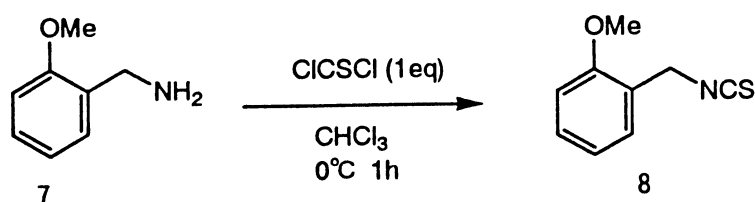
線

五、發明說明 (28)

分鐘後，加入甲基碘 (0.17 克)，並於室溫攪拌 2 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析 (正己烷 / 醋酸乙酯) 精製，取得無色油狀物之 2-(2-異丙基苯基)亞胺基-3-(甲硫基)硫羰基-1,3-噁唑烷 (0.14 克，產率 45%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.23 (6H, d, $J = 6.9$), 2.65 (3H, s), 2.90 (2H, t, $J = 7.4$), 3.20 (1H, q, $J = 6.9$), 4.45 (2H, t, $J = 7.4$), 6.79-6.82 (1H, m), 7.07-7.16 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).

參考例 6 異硫氰酸 (2-甲氧基苯基) 酯 (化合物 8) 之製造



於 2-甲氧基苄胺 (1.80 克) 之二乙醚 (20 毫升) 溶液中，將硫光氣 (1.54 克) 於冰冷下歷 10 分鐘滴下，且於室溫攪拌 1 小時。於反應液中加水 (30 毫升)，且以二乙醚 (60 毫升) 萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，減壓濃縮，取得褐色油狀物之異硫氰酸 (2-甲氧基苄基) 酯 (2.35 克，產率 99%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 3.86 (3H, s), 4.70 (2H, s), 6.88 (1H, d, $J = 7.4$), 6.98 (1H, t, $J = 7.4$), 7.24-7.30 (2H, m).

參考例 7 N-(2-甲氧基苄基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲 (化合物 9) 之製造

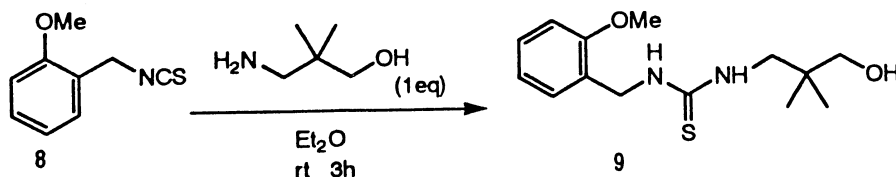
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

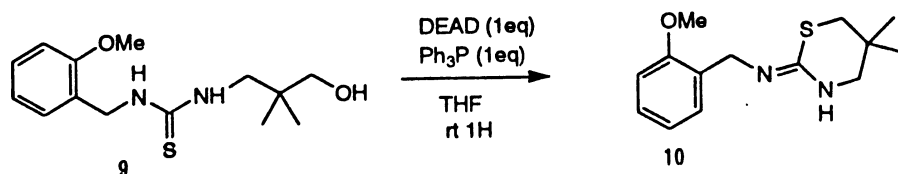
五、發明說明 (39)



於異硫氰酸(2-甲氧基苄基)酯(2.35克)之二乙醚(20毫升)溶液中，加入3-胺基-2,2-二甲基丙醇(1.34克)，並於室溫攪拌1小時。將反應液減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷／醋酸乙酯)精製，取得黃色油狀物之N-(2-甲氧基苄基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲(3.70克，產率99%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 0.82(6H, s), 3.25(2H, s), 3.55(2H, d, $J=6.3$), 3.86(3H, s), 4.70(2H, s), 6.50(1H, brs), 6.88(1H, d, $J=7.4$), 6.95(1H, t, $J=7.4$), 7.24-7.30(2H, m).

參考例 8 2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡啶(化合物10)之製造



於N-(2-甲氧基苄基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲(3.70克)、三苯膦(3.44克)、四氫呋喃(20毫升)之混合液中，將偶氮二羧酸二乙酯(2.28克)歷10分鐘滴下，且於室溫攪拌2小時。於反應液中加水(40毫升)，且以二氯甲烷(90毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷／醋酸乙酯)精製，取得無色油狀物之2-(2-甲氧基苄基)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

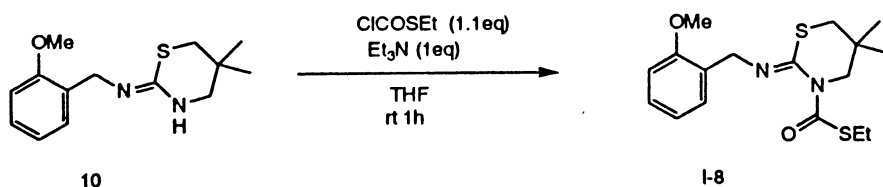
五、發明說明(40)

亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.87克、產率25%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.05(6H, s), 2.75(2H, s), 3.23(2H, s), 3.83(3H, s), 4.41(2H, s), 6.86-6.95(1H, m), 7.20-7.30(1H, m), 7.44-7.48 (2H, m).

使用參考例8所得之2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡, 進行以下之實施例8~9。

實施例8 3-(乙硫羰基)-2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(化合物I-8)之製造



於2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.28克)、三乙胺(0.15克)、二氯甲烷(5毫升)之混合液中, 將氯硫代碳酸乙酯(0.17克)歷5分鐘滴下, 且於室溫攪拌1小時。於反應液中加水(30毫升), 且以二乙醚(60毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後, 將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷/醋酸乙酯)精製, 取得無色油狀物之3-(乙硫羰基)-2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.20克, 產率57%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.15 (6H, s), 1.25 (3H, t, $J = 7.4$), 2.69 (2H, s), 2.83 (2H, q, $J = 7.4$), 3.69 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.61 (2H, s), 6.86 (1H, d, $J = 8.2$), 6.96 (1H, t, $J = 8.2$), 7.26 (1H, t, $J = 8.2$), 7.55 (1H, t, $J = 8.2$).

實施例9 2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-3-(甲硫基)硫羰基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(化合物I-9)之製造

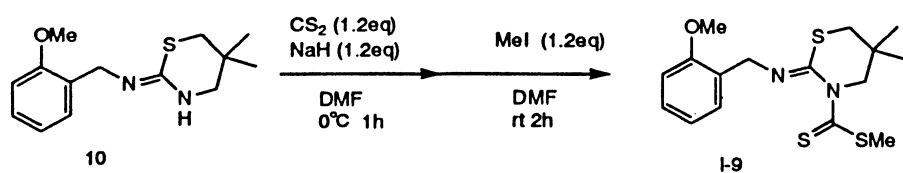
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

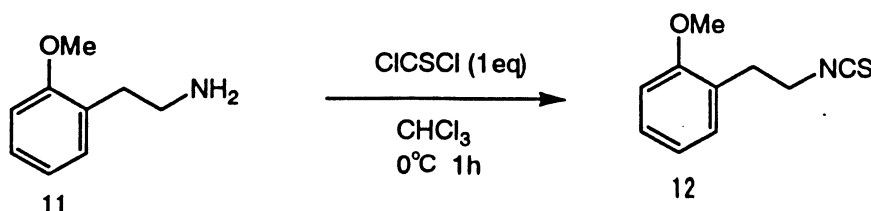
五、發明說明(41)



於 2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噻吡
(0.27 克)、二硫化碳(0.09 克)、N,N-二甲基甲醯胺(2
毫升)之混合液中，將 60%氫化鈉(0.05 克)於冰冷下加
入，攪拌 30 分鐘後，加入甲基碘(0.17 克)，並於室溫
攪拌 2 小時。於反應液中加水(30 毫升)，且以二乙醚(60
毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所
得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷／醋酸乙酯)精製，取
得無色油狀物之 2-(2-甲氧基苄基)亞胺基-3-(甲硫基)
硫羰基-5,5-二甲基-1,3-噻吡(0.20 克，產率 57%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.25 (6H, s), 2.56 (3H, s), 2.72 (2H, s), 3.85
(3H, s), 4.43 (2H, s), 4.63 (2H, s), 6.86-6.88(2H, m), 7.20-7.30 (1H, m), 7.44-7.48
(1H, m).

參考例 9 異硫氰酸(2-甲氧基苄基)酯(化合物 12)之
製造



於 2-甲氧基苄胺(1.98 克)之二乙醚(20 毫升)溶液
中，將硫光氣(1.54 克)於冰冷下歷 10 分鐘滴下，且於
室溫攪拌 1 小時。於反應液中加水(30 毫升)，且以二乙
醚(60 毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，減壓濃

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

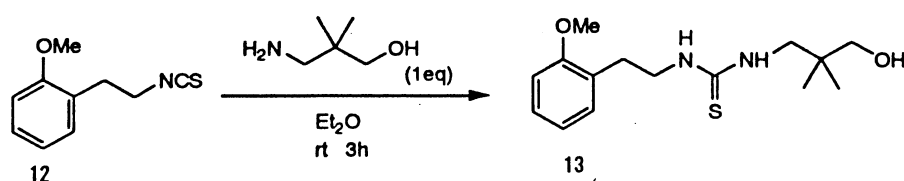
線

五、發明說明(4>)

縮，取得褐色油狀物之異硫氰酸(2-甲氧基苯乙基)酯(1.80克，產率71%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 3.00(2H, t, $J = 7.4$), 3.70(2H, t, $J = 7.4$), 3.86(3H, s), 6.88-6.95(2H, m), 7.15(1H, d, $J = 7.4$), 7.24(1H, t, $J = 7.4$).

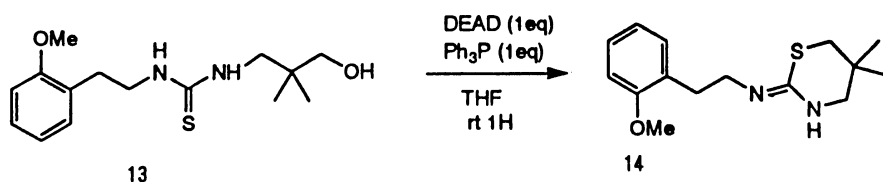
參考例 10 N-(2-甲氧基苯乙基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲(化合物 13)之製造



於異硫氰酸(2-甲氧基苯乙基)酯(2.35克)之二乙醚(20毫升)溶液中，加入3-胺基-2,2-二甲基丙醇(1.34克)，並於室溫攪拌1小時。將反應液減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷/醋酸乙酯)精製，取得黃色油狀物之N-(2-甲氧基苯乙基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙基硫脲(2.45克，產率89%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 0.82(6H, s), 2.90(2H, t, $J = 7.4$), 3.25(2H, s), 3.55(2H, d, $J = 6.3$), 3.70(2H, t, $J = 7.4$), 3.86(3H, s), 6.50(1H, brs), 6.88-6.95(2H, m), 7.15(1H, m), 7.24(1H, m).

參考例 11 2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁啉(化合物 14)之製造



於 N-(2-甲氧基苯乙基)-N'-(1-羥基-2,2-二甲基)丙

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

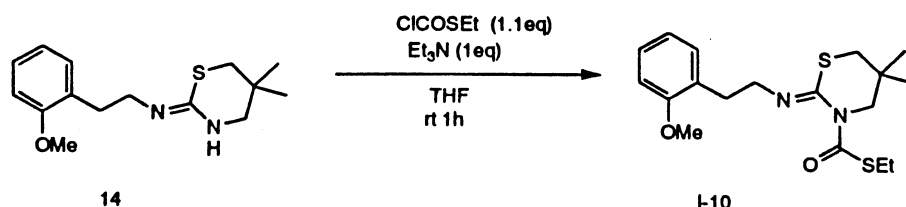
線

五、發明說明(43)

基硫脲(2.40克)、三苯膦(2.12克)、四氫呋喃(20毫升)之混合液中，將偶氮二羧酸二乙酯(2.28克)歷10分鐘滴下，且於室溫攪拌2小時。於反應液中加水(40毫升)，且以二氯甲烷(90毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷／醋酸乙酯)精製，取得無色油狀物之2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.70克、產率31%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.05(6H, s), 2.72(2H, s), 2.80(2H, t, $J = 7.4$), 3.25(2H, s), 3.55(2H, d, $J=6.3$), 3.83(3H, s), 6.83-6.95(2H, m), 7.15(1H, m), 7.24(1H, m).

使用上述參考例11所得之2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡，進以下之實施例10~11。
實施例10 3-(乙硫羰基)-2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(化合物I-10)之製造



於2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.28克)、三乙胺(0.15克)、二氯甲烷(5毫升)之混合液中，將氯硫代碳酸乙酯(0.15克)歷3分鐘滴下，且於室溫攪拌2小時。於反應液中加水(30毫升)，且以二乙醚(60毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷／醋酸乙酯)精製，取得無色油狀物之2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

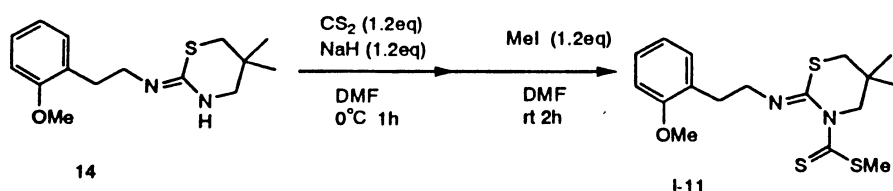
線

五、發明說明(44)

-N-(乙硫基胺甲醯基)-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.21克, 產率 60%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.11 (6H, s), 1.26 (3H, t, $J = 7.4$), 2.61 (2H, s), 2.83 (2H, q, $J = 7.4$), 2.99-3.05 (2H, m), 3.61-3.66 (2H, m), 3.62 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.86-6.91 (2H, m), 7.17-7.26 (2H, m).

實施例 11 2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基-3-(甲硫基)硫羰基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(化合物 I-11)之製造



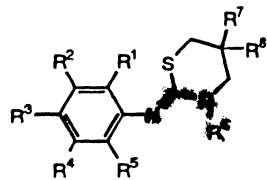
於 1-(1-甲氧基苯乙基)亞胺基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.28克)、二硫化碳(0.09克)、N,N-二甲基甲醯胺(2毫升)之混合液中,將 60%氫化鈉(0.05克)於冰冷下加入,攪拌 30 分鐘後,加入甲基碘(0.17克),並於室溫攪拌 2 小時。於反應液中加水(30 毫升),且以二乙醚(60 毫升)萃取。萃取液以無水硫酸鎂乾燥後,將減壓濃縮所得之殘渣令以矽膠柱層析(正己烷/醋酸乙酯)精製,取得無色油狀物之 2-(2-甲氧基苯乙基)亞胺基-3-(甲硫基)硫羰基-5,5-二甲基-1,3-噁吡(0.18克,產率 50%)。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.19 (6H, s), 2.55 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.05 (2H, t, $J = 7.5$), 3.66 (2H, t, $J = 7.5$), 3.84 (3H, s), 4.35 (2H, s), 6.84-6.91 (2H, m), 7.17-7.30 (2H, m).

同上述實施例處理,合成下表所示之化合物。尚,表中左欄之數字為表示化合物 No.。

五、發明說明(45)

(表1)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-16	H	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-17	F	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-18	Cl	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-19	Me	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-20	Et	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-21	Pr	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-22	Bu	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-23	Bu ^a	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-24	Bu ^t	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-25	Ph	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-26	CF ₃	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-27	OMe	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-28	OEt	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-29	OPr ⁱ	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-30	SMe	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-31	SEt	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-32	SPr ⁱ	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-33	NMe ₂	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-34	H	Pr ⁱ	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-35	H	H	Cl	H	H	COSEt	Me	Me
I-36	H	H	Pr ⁱ	H	H	COSEt	Me	Me
I-37	H	H	NO ₂	H	H	COSEt	Me	Me
I-38	Me	Me	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-39	Me	H	Me	H	H	COSEt	Me	Me
I-40	Me	H	H	Me	H	COSEt	Me	Me
I-41	Me	H	H	H	Me	COSEt	Me	Me
I-42	H	Me	Me	H	H	COSEt	Me	Me
I-43	H	Me	H	Me	H	COSEt	Me	Me
I-44	Me	H	Cl	H	H	COSEt	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

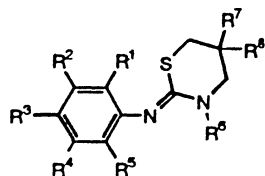
裝

訂

線

五、發明說明(46)

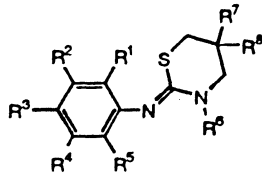
(表 2)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-45	Cl	H	Me	H	H	COSEt	Me	Me
I-46	Pr	H	NO ₂	H	H	COSEt	Me	Me
I-47	Pr	H	H	H	NO ₂	COSEt	Me	Me
I-48	NO ₂	H	NO ₂	H	H	COSEt	Me	Me
I-49	Pr	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-50	Pr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-51	Bu ^s	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-52	H	Pr ⁱ	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-53	H	OMe	OMe	H	H	COSMe	Me	Me
I-54	H	-OCH ₂ O-		H	H	COSMe	Me	Me
I-55	H	OMe	OMe	OMe	H	COSMe	Me	Me
I-56	Et	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-57	Bu ^s	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-58	CH ₂ OMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-59	CH(Me)OMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-60	OMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-61	OEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-62	SMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-63	SEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-64	SPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-65	SOMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-66	SO ₂ Me	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-67	SOEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-68	NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-69	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-70	H	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me

五、發明說明(47)

(表3)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-71	Me	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-72	Me	H	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-73	Me	H	H	H	Me	CSSMe	Me	Me
I-74	H	Me	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-75	H	Me	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-76	OMe	OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-77	H	OMe	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-78	OMe	H	H	OMe	H	CSSMe	Me	Me
I-79	OMe	H	OMe		H	CSSMe	Me	Me
I-80	H	-OCH ₂ O-		H	H	CSSMe	Me	Me
I-81	Pr ⁱ	H	NO ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
I-82	Pr ⁱ	H	H	H	NO ₂	CSSMe	Me	Me
I-83	H	OMe	OMe	OMe	H	CSSMe	Me	Me
I-84	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-85	Bu ^s	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-86	OEt	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-87	SMe	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-88	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-118	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-119	OMe	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-120	OMe	H	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-121	H	OMe	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-122	Me	Me	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-123	N(Me)Ac	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

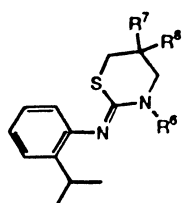
裝

訂

線

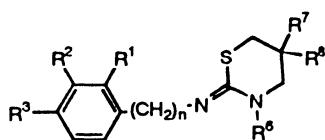
五、發明說明(48)

(表 4)



	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-89	COPr	Me	Me
I-90	COOMe	Me	Me
I-91	COOPr	Me	Me
I-92	CONHEt	Me	Me
I-93	COCH ₂ OMe	Me	Me
I-94	COCH ₂ SMe	Me	Me
I-95	COCH ₂ SEt	Me	Me
I-96	CSOEt	Me	Me
I-97	CSNHEt	Me	Me
I-98	CSSPr	Me	Me
I-99	CSSPr'	Me	Me
I-100	CSSBn	Me	Me

(表 5)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-101	H	H	Cl	1	COSEt	Me	Me
I-102	H	H	Cl	1	CSSMe	Me	Me
I-103	Cl	H	Cl	2	COSEt	Me	Me
I-104	Cl	H	Cl	2	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

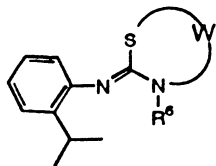
裝

訂

線

五、發明說明 (49)

(表 6)



	R ⁶	W
I-105	COSEt	
I-106	COSEt	
I-107	COSEt	
I-108	COSEt	
I-109	COSEt	
I-110	COSEt	
I-111	COSEt	
I-112	COSEt	
I-113	CSSMe	
I-114	CSSMe	
I-115	CSSMe	
I-116	CSSMe	
I-117	CSSMe	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

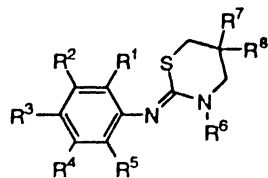
裝

訂

線

五、發明說明(50)

(表 7)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-124	H	H	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-125	H	OEt	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-126	H	H	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-127	H	OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-128	H	OEt	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-129	H	OPr	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-130	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-131	H	H	OPr	H	H	CSSMe	Me	Me
I-132	H	OPr	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-133	H	H	OBu	H	H	CSSMe	Me	Me
I-134	H	OBu	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-135	H	OMe	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-136	H	OMe	OPr	H	H	CSSMe	Me	Me
I-137	H	OBu	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-138	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
I-139	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-140	H	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-141	F	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-142	Cl	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-143	H	Cl	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-144	Me	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-145	H	Me	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-146	H	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-147	H	Bu	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-148	H	H	Bu	H	H	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

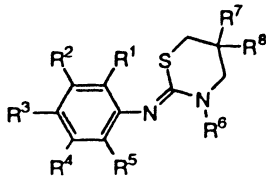
裝

訂

線

五、發明說明(51)

(表 8)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-149	Bu ^t	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-150	H	H	Et	H	H	CSSMe	Me	Me
I-151	H	Et	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-152	H	H	F	H	H	CSSMe	Me	Me
I-153	H	F	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-154	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
I-155	H	H	嗎啉基	H	H	CSSMe	Me	Me
I-156	H	Ac	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-157	H	H	Br	H	H	CSSMe	Me	Me
I-158	H	Br	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-159	Br	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-160	H	C(Me)=NOMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-161	H	H	Ac	H	H	CSSMe	Me	Me
I-162	H	H	C(Me)=NOMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-163	OPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-164	Pr	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-165	CF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-166	H	H	OPh	H	H	CSSMe	Me	Me
I-167	H	H	Pr	H	H	CSSMe	Me	Me
I-168	H	H	Bu ^t	H	H	CSSMe	Me	Me
I-169	H	CF ₃	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-170	H	H	CF ₃	H	H	CSSMe	Me	Me
I-171	Pr ⁱ	H	NHAc	H	H	CSSMe	Me	Me
I-172	Pr ⁱ	H	H	H	NHAc	CSSMe	Me	Me
I-173	H	COOMe	H	H	OMe	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

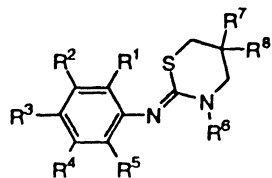
裝

訂

線

五、發明說明 (52)

(表 9)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-174	嗎啉基	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-175	H	嗎啉基	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-176	Pr ⁱ	H	H	COOEt	H	CSSMe	Me	Me
I-177	H	H	哌啶基	H	H	CSSMe	Me	Me
I-178	吡咯烷基	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-179	H	SMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-180	H	H	SMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-181	OCF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-182	H	OCF ₃	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-183	H	H	OCF ₃	H	H	CSSMe	Me	Me
I-184	H	H	3-吡啶基	H	H	CSSMe	Me	Me
I-185	H	3-吡啶基	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-186	3-吡啶基	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-187	OPh	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-188	H	OEt	OEt	H	H	COOMe	Me	Me
I-189	OMe	H	H	H	H	COOMe	Me	Me
I-190	H	H	Et	H	H	COOMe	Me	Me
I-191	H	H	Pr ⁱ	H	H	COOMe	Me	Me
I-192	OMe	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-193	H	H	Et	H	H	COSMe	Me	Me
I-194	H	H	Pr ⁱ	H	H	COSMe	Me	Me
I-195	H	H	OEt	H	H	COSMe	Me	Me
I-196	H	OMe	OEt	H	H	COSMe	Me	Me
I-197	H	哌啶基	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-198	H	H	NEt ₂	H	H	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

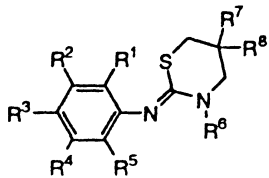
裝

訂

線

五、發明說明 (53)

(表 10)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-199	OMe	H	COOMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-200	H	2- 氧基 吡咯烷基	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-201	H	OPh	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-202	H	H	Ph	H	H	CSSMe	Me	Me
I-203	Ph	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-204	H	Ph	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-205	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSOMe	Me	Me
I-206	Pr ⁱ	H	I	H	H	CSSMe	Me	Me
I-207	OMe	H	(嗎啉基) CO	H	H	CSSMe	Me	Me
I-208	H	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
I-209	H	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-210	N(Me)Et	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-211	N(Me)Pr	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-212	NEt ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-213	F	H	H	H	F	CSSMe	Me	Me
I-214	Pr ⁱ	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
I-215	NMe ₂	Me	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-216	NMe ₂	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-217	NMe ₂	H	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-218	NMe ₂	H	H	Cl	H	CSSMe	Me	Me
I-219	Me	H	H	H	Me	CSSMe	Me	Me
I-220	NMe ₂	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-221	H	NMe ₂	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-222	NMe ₂	H	Me	H	H	CSSEt	Me	Me
I-223	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSEt	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

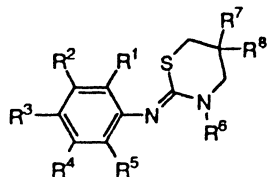
裝

訂

線

五、發明說明(54)

(表 11)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-224	OMe	H	CONHMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-225	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-226	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-227	H	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-228	NMe ₂	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
I-229	NMe ₂	H	F	H	H	CSSMe	Me	Me
I-230	NMe ₂	H	H	F	H	CSSMe	Me	Me
I-231	NMe ₂	H	Et	H	H	CSSMe	Me	Me
I-232	NMe ₂	H	H	Et	H	CSSMe	Me	Me
I-233	NMe ₂	H	Cl	H	H	CSSEt	Me	Me
I-234	NMe ₂	H	F	H	H	CSSEt	Me	Me
I-235	NMe ₂	H	Et	H	H	CSSEt	Me	Me
I-236	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSBu ^s	Me	Me
I-237	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSBu ⁱ	Me	Me
I-238	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSNHMe	Me	Me
I-239	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-240	NMe ₂	OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-241	H	NMe ₂	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-242	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-243	H	NMe ₂	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-244	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
I-245	Pr ⁱ	H	H	H	H	Me	Me	Me
I-246	Pr ⁱ	H	H	H	H	Pr	Me	Me
I-247	Pr ⁱ	H	H	H	H	Pr ⁱ	Me	Me
I-248	Pr ⁱ	H	H	H	H	Bu ⁱ	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

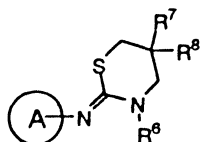
裝

訂

線

五、發明說明 (55)

(表 1 2)



	A	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-249		CSSMe	Me	Me
I-250		CSSMe	Me	Me
I-251		CSSMe	Me	Me
I-252		CSSMe	Me	Me
I-253		CSSMe	Me	Me
I-254		CSSMe	Me	Me
I-255		CSSMe	Me	Me
I-256		CSSMe	Me	Me
I-257		CSSMe	Me	Me
I-258		CSSMe	Me	Me
I-259		CSSMe	Me	Me
I-260		CSSMe	Me	Me
I-261		CSSMe	Me	Me

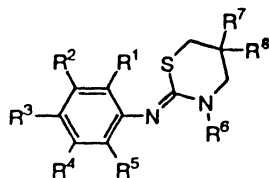
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (56)

(表 1 3)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-262	NMe ₂	H	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-263	NMe ₂	H	H	OMe	H	CSSMe	Me	Me
I-264	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-265	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-266	H	NEt ₂	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-267	Bu ^s	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
I-268	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
I-269	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
I-270	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

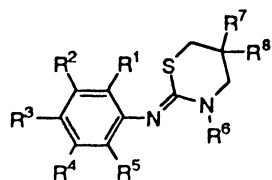
裝

訂

線

五、發明說明 (57)

(表 1 4)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-271	Pr ⁱ	H	H	H	H	SO ₂ Me	Me	Me
I-272	Pr ⁱ	H	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-273	Pr ⁱ	H	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-274	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-275	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ Et	Me	Me
I-276	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-277	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-278	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-279	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-280	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me

上述表中所示化合物之物性數據(融點、¹H-NMR)示於以下表中。

五、發明說明 (58)

(表 15)

化合物 編號	物性	
No	融點	
I-16	57-59°C	1.16 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.64 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.3), 3.78 (2H, s), 6.96 (1H, dd, J = 7.4, 1.2), 7.14 (1H, t, J = 7.4), 7.36 (2H, t, J = 7.4).
I-17		1.15 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.67 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.3), 3.77 (2H, s), 7.10-7.15 (4H, m).
I-18		1.16 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.68 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3), 3.80 (2H, s), 6.96 (1H, dd, J = 7.7, 1.2), 7.08 (1H, dt, J = 7.7, 1.6), 7.25 (2H, t, J = 7.4), 7.40 (1H, d, J = 7.4).
I-19		1.15 (6H, s), 1.27 (3H, t, J = 7.3), 2.24 (3H, s), 2.62 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.83 (1H, d, J = 7.7), 7.04 (1H, t, J = 7.7), 7.16-7.22 (2H, m).
I-20		1.15 (6H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.4), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.62 (2H, q, J = 7.3), 2.65 (2H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.83 (1H, d, J = 7.6), 7.10-7.22 (3H, m).
I-21		0.95 (3H, t, J = 7.3), 1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 1.50-1.64 (2H, m), 2.56 (2H, q, J = 7.3), 2.59 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.82 (1H, d, J = 7.3), 7.06-7.28 (3H, m).
I-22		0.90 (3H, t, J = 7.1), 1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.30-1.34 (2H, m), 1.52-1.58 (2H, m), 2.54 (2H, q, J = 7.1), 2.62 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.79 (1H, dd, J = 7.9, 1.4), 7.06-7.28 (3H, m).
I-23		0.86 (3H, t, J = 7.4), 1.14 (6H, s), 1.16 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.48-1.58 (2H, m), 2.61 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 2.88-2.92 (1H, m), 3.76 (2H, d, J = 13.6), 3.82 (1H, d, J = 13.6), 6.82-6.88 (1H, m), 7.10-7.18 (1H, m), 7.23-7.29 (1H, m).
I-24		1.15 (6H, s), 1.27 (3H, t, J = 7.4), 1.33 (9H, s), 2.68 (2H, s), 2.86 (2H, q, J = 7.4), 3.75 (2H, s), 6.86 (1H, dd, J = 7.4, 1.6), 7.08-7.19 (2H, m), 7.38 (2H, dd, J = 7.4, 1.6).
I-25		0.99 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.45 (2H, s), 2.82 (2H, q, J = 7.4), 3.51 (2H, s), 6.98 (1H, d, J = 7.7), 7.20-7.36 (6H, m), 7.43 (2H, m).
I-26	82-83°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.3), 2.66 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.98 (1H, d, J = 7.6), 7.19 (1H, t, J = 7.6), 7.49 (1H, t, J = 7.6), 7.64 (1H, d, J = 7.6).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (59)

(表 1 6)

化合物 編號	物性	
No	融 點	
I-27		1.16 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.62 (2H, s), 2.88 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.91-6.96 (3H, m), 7.05-7.14 (1H, m).
I-28		1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 1.40 (3H, t, J = 7.0), 2.60 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 4.08 (2H, q, J = 7.0), 6.90-6.94 (3H, m), 7.06-7.08 (1H, m).
I-29		1.14 (6H, s), 1.29 (6H, d, J = 7.4), 1.31 (6H, d, J = 6.0), 2.59 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 4.50 (1H, q, J = 6.0), 6.90-6.93 (3H, m), 7.01-7.07 (1H, m).
I-30	78-80°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.43 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.87-6.91 (1H, m), 7.05-7.14 (2H, m), 7.20-7.29 (1H, m).
I-31	55-57°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.91 (1H, dd, J = 7.4, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.4, 1.6).
I-32		1.15 (6H, s), 1.27 (6H, d, J = 6.6), 1.28 (6H, d, J = 7.4), 2.65 (2H, s), 2.88 (2H, q, J = 7.4), 3.38-3.42 (1H, m), 3.78 (2H, s), 6.90 (1H, dd, J = 7.7, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.7, 1.6).
I-33		1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.60 (2H, s), 2.71 (6H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.90-6.98 (3H, m), 7.05-7.10 (1H, m).
I-34		1.16 (6H, s), 1.27 (6H, d, J = 6.9), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.64 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 2.98 (1H, q, J = 6.9), 3.77 (2H, s), 6.78-6.83 (2H, m), 7.01-7.04 (1H, m), 7.25-7.27 (1H, m).
I-35	68-69°C	1.16 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.3), 2.66 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.3), 3.76 (2H, s), 6.98 (2H, dd, J = 6.6, 2.1), 7.31 (2H, dd, J = 6.6, 2.1).
I-36	67-69°C	1.15 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.26 (3H, t, J = 7.4), 2.64 (2H, s), 2.86 (2H, q, J = 7.4), 2.89 (1H, q, J = 6.9), 3.75 (2H, s), 6.98 (2H, d, J = 8.2), 7.20 (2H, d, J = 8.3).
I-37	125-126°C	1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.3), 2.72 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3), 3.78 (2H, s), 7.05 (2H, d, J = 8.3), 7.31 (2H, d, J = 8.3).
I-38	76-78°C	1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.14 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.70 (1H, d, J = 7.9), 6.94 (1H, d, J = 7.9), 7.06 (1H, s).

五、發明說明 (60)

(表 17)

化合物 編號	物性	
No	融點	
I-39		1.14 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.21 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.73 (1H, d, J = 7.9), 6.97 (1H, d, J = 7.9), 7.02 (1H, s).
I-40		1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.19 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.65 (1H, s), 6.86 (1H, d, J = 7.9), 7.07 (1H, d, J = 7.7).
I-41	59-61°C	1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.3), 2.19 (6H, s), 2.62 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.3), 3.78 (2H, s), 6.90-6.96 (1H, m), 7.02-7.08 (2H, m).
I-42		1.15 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.26 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.74 (1H, dd, J = 7.9, 1.8), 6.80 (1H, d, J = 1.8), 7.13 (1H, d, J = 7.7).
I-43		1.15 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.31 (6H, s), 2.63 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.58 (2H, s), 6.77 (1H, s).
I-44		1.15 (6H, s), 1.28 (3H, t, J = 7.4), 2.21 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.74 (1H, d, J = 8.2), 7.10-7.18 (2H, m).
I-45		1.15 (6H, s), 1.28 (3H, t, J = 7.4), 2.31 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.74 (1H, d, J = 7.8), 7.04 (1H, d, J = 7.8), 7.25 (1H, d, J = 7.8).
I-46	119-120°C	1.16 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.69 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.15 (1H, m), 3.79 (2H, s), 6.92 (1H, d, J = 8.7), 8.01 (1H, dd, J = 8.5, 2.4), 8.18 (1H, d, J = 2.4).
I-47		1.17 (6H, s), 1.23 (6H, d, J = 6.9), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.69 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 3.19 (1H, m), 3.79 (2H, s), 7.41 (1H, d, J = 8.7), 7.71 (1H, d, J = 2.4), 7.92 (1H, dd, J = 8.7, 2.4).
I-48		1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.73 (2H, s), 2.93 (2H, q, J = 7.4), 3.82 (2H, s), 7.15 (2H, d, J = 8.3), 8.48 (1H, dd, J = 8.3, 1.4), 8.90 (1H, d, J = 8.3).
I-49	64-66°C	0.95 (3H, t, J = 7.3), 1.15 (6H, s), 1.50-1.64 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.56 (2H, q, J = 7.3), 2.63 (2H, s), 3.78 (2H, s), 6.82 (1H, d, J = 7.3), 7.06-7.28 (3H, m).
I-50	95-96°C	1.16 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 2.32 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.12 (1H, q, J = 6.9), 3.79 (2H, s), 6.78-6.82 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).

五、發明說明(61)

(表 18)

化合物 編號	物性	
No	融點	
I-51	53-56°C	0.85 (3H, t, J = 7.3), 1.15 (6H, d, J = 6.9), 1.18 (6H, s), 1.57-1.70 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.62 (2H, s), 2.91 (1H, q, J = 6.9), 3.74 (1H, d, J = 13.7), 3.78 (1H, d, J = 13.7), 6.78-6.83 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.23-7.30 (1H, m).
I-52	88-90°C	1.17 (6H, s), 1.27 (6H, d, J = 6.9), 2.33 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.91 (1H, q, J = 6.9), 3.79 (2H, s), 6.78-6.83 (2H, m), 7.01-7.04 (1H, m), 7.20-7.24 (1H, m).
I-53		1.16 (6H, s), 2.32 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.77 (2H, s), 3.87 (6H, s), 6.51-6.59 (2H, m), 6.80-6.89 (1H, m).
I-54	102-104°C	1.15 (6H, s), 2.31 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.76 (2H, s), 5.96 (2H, s), 6.42 (1H, dd, J = 8.1, 1.8), 6.53 (1H, d, J = 1.8), 6.78 (1H, d, J = 8.1).
I-55	129-131°C	1.16 (6H, s), 2.32 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.78 (2H, s), 3.85 (6H, s), 3.86 (3H, s), 6.20 (2H, s).
I-56	107-109°C	1.17 (3H, t, J = 7.6), 1.22 (6H, s), 2.58 (2H, q, J = 7.6), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.91 (1H, dd, J = 7.5, 1.3), 7.02-7.19 (2H, m), 7.23-7.28 (1H, m).
I-57		0.85 (3H, t, J = 7.3), 1.18 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.57-1.70 (2H, m), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.88 (1H, q, J = 6.9), 4.38 (1H, d, J = 13.7), 4.60 (1H, d, J = 13.7), 6.83-6.90 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-58	85-87°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.35 (3H, s), 4.40 (2H, s), 4.48 (2H, s), 6.93-6.99 (1H, m), 7.11-7.29 (2H, m), 7.40-7.49 (1H, m).
I-59	113-114°C	1.22 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.37 (3H, d, J = 6.4), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.24 (3H, s), 4.35 (1H, d, J = 13.6), 4.55 (1H, q, J = 6.4), 4.66 (1H, d, J = 13.6), 6.91 (1H, d, J = 7.4), 7.19-7.40 (2H, m), 7.51 (1H, d, J = 7.4).
I-60	128-130°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.85 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.93-6.99 (2H, m), 7.02-7.15 (2H, m).
I-61	100-101°C	1.26 (6H, s), 1.43 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.67 (3H, s), 4.08 (2H, q, J = 7.0), 4.55 (2H, s), 6.95-6.99 (3H, m), 7.11-7.18 (1H, m).
I-62	137-139°C	1.23 (6H, s), 2.43 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.53 (2H, s), 6.87-6.92 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.23-7.29 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (62)

(表 19)

化合物 編號	物性	
No	融點	
I-63	103- 105°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.91 (1H, dd, J = 7.4, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.4, 1.6).
I-64	125- 126°C	1.24 (6H, s), 1.28 (6H, d, J = 6.6), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.38-3.42 (1H, m), 4.53 (2H, s), 6.97 (1H, dd, J = 7.7, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.7, 1.6).
I-65		1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, d, J = 13.6), 2.75 (3H, s), 4.17 (1H, d, J = 13.6), 4.77 (1H, d, J = 13.6), 7.06 (1H, dd, J = 7.7, 1.7), 7.19-7.40 (2H, m), 7.97 (1H, dd, J = 7.7, 1.7).
I-66	147- 149°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.71 (2H, s), 3.13 (3H, s), 4.52 (2H, s), 7.11 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.23-7.29 (1H, m).
I-67	129- 130°C	1.22 (6H, s), 1.23 (3H, t, J = 6.9), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.70-2.85 (1H, m), 2.90-3.15 (1H, m), 4.25 (1H, d, J = 13.6), 4.70 (1H, d, J = 13.6), 7.06 (1H, d, J = 7.5), 7.30-7.45 (2H, m), 7.90 (1H, d, J = 7.5).
I-68	100- 102°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.71 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.93-6.99 (3H, m), 7.02-7.15 (1H, m).
I-69		1.23 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.92 (1H, q, J = 6.9), 4.52 (2H, s), 6.84-6.86 (2H, m), 7.08-7.13 (1H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-70	116- 118°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.97 (2H, d, J = 8.6), 7.35 (2H, d, J = 8.6).
I-71	103- 105°C	1.22 (6H, s), 2.19 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.79 (1H, d, J = 7.9), 6.98 (1H, d, J = 7.9), 7.02 (1H, s).
I-72	100- 101°C	1.23 (6H, s), 2.18 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.71 (1H, s), 6.88 (1H, d, J = 7.9), 7.08 (1H, t, J = 7.9).
I-73	93-95°C	1.22 (6H, s), 2.12 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 7.9), 6.98 (1H, d, J = 7.9), 7.08 (1H, t, J = 7.9).
I-74	126- 128°C	1.23 (6H, s), 2.25 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 7.9), 6.82 (1H, s), 7.13 (1H, d, J = 7.9).
I-75	96-98°C	1.23 (6H, s), 2.32 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.64 (2H, s), 6.80 (1H, s).
I-76		1.22 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.79 (3H, s), 3.88 (3H, s), 4.52 (2H, s), 6.60 (1H, d, J = 7.9), 6.73 (1H, d, J = 7.9), 7.04 (1H, d, J = 7.9).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (63)

(表 20)

化合物 編號	物性	
No	融點	
I-77		1.24 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.87 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.61-6.65 (2H, m), 6.85-6.89 (1H, m).
I-78		1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.81 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.48 (1H, dd, J = 8.5, 2.4), 6.51 (1H, d, J = 2.4), 6.92 (1H, d, J = 8.5).
I-79		1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.77 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.56 (1H, d, J = 2.4), 6.68 (1H, dd, J = 8.5, 2.4), 6.86 (1H, d, J = 8.5).
I-80	108-110°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.49 (2H, s), 6.04 (2H, s), 6.50 (1H, dd, J = 8.1, 1.8), 6.61 (1H, d, J = 1.8), 6.83 (1H, d, J = 8.1).
I-81		1.23 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 2.65 (3H, s), 2.71 (2H, s), 3.11 (1H, q, J = 6.9), 4.51 (2H, s), 7.02 (1H, d, J = 8.5), 8.04 (1H, dd, J = 8.5, 2.7), 8.21 (1H, d, J = 2.7).
I-82		1.21 (6H, s), 1.24 (6H, d, J = 6.9), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.17 (1H, q, J = 6.9), 4.51 (2H, s), 7.45 (1H, d, J = 8.5), 7.80 (1H, d, J = 2.4), 7.99 (1H, dd, J = 8.5, 2.4).
I-83		1.24 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.85 (6H, s), 3.86 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.28 (2H, s).
I-84	68-70	1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 2.65 (2H, s), 3.11 (1H, q, J = 6.9), 3.25 (2H, q, J = 6.9), 4.48 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-85		0.85 (3H, t, J = 7.4), 1.18 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 1.57-1.70 (2H, m), 2.56 (2H, s), 2.87 (1H, q, J = 6.9), 3.25 (2H, q, J = 7.4), 4.35 (1H, d, J = 13.7), 4.60 (1H, d, J = 13.7), 6.89-6.92 (1H, m), 7.10-7.18 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-86	96-97	1.23 (6H, s), 1.36 (3H, t, J = 7.0), 1.40 (3H, t, J = 7.0), 2.63 (2H, s), 3.27 (2H, q, J = 7.4), 4.06 (2H, q, J = 7.0), 4.51 (2H, s), 6.92-7.08 (3H, m), 7.11-7.15 (1H, m).
I-87	105-106	1.22 (6H, s), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 2.43 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.26 (2H, q, J = 7.4), 4.50 (2H, s), 6.95-6.98 (1H, m), 7.10-7.17 (2H, m), 7.24-7.29 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (64)

(表 2 1)

化合物 編號	物性	
No	融 點	
I-88		1.23 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.90 (1H, q, J = 6.9), 3.28 (2H, q, J = 7.4), 4.50 (2H, s), 6.84-6.88 (2H, m), 7.08-7.13 (1H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-89		0.98 (3H, t, J = 7.4), 1.12 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.72-1.80 (2H, m), 2.58 (2H, s), 2.90 (2H, t, J = 7.4), 3.06 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, s), 6.71-6.76 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-90	99- 101°C	1.14 (6H, s), 1.21 (6H, d, J = 6.9), 2.58 (2H, s), 3.14 (1H, q, J = 6.9), 3.64 (2H, s), 3.86 (3H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-91		1.00 (3H, t, J = 7.3), 1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.74 (2H, q, J = 7.3), 2.58 (2H, s), 3.16 (1H, q, J = 6.9), 3.65 (2H, s), 4.23 (2H, q, J = 6.9), 6.73-6.80 (1H, m), 7.12-7.18 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m).
I-92	52-53°C	1.13 (6H, s), 1.19 (6H, d, J = 6.9), 1.20 (3H, t, J = 7.4), 2.60 (2H, s), 2.98 (1H, q, J = 6.9), 3.38 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.09-7.18 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-93	76-78°C	1.14 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 2.62 (2H, s), 2.96 (1H, q, J = 6.9), 3.48 (3H, s), 3.75 (2H, s), 4.64 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.10-7.17 (2H, m), 7.25-7.32 (1H, m).
I-94	61-62°C	1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 2.23 (3H, s), 2.68 (2H, s), 2.93 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, s), 3.94 (2H, s), 6.82-6.86 (1H, m), 7.10-7.18 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).
I-95	50-52°C	1.13 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.65 (2H, J = 7.3), 2.68 (2H, s), 2.90 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, s), 3.97 (2H, s), 6.82-6.86 (1H, m), 7.12-7.19 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).
I-96	73-75°C	1.21 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.42 (3H, t, J = 6.9), 2.61 (2H, s), 3.10 (1H, q, J = 6.9), 4.15 (2H, s), 4.65 (2H, q, J = 6.9), 6.74-6.78 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-97	160- 162°C	1.18 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.60 (2H, s), 2.90 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, q, J = 7.4), 4.40 (2H, s), 6.74-6.78 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-98		1.04 (3H, t, J = 7.4), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.27 (6H, s), 1.73 (2H, m), 2.64 (2H, s), 3.12 (1H, q, J = 6.9), 3.22 (2H, t, J = 7.4), 4.48 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (65)

(表 2 2)

化合物 編號	物性	
No	融點	
I-99	113- 114	1.04 (6H, d, J = 6.9), 1.27 (6H, s), 1.42 (3H, d, J = 6.9), 2.63 (2H, s), 3.14 (1H, q, J = 6.9), 4.02 (1H, q, J = 6.9), 4.46 (2H, s), 6.89-6.93 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-100		1.10 (6H, d, J = 6.9), 1.22 (6H, s), 2.64 (2H, s), 3.08 (1H, q, J = 6.9), 4.48 (2H, s), 4.49 (2H, s), 6.83-6.90 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.20-7.38 (6H, m).
I-101		1.15 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.70 (2H, s), 2.87 (2H, q, J = 7.4), 3.69 (2H, s), 4.55 (2H, s), 7.30-7.40 (4H, m).
I-102		1.24 (6H, s), 2.57 (3H, s), 2.73 (2H, s), 4.43 (2H, s), 4.58 (2H, s), 7.23-7.40 (4H, m).
I-103		1.11 (6H, s), 1.26 (3H, t, J = 7.4), 2.61 (2H, s), 2.83 (2H, q, J = 7.4), 3.10 (2H, t, J = 7.4), 3.65 (2H, s), 3.66 (2H, t, J = 7.4), 7.17 (1H, dd, J = 8.2, 2.1), 7.30 (1H, t, J = 8.2), 7.36 (1H, d, J = 2.1).
I-104		1.16 (6H, s), 2.55 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.13 (2H, t, J = 7.5), 3.69 (2H, t, J = 7.5), 4.35 (2H, s), 7.15 (1H, dd, J = 8.2, 2.1), 7.25 (1H, t, J = 8.2), 7.36 (1H, d, J = 2.1).
I-105		1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.10-2.22 (2H, m), 2.88 (2H, t, J = 6.4), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.11 (1H, q, J = 6.9), 4.05 (2H, t, J = 7.4), 6.82-6.86 (1H, m), 7.10-7.16 (2H, m), 7.28-7.34 (1H, m).
I-106		1.17-1.30 (12H, m), 1.45-1.52 (1H, m), 1.90-1.96 (1H, m), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 2.95-3.05 (2H, m), 3.14-3.23 (1H, m), 3.72-3.75 (1H, m), 7.20-7.30 (2H, m), 7.40-7.45 (2H, m).
I-107		1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.28 (3H, d, J = 6.6), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.75-1.77 (1H, m), 2.29-2.34 (1H, m), 2.88 (2H, q, J = 7.4), 3.14 (1H, m), 3.31-3.36 (1H, m), 4.01-4.10 (2H, m), 6.81-6.85 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-108		1.12 (3H, d, J = 6.6), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.40-2.50 (1H, m), 2.57 (1H, dd, J = 13.5, 6.6), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 2.95 (1H, m), 3.14 (1H, m), 3.45 (1H, dd, J = 13.5, 8.4), 4.30 (1H, dd, J = 13.5, 8.4), 6.81-6.85 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (bb)

(表 2 3)

化合物 編號	物性	
No	融點	
I-109		0.88 (6H, t, J = 7.5), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.45-1.52 (4H, m), 2.58 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.15 (1H, m), 3.77 (2H, s), 6.78-6.83 (1H, m), 7.08-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-110	109-111°C	1.21 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.81 (2H, q, J = 7.4), 2.90 (1H, t, J = 6.9), 3.05 (2H, s), 7.13-7.30 (2H, m), 7.36-7.45 (2H, m).
I-111		1.21 (6H, d, J = 6.9), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 1.42 (3H, d, J = 6.7), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.23 (1H, q, J = 6.9), 3.69 (1H, q, J = 6.6), 3.87-3.93 (1H, m), 6.78-6.82 (1H, m), 7.08-7.20 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-112		1.19-1.25 (9H, m), 1.14 (3H, d, J = 6.3), 2.76 (1H, d, J = 10.9), 2.96 (2H, t, J = 7.4), 3.22 (1H, q, J = 6.9), 3.44-3.48 (1H, m), 5.12 (1H, q, J = 6.3), 6.81-6.85 (1H, m), 7.09-7.16 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-113	126-128°C	1.18 (6H, d, J = 6.9), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.45 (3H, t, J = 7.4), 1.80-1.91 (1H, m), 2.57-2.64 (2H, m), 2.61 (3H, s), 2.86-2.89 (1H, m), 3.07 (1H, m), 5.95-6.05 (1H, m), 6.98-7.00 (1H, m), 7.12-7.22 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-114		1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.28 (3H, d, J = 6.9), 1.82-1.88 (1H, m), 2.48-2.63 (1H, m), 2.63 (3H, s), 3.11 (1H, m), 3.29-3.35 (1H, m), 4.26 (1H, m), 4.98 (1H, m), 6.90-6.95 (1H, m), 7.15-7.20 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-115		1.14 (3H, d, J = 6.5), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 2.53 (1H, dd, J = 13.0, 5.4), 2.75 (3H, s), 2.80-2.85 (1H, m), 2.95 (1H, dd, J = 13.0, 5.4), 3.11 (1H, m), 3.72 (1H, dd, J = 13.0, 9.0), 5.15 (1H, dd, J = 13.0, 9.0), 6.90-6.95 (1H, m), 7.15-7.25 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-116	119-121°C	0.88 (6H, t, J = 7.5), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.45-1.52 (4H, m), 2.62 (2H, s), 2.64 (3H, s), 3.15 (1H, m), 4.66 (2H, s), 6.78-6.83 (1H, m), 7.08-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-117	99-100°C	0.71-0.79 (1H, m), 0.85-0.90 (2H, m), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.22-1.25 (1H, m), 2.61 (3H, s), 2.79 (3H, s), 3.00-3.05 (1H, m), 4.40 (2H, s), 6.92-6.95 (1H, m), 7.15-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (67)

(表 2 4)

化合物 編號	物性	
No	融 點	
I-118		1.23 (6H, s), 1.45 (6H, t, J = 7.4), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.08 (2H, q, J = 7.0), 4.55 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.85 (1H, d, J = 7.9).
I-119	116- 118°C	1.24 (6H, s), 2.37 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.54 (2H, s), 6.75-6.80 (2H, m), 6.88 (1H, m).
I-120	92-93°C	1.23 (6H, s), 2.27 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.51-6.58 (2H, m), 7.10 (1H, d, J = 7.9).
I-121	129- 130°C	1.22 (6H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.80 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.78-6.95 (3H, m).
I-122	93-95°C	1.22 (6H, s), 2.12 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 7.9), 6.98 (1H, d, J = 7.9), 7.08 (1H, t, J = 7.9).
I-123	151- 152°C	1.22 (6H, s), 1.83 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.17 (3H, s), 4.40 (1H, d, J = 13.6), 4.65 (1H, d, J = 13.6), 7.01 (1H, d, J = 7.9), 7.10-7.15 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(68)

(表 25)

化合物 編號	物性	
No	融點	NMR (CHCl ₃)
I-124	105- 106°C	1.23 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.08 (2H, q, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.88 (2H, d, J=8.6), 6.98 (2H, d, J=8.6).
I-125	92-94°C	1.23 (6H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.08 (2H, q, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.70-6.75 (1H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-126	108- 109°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.81 (3H, s), 4.50 (2H, s), 6.92 (2H, d, J=8.6), 7.04 (2H, d, J=8.6).
I-127	62-64°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.82 (3H, s), 4.50 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.70-6.75 (1H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-128	78-79°C	1.23 (6H, s), 1.44 (3H, t, J=7.0), 2.59 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.82 (3H, s), 4.10 (2H, q, J=7.0), 4.47 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.82-6.87 (1H, m).
I-129	58-60°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.00 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.87 (3H, s), 4.10 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.58-6.64 (2H, m), 6.86-6.91 (1H, m).
I-130		1.13 (6H, s), 1.45 (6H, t, J=7.4), 2.28 (3H, s), 2.62 (2H, s), 3.74 (2H, s), 4.08 (4H, q, J=7.4), 6.46-6.53 (2H, m), 6.88-6.92 (1H, m).
I-131	91-93°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.76 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.91 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.6), 6.98 (2H, d, J=8.6).
I-132	103- 104°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.76 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.91 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.50 (1H, d, J=2.1), 6.60 (1H, d, J=7.4), 6.72 (1H, dd, J=7.4, 2.1), 7.28 (1H, d, J=7.4).
I-133	91-92°C	0.98 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.42-1.48 (2H, m), 1.70-1.80 (2H, m), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.96 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.6), 6.98 (2H, d, J=8.6).
I-134	86-87°C	0.98 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.42-1.48 (2H, m), 1.70-1.80 (2H, m), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.96 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.50 (1H, d, J=2.1), 6.60 (1H, d, J=7.8), 6.72 (1H, dd, J=7.8, 2.1), 7.28 (1H, d, J=7.8).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(69)

(表 2 6)

化合物 編號	物性	
No	融 點	NMR (CHCl ₃)
I-135	69-70°C	1.22 (6H, s), 1.47 (3H, t, J=7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.88 (3H, s), 4.15 (2H, q, J=7.0), 4.51 (2H, s), 6.61 (1H, d, J=8.2), 6.62 (1H, d, J=2.1), 6.88 (1H, d, J=8.2).
I-136	88-89°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.80 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.90 (2H, t, J=7.0), 4.51 (2H, s), 6.61 (1H, dd, J=8.2, 2.1), 6.62 (1H, d, J=2.1), 6.88 (1H, d, J=8.2).
I-137	83-85°C	0.98 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.42-1.48 (2H, m), 1.70-1.80 (2H, m), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.87 (3H, s), 4.03 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=8.2), 6.61 (1H, s), 6.88 (1H, d, J=8.2).
I-138	84-85°C	1.23 (6H, s), 1.34 (6H, d, J=6.1), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 4.53 (1H, sept, J=6.1), 6.89 (2H, d, J=8.6), 7.04 (2H, d, J=8.6).
I-139	92-93°C	1.23 (6H, s), 1.34 (6H, d, J=6.1), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 4.53 (1H, sept, J=6.1), 6.50 (1H, d, J=2.1), 6.60 (1H, d, J=8.0), 6.72 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.28 (1H, d, J=8.0).
I-140	109-110°C	1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 7.04 (2H, d, J=7.5), 7.15 (1H, d, J=7.5), 7.32 (2H, t, J=7.5).
I-141	92-93°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.01-7.08 (1H, m), 7.11-7.15 (3H, m).
I-142	133-135°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.03 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.08 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.25 (1H, t, J=8.0), 7.44 (1H, t, J=8.0).
I-143	92-93°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.88 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.03 (1H, d, J=2.1), 7.15 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.28 (1H, t, J=8.0).
I-144	134-135°C	1.22 (6H, s), 2.22 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 7.00 (1H, d, J=8.1), 7.08 (1H, t, J=8.1), 7.15-7.25 (2H, m).
I-145	87-89°C	1.23 (6H, s), 2.37 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.82 (1H, d, J=8.1), 6.84 (1H, s), 6.98 (1H, d, J=8.1), 7.21 (1H, t, J=8.1).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(70)

(表 27)

化合物 編號	物性	
No	融點	N M R (CHCl ₃)
I-146	91-93°C	1.23 (6H, s), 2.35 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.92 (2H, d, J=8.6), 7.15 (2H, d, J=8.6).
I-147	82-83°C	0.90 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.28-1.40 (2H, m), 1.48-1.55 (2H, m), 2.55 (2H, t, J=7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.90 (1H, d, J=7.8), 7.09 (1H, t, J=7.8), 7.11 (1H, t, J=7.8), 7.28 (1H, d, J=7.8).
I-148	72-73°C	0.90 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.28-1.40 (2H, m), 1.48-1.55 (2H, m), 2.60 (2H, t, J=7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.95 (2H, d, J=8.6), 7.18 (2H, d, J=8.6).
I-149	133-134°C	1.23 (6H, s), 1.35 (9H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.97 (1H, d, J=7.8), 7.13 (1H, t, J=7.8), 7.19 (1H, t, J=7.8), 7.41 (1H, d, J=7.8).
I-150	99-100°C	1.22 (6H, s), 1.23 (3H, t, J=7.4), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.66 (2H, q, J=7.4), 4.50 (2H, s), 6.95 (2H, d, J=8.6), 7.20 (2H, d, J=8.6).
I-151	40-42°C	1.23 (6H, s), 1.24 (3H, t, J=7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.67 (2H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.83 (1H, d, J=8.1), 6.86 (1H, s), 7.00 (1H, d, J=8.1), 7.28 (1H, t, J=8.1).
I-152	118-119°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.97-7.10 (4H, m).
I-153	89-90°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.73-6.90 (3H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-154	111-112°C	1.22 (6H, s), 1.25 (6H, d, J=7.0), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.95 (2H, d, J=8.6), 7.25 (2H, d, J=8.6).
I-155	127-129°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.14-3.18 (4H, m), 3.85-3.90 (4H, m), 4.50 (2H, s), 6.93 (2H, d, J=8.6), 7.04 (2H, d, J=8.6).
I-156	91-93°C	1.24 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.21-7.25 (1H, m), 7.48 (1H, t, J=7.9), 7.61 (1H, t, J=1.8), 7.74-7.78 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(71)

(表 28)

化合物 編號	物性	
	No	融點
NMR (CHCl ₃)		
I-157	103.5- 104.5°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.88-6.94 (2H, m), 7.46-7.51 (2H, m).
I-158	97-98°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.93-6.97 (1H, m), 7.19-7.31 (3H, m).
I-159	155.5- 156.5°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 6.98-7.05 (2H, m), 7.28-7.34 (1H, m), 7.59-7.63 (1H, m).
I-160	102- 106°C	1.23 (6H, s), 2.23 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.52 (2H, s), 7.01-7.05 (1H, m), 7.28 (1H, t, J=1.8), 7.37 (1H, t, J=7.8), 7.45-7.49 (1H, m).
I-161	111- 112°C	1.23 (6H, s), 2.60 (3H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.06-7.10 (2H, m), 7.97-8.03 (2H, m).
I-162	124- 125°C	1.23 (6H, s), 2.23 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.52 (2H, s), 7.00-7.05 (2H, m), 7.65-7.70 (2H, m).
I-163	102- 103.5°C	1.23 (6H, s), 1.32 (6H, d, J=6.3), 2.63 (2H, s), 2.64 (3H, s), 4.52 (2H, s), 4.52 (1H, sept, J=6.3), 6.90-6.98 (3H, m), 7.04-7.13 (1H, m)
I-164	90-92°C	0.94 (3H, t, J=7.3), 1.23 (6H, s), 1.58 (2H, sext, J=7.3), 2.51-2.56 (2H, m), 2.65 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.90 (1H, dd, J=7.6, 1.3), 7.07-7.25 (3H, m)
I-165	157- 158°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.49 (2H, s), 7.08 (1H, d, J=7.9), 7.22 (1H, d, J=7.6), 7.50-7.56 (1H, m), 7.66-7.69 (1H, m)
I-166	145- 146°C	1.24 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.51 (2H, s), 7.00-7.13 (7H, m), 7.30-7.37 (2H, m)
I-167	77-79°C	0.95 (3H, t, J=7.3), 1.23 (6H, s), 1.65 (2H, sext, J=7.3), 2.58 (2H, t, J=7.3), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.93-7.00 (2H, m), 7.14-7.20 (2H, m)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(72)

(表 29)

化合物 編號	物性	
No	融點	NMR (CHCl ₃)
I-168	117- 118°C	1.23 (6H, s), 1.55 (9H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.96-7.01 (2H, m), 7.37-7.42 (2H, m).
I-169	55-56°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.19 (1H, d, J=7.6), 7.26-7.27 (1H, m), 7.40-7.52 (2H, m).
I-170	88-90°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.10 (2H, d, J=8.2), 7.63 (2H, d, J=8.2).
I-171		1.15 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 2.17 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 3.78 (2H, s), 6.80 (1H, d, J=8.2), 7.11-7.18 (1H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-172		1.15 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 2.15 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 3.78 (2H, s), 6.99 (1H, s), 7.11-7.18 (1H, m), 7.28-7.35 (1H, s).
I-173	121- 123°C	1.22 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.89 (3H, s), 4.54 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=8.6), 7.67 (1H, d, J=2.1), 7.87 (1H, dd, J=8.6, 2.1).
I-174	146- 147°C	1.24 (6H, s), 2.59 (2H, s), 2.65 (3H, s), 2.96-2.99 (4H, m), 3.76-3.79 (4H, m), 4.52 (2H, s), 6.98-7.17 (4H, m).
I-175	155- 157°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.16-3.20 (4H, m), 3.84-3.88 (4H, m), 4.51 (2H, s), 6.54-6.57 (2H, m), 6.70-6.74 (1H, m), 7.24-7.30 (1H, m).
I-176		1.22 (6H, d, J=6.6), 1.23 (6H, s), 1.38 (3H, t, J=7.1), 2.65 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.08-3.18 (1H, m), 4.37 (2H, q, J=6.9), 4.52 (2H, s), 7.38 (1H, d, J=7.9), 7.59 (1H, d, J=2.0), 7.82 (1H, dd, J=8.1, 1.8).
I-177	120- 122°C	1.23 (6H, s), 1.50-1.61 (2H, m), 1.67-1.75 (4H, m), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.13-3.17 (4H, m), 4.50 (2H, s), 6.92-7.02 (4H, m).
I-178	124- 125°C	1.23 (6H, s), 1.85-1.90 (4H, m), 2.62 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.22-3.27 (4H, m), 4.48 (2H, s), 6.74-6.80 (2H, m), 6.95-6.98 (1H, m), 7.03-7.10 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (7)

(表 3 0)

化合物 編號	物性	
No	融點	N M R (CHCl ₃)
I-179		1.23 (6H, s), 2.50 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.78-6.82 (1H, m), 6.91 (1H, t, J=2.0), 7.03-7.07 (1H, m), 7.25-7.31 (1H, m).
I-180	102-103°C	1.23 (6H, s), 2.49 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.96-7.01 (2H, m), 7.27-7.31 (2H, m).
I-181	82-83°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 7.07 (1H, dd, J=7.6, 1.7), 7.14-7.20 (1H, m), 7.25-7.34 (2H, m).
I-182		1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.90 (1H, s), 6.93-7.04 (2H, m), 7.38 (1H, t, J=8.2)
I-183	68-70°C	1.24 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.51 (2H, s), 7.01-7.07 (2H, m), 7.21-7.24 (2H, m).
I-184	169-170°C	1.25 (6H, s), 2.66 (3H, s), 2.70 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.13-7.18 (2H, m), 7.34-7.39 (1H, m), 7.59-7.63 (2H, m), 7.86-7.91 (1H, m), 8.58 (1H, dd, J=4.8, 1.6), 8.87 (1H, t, J=1.5)
I-185	92.5-93.5°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.05-7.09 (1H, m), 7.24 (1H, t, J=1.6), 7.34-7.40 (2H, m), 7.49 (1H, t, J=7.6), 7.87-7.92 (1H, m), 8.60 (1H, dd, J=4.9, 1.4), 8.87 (1H, dd, J=2.3, 0.7)
I-186		1.09 (6H, s), 2.56 (3H, s), 2.58 (2H, s), 4.20 (2H, s), 7.09-7.12 (1H, m), 7.24-7.30 (2H, m), 7.36-7.45 (2H, m), 7.75-7.79 (1H, m), 8.54 (1H, dd, J=4.9, 1.6), 8.68 (1H, dd, J=2.3, 0.7)
I-187	110.5-111.5°C	1.17 (6H, s), 2.51 (3H, s), 2.61 (2H, s), 4.33 (2H, s), 6.93-7.19 (7H, m), 7.23-7.30 (2H, m)
I-188	75-76°C	1.14 (6H, s), 1.43 (6H, t, J=7.4), 2.61 (2H, s), 3.65 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.08 (4H, q, J=7.4), 6.46 (1H, dd, J=8.1, 2.2), 6.52 (1H, d, J=2.2), 6.84 (1H, d, J=8.4).
I-189		1.19 (6H, s), 2.61 (2H, s), 3.65 (2H, s), 3.85 (3H, s), 3.88 (3H, s), 6.85-6.99 (3H, m), 7.02-7.15 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(74)

(表 3 1)

化合物 編號	物性	
No	融點	NMR (CHCl ₃)
I-190		1.13 (6H, s), 1.23 (3H, t, J=7.4), 2.62 (2H, s), 2.66 (2H, q, J=7.4), 3.64 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.84 (2H, d, J=8.6), 7.16 (2H, d, J=8.6).
I-191	45-47°C	1.14 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 7.0), 2.62 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 3.64 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.86 (2H, d, J=8.6), 7.19 (2H, d, J=8.6).
I-192	93-95°C	1.15 (6H, s), 2.31 (3H, s), 2.62 (2H, s), 3.80 (2H, s), 3.85 (3H, s), 6.85-6.99 (3H, m), 7.02-7.15 (1H, m).
I-193	65-67°C	1.13 (6H, s), 1.23 (3H, t, J=7.4), 2.31 (3H, s), 2.62 (2H, s), 2.65 (2H, q, J=7.4), 3.77 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.3), 7.21 (2H, d, J=8.3).
I-194	95-97°C	1.15 (6H, s), 1.24 (6H, d, J=7.0), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 3.77 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.6), 7.21 (2H, d, J=8.6).
I-195	94-96°C	1.15 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.77 (2H, s), 4.05 (2H, q, J=7.4), 6.90-6.99 (4H, m).
I-196	99-100°C	1.15 (6H, s), 1.47 (3H, t, J=7.0), 2.32 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.77 (2H, s), 3.88 (3H, s), 4.08 (2H, q, J=7.0), 6.52 (1H, d, J= 8.2), 6.56 (1H, d, J=2.1), 6.88 (1H, d, J=8.2).
I-197	133-134°C	1.23 (6H, s), 1.50-1.75 (6H, m), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.18 (4H, t, J=5.4), 4.51 (2H, s), 6.47-6.57 (2H, m), 6.72-6.76 (1H, m), 7.21 (1H, d, J=8.1)
I-198	124-125°C	1.17 (6H, t, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.35 (4H, q, J=6.9), 4.49 (2H, s), 6.68 (2H, d, J=8.9), 7.04 (2H, d, J=8.9)
I-199	85-87°C	1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.92 (3H, s), 4.54 (2H, s), 7.01 (1H, d, J=7.9), 7.62 (1H, d, J=1.3), 7.67 (1H, dd, J=7.9, 1.7)
I-200	137-138°C	1.23 (6H, s), 2.11-2.22 (2H, m), 2.62 (2H, t, J=7.9), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.88 (2H, t, J=7.1), 4.52 (2H, s), 6.81-6.84 (1H, m), 7.30-7.50 (3H, m)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (15)

(表 3 2)

化合物 編號	物性	
No	融 點	N M R (CHCl ₃)
I-201	86.5- 87.5°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.71 (1H, t, J=2.0), 6.76-6.82 (2H, m), 7.02-7.13 (3H, m), 7.29-7.37 (3H, m)
I-202	162- 163°C	1.25 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.70 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.10-7.14 (2H, m), 7.33-7.46 (3H, m), 7.59-7.63 (4H, m)
I-203	56.5- 57.5°C	1.06 (6H, s), 2.51 (3H, s), 2.59 (2H, s), 4.14 (2H, s), 7.07 (1H, dd, J=8.2, 1.3), 7.21-7.45 (8H, m)
I-204	97-99°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.00-7.04 (1H, m), 7.25-7.26 (1H, m), 7.33-7.48 (5H, m), 7.60-7.63 (2H, m)
I-205	95-96°C	1.21 (6H, s), 1.21 (6H, d, J=6.9), 2.61 (2H, s), 4.13 (3H, s), 4.16 (2H, s), 6.77-6.81 (1H, m), 7.13-7.16 (2H, m), 7.29-7.33 (1H, m)
I-206	128- 129°C	1.18 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.96-3.06 (1H, m), 4.48 (2H, s), 6.67 (1H, d, J=8.2), 7.47 (1H, dd, J=8.2, 1.7), 7.59 (1H, d, J=2.0)
I-207	149- 150°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.71 (8H, m), 3.86 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.95-7.05 (3H, m)
I-208	124- 126°C	1.23 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.67 (2H, s), 2.96 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.74 (2H, d, J=8.2), 7.04 (2H, d, J=8.2).
I-209	107- 109°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.96 (6H, s), 4.51 (2H, s), 6.34 (1H, d, J=2.0), 6.38 (1H, d, J=8.0), 6.54 (1H, dd, J=8.0, 2.0), 7.24 (2H, d, J=8.0).
I-210	98-99°C	1.06 (3H, t, J=7.4), 1.23 (6H, s), 2.63 (5H, s), 2.65 (3H, s), 2.99 (2H, q, J=7.4), 4.51 (2H, s), 6.98-7.10 (3H, m), 7.15-7.20 (1H, m).
I-211	94-96°C	0.84 (3H, t, J = 7.4), 1.22 (6H, s), 1.49 (2H, sext, J = 7.3), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.72 (3H, s), 2.84 (2H, t, J = 7.4), 4.51 (2H, s), 6.90-7.05 (3H, m), 7.10-7.15 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (76)

(表 3 3)

化合物 編號	物性	
	No	融 點
		N M R (CHCl ₃)
I-212	98-99°C	1.02 (6H, t, J=7.4), 1.22 (6H, s), 2.61 (2H, s), 2.63 (3H, s), 3.06 (4H, q, J=7.4), 4.51 (2H, s), 6.98-7.10 (4H, m).
I-213	83-84°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.71 (2H, s), 4.57 (2H, s), 6.90-7.12 (3H, m)
I-214		1.19 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.06 (1H, sept, J=6.9), 4.49 (2H, s), 6.85 (1H, d, J=8.2), 7.14 (1H, dd, J=8.2, 2.3), 7.27 (1H, d, J=2.3)
I-215	83-85°C	1.23 (6H, s), 2.32 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.71 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.75-6.80 (1H, m), 6.98 (1H, s), 6.97-7.00 (1H, m).
I-216	99-100°C	1.23 (6H, s), 2.33 (3H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.78 (2H, t, J=7.9), 6.91 (1H, d, J=7.9).
I-217	98-99°C	1.23 (6H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.67 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.81 (1H, s), 6.92 (2H, s).
I-218	117-19°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.68 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.89 (1H, d, J=8.5), 6.99 (1H, d, J=2.0), 7.04 (1H, dd, J=7.9, 2.0).
I-219	68-70°C	1.22 (6H, s), 2.22 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.54 (2H, s), 6.93-6.98 (1H, m), 7.04 (2H, d, J=8.0).
I-220	97-99°C	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.72 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.94-7.05 (3H, m), 7.15-7.20 (1H, m).
I-221	118-119°C	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.95 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.34 (1H, d, J=7.5), 6.38 (1H, s), 6.52 (1H, d, J=7.5,), 7.24 (1H, t, J=7.5).
I-222	74-76°C	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.33 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.78 (1H, d, J=7.5), 6.82 (1H, s), 6.91 (1H, t, J=7.5).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(77)

(表 3 4)

化合物 編號	物性	
No	融點	N M R (CHCl ₃)
I-223		1.22 (6H, s), 1.25 (6H, d, J=7.0), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.65 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.50 (2H, s), 6.98 (2H, d, J=8.2), 7.28 (2H, d, J = 8.2).
I-224		1.21 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.97 (3H, d, J=4.9), 3.84 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.66 (1H, brs), 6.96 (1H, d, J=7.9), 7.30-7.33 (1H, m), 7.49 (1H, d, J=1.3)
I-225	69-71°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.49 (1H, t, J=74.6), 7.04-7.26 (4H, m)
I-226		1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.50 (1H, t, J=74.2), 7.00-7.05 (2H, s), 7.11-7.16 (2H, m)
I-227	81-83°C	1.17 (6H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.35 (4H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.29 (1H, s), 6.30 (1H, d, t, J=8.2, 2.3), 6.49 (1H, dd, J=8.2, 2.3), 7.19 (1H, t, J=8.2).
I-228	106-107°C	1.21 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.47 (2H, s), 6.90 (2H, s), 6.93 (1H, s).
I-229	121-122°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.48 (2H, s), 6.50-6.70 (2H, m), 6.93 (1H, dd, J=8.5, 6.2).
I-230	85-86°C	1.21 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.66 (6H, s), 4.49 (2H, s), 6.74-6.79 (2H, m), 6.93-6.98 (1H, m).
I-231	82-84°C	1.23 (6H, s), 1.25 (3H, t, J=7.6), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.67 (2H, q, J=7.6), 2.71 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.80 (1H, d, J=7.6), 6.84 (1H, s), 6.93 (1H, d, J=7.6).
I-232	75-76°C	1.22 (3H, t, J=7.6), 1.23 (6H, s), 2.60 (2H, q, J=7.6), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.68 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.83 (1H, s), 6.93 (2H, s).
I-233	86-88°C	1.22 (6H, s), 1.33 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.71 (6H, s), 3.24 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.92 (2H, s), 6.94 (1H, s).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(78)

(表 3 5)

化合物 編號	物性	
No	融點	N M R (CHCl ₃)
I-234	70-71°C	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.71 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.46 (2H, s), 6.60-6.68 (2H, m), 6.92-6.94 (1H, m).
I-235	80-82°C	1.22 (6H, s), 1.24 (3H, t, J=7.6), 1.33 (3H, t, J=7.4), 2.60 (2H, q, J=7.6), 2.61 (2H, s), 2.71 (6H, s), 3.24 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.81 (1H, d, J=7.6), 6.94 (1H, s), 6.94 (1H, d, J=7.6).
I-236		1.03 (3H, t, J=7.3), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 1.40 (3H, d, J=6.9), 1.61-1.89 (2H, m), 2.63 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.95 (1H, q, J=6.9), 4.47 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
I-237		1.05 (6H, d, J=6.6), 1.21 (6H, d, J=6.6), 1.23 (6H, s), 1.98-2.08 (1H, m), 2.64 (2H, s), 3.16 (1H, sept, J=6.6), 3.20 (2H, d, J=6.6), 4.49 (2H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.13-7.22 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m)
I-238	102-104°C	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.61 (2H, s), 2.85-2.95 (1H, m), 3.19 (3H, d, J=4.6), 4.46 (2H, s), 6.73-6.79 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m), 12.40 (1H, brs)
I-239	58-60°C	1.23 (6H, s), 2.17 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.63 (1H, d, J=7.9), 6.87 (1H, d, J=7.9), 7.14 (1H, d, J=7.9).
I-240	100-101°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.78 (6H, s), 3.89 (3H, s), 4.52 (2H, s), 6.60-6.70 (2H, m), 6.94 (1H, d, J=7.9).
I-241	82-83°C	1.23 (6H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.63 (1H, d, t, J=7.9, 1.9), 6.70 (1H, d, J=1.9), 7.14 (1H, d, J=7.9).
I-242	99-100°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 2.81 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.91 (1H, d, t, J=8.4, 2.6), 7.06 (1H, d, J=8.4), 7.14 (1H, d, J=2.6).
I-243	63-64°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 2.78 (6H, s), 3.89 (3H, s), 4.52 (2H, s), 6.67 (1H, s), 6.70 (1H, d, J=7.9), 6.81 (1H, d, J=7.9).
I-244	68-70°C	0.88 (6H, t, J=7.5), 1.22 (6H, d, J=6.9), 1.35 (3H, t, J=7.4), 1.50-1.70 (4H, m), 2.61 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.29 (2H, q, J=7.4), 4.44 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.08-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (79)

(表 3 6)

化合物 編號	物性	
No	融點	NMR (CHCl ₃)
I-245	81-82°C	1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 2.63 (2H, s), 3.06 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.18 (3H, s), 6.74 (1H, dd, J=7.3, 1.7), 6.98-7.10 (2H, m), 7.20-7.24 (1H, m)
I-246	47-49°C	0.95 (3H, t, J=7.3), 1.13 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.55-1.74 (2H, m), 2.62 (2H, s), 3.03-3.11 (3H, m), 3.52-3.57 (2H, m), 6.73 (1H, dd, J=7.6, 1.7), 6.96-7.10 (2H, m), 7.21 (1H, dd, J=7.3, 1.7)
I-247	68-70°C	1.11 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 1.19 (6H, d, J=6.9), 2.56 (2H, s), 2.89 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 5.08 (1H, sept, J=6.9), 6.73 (1H, dd, J=7.9, 1.7), 6.99-7.10 (2H, m), 7.21 (1H, dd, J=7.9, 1.7)
I-248		0.97 (6H, d, J=6.9), 1.14 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 2.05-2.15 (1H, m), 2.62 (2H, s), 3.07 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.44 (2H, d, J=7.6), 6.71 (1H, dd, J=7.6, 1.7), 6.96-7.09 (2H, m), 7.21 (1H, dd, J=7.6, 1.7)
I-249	96-97°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.59 (2H, s), 7.04 (1H, d, J=7.3), 7.41-7.50 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=7.3), 7.87 (1H, dd, J = 7.3, 2.1), 8.05 (1H, d, J=7.3,).
I-250	108-109°C	1.24 (6H, s), 2.67 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.59 (2H, s), 7.15 (1H, d, J=7.3), 7.41 (1H, q, J=7.3), 7.69 (1H, t, J=8.4), 7.91 (1H, d, J=7.3), 8.45 (1H, d, J=8.4), 8.92-8.95 (1H, m).
I-251	105-107°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.97 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.87-6.90 (1H, m), 7.25-7.30 (1H, m), 7.96-7.99 (1H, m).
I-252	132-133°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 2.92 (3H, s), 4.49 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.20-7.23 (1H, m), 8.05-8.07 (1H, m)
I-253	118-120°C	1.23 (6H, s), 2.60 (3H, s), 2.63 (2H, s), 4.52 (2H, s), 7.30 (2H, s), 8.12 (1H, s).
I-254	112-113°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.69 (2H, s), 3.94 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 8.1), 7.35 (1H, dd, J = 8.1, 2.1), 7.92 (1H, d, J = 2.1).
I-255	109-110°C	1.23 (6H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.38 (2H, q, J=7.0), 4.51 (2H, s), 6.75 (1H, d, J=8.1), 7.35 (1H, dd, J=8.1, 2.1), 7.90 (1H, d, J=2.1).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (86)

(表 3 7)

化合物 編號	物性	
	融點	N M R (CHCl ₃)
I-256	75-76°C	1.03 (3H, t, J=7.6), 1.22 (6H, s), 1.76 (2H, sext, J= 7.6), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.24 (2H, t, J=7.6), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J=8.1), 7.35 (1H, dd, J=8.1, 2.1), 7.92 (1H, d, J=2.1).
I-257	74-76°C	1.24 (6H, s), 1.36 (6H, d, J=6.3), 2.63 (3H, s), 2.70 (2H, s), 4.51 (2H, s), 5.28 (1H, sept, J=6.3), 6.70 (1H, d, J=8.1), 7.32 (1H, dd, J=8.1, 2.1), 7.92 (1H, d, J=2.1).
I-258	102- 104°C	1.23 (6H, s), 2.58 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.69 (3H, s), 4.51 (2H, s), 7.20-7.26 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=2.1).
I-259	81-83°C	1.23 (6H, s), 1.38 (3H, t, J=7.3), 2.63 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.18 (2H, q, J=7.3), 4.51 (2H, s), 7.15-7.26 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=2.1).
I-260	78-79°C	1.05 (3H, t, J = 7.4), 1.23 (6H, s), 1.75 (2H, sext, J=7.3), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.15 (2H, t, J=7.4), 4.51 (2H, s), 7.15-7.26 (2H, m), 8.20 (1H, d, J=2.1).
I-261	102- 103°C	1.23 (6H, s), 1.40 (6H, d, J=6.6), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.00 (1H, sept, J=6.6), 4.51 (2H, s), 7.15-7.26 (2H, m), 8.22 (1H, d, J=2.1).
I-262	109- 110°C	1.22 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.80 (3H, s), 4.48 (2H, s), 6.47 (1H, dd, J=7.9, 2.1), 6.56 (1H, d, J=2.1), 6.95 (1H, d, J=7.9).
I-263	99- 100°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.64 (6H, s), 3.78 (3H, s), 4.48 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=2.1), 6.64 (1H, dd, J=7.9, 2.1), 6.98 (1H, d, J=7.9).
I-264	114- 115°C	0.98 (6H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.16 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.98 (4H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.65 (1H, d, J=7.9), 6.89 (1H, d, J=7.9), 7.13 (1H, t, J=7.9).
I-265	66-67°C	0.98 (6H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.16 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.98 (4H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.63 (1H, dd, J=7.9, 2.1), 6.70 (1H, d, J=2.1), 7.16 (1H, d, J = 7.9).
I-266	88-90°C	1.04 (6H, t, J=7.0), 1.24 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.17 (4H, q, J=7.0), 3.86 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.67 (1H, s), 6.70 (1H, d, J=7.9), 6.85 (1H, d, J=7.9).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (81)

(表 3 8)

化合物 編號	物性	
No	融點	N M R (CHCl ₃)
I-267	138- 140°C	0.82-0.92 (9H, m), 1.18 (3H, d, J=6.9), 1.51-1.65 (6H, m), 2.62 (2H, s), 2.65 (3H, s), 2.87 (1H, sept, J=6.9), 4.33 (1H, d, J=13.5), 4.59 (1H, d, J=13.5), 6.89-6.92 (1H, m), 7.13-7.28 (3H, m)
I-268	161- 163°C	0.89-0.95 (6H, m), 1.21 (6H, d, J=6.9), 1.25-1.54 (8H, m), 2.62 (2H, s), 2.65 (3H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 4.47 (2H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.14-7.18 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
I-269		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.65-1.88 (8H, m), 2.64 (3H, s), 2.75 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.57 (2H, s), 6.90-6.94 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m)
I-270		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.37-1.54 (8H, m), 1.76-1.80 (2H, m), 2.65 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.54 (2H, s), 6.89 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (8)

(表 3 9)

化合物 編號	物性	
	No	融 點
I-271		N M R (CHCl ₃)
I-271		1.04 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.29 (6H, d), J=6.9), 2.69(2H, s), 3.40 (1H, sept, J=6.9), 3.43 (3H, s), 3.51 (2H, s), 7.18-7.29 (2H, m), 7.36-7.45 (2H, m)
I-272		0.96 (3H, s), 1.05 (3H, s), 1.25 (3H, d, J=6.9), 1.26 (3H, d, J=6.9), 2.61 (1H, d, J=12), 2.70 (1H, d, J=12), 3.39 (1H, sept, J=6.9), 3.45-3.58 (2H, m), 7.02-7.07 (2H, m), 7.11-7.18 (1H, m), 7.38-7.45 (2H, m), 7.61-7.70 (2H, m)
I-273		0.84 (3H, s), 1.00 (3H, s), 1.25 (3H, d, J=6.9), 1.29 (3H, J=6.9), 2.43 (3H, s), 2.53 (1H, d, J=12), 2.64 (1H, d, J=12), 3.29 (1H, d, J=16), 3.42 (1H, d, J=16), 3.47 (1H, sept, J=6.9), 7.09-7.19 (2H, m), 7.24-7.29 (2H, m), 7.38-7.45 (2H, m), 7.81-7.86 (2H, m)
I-274		0.99 (6H, s), 1.19 (6H, d, J=6.9), 2.40 (3H, s), 2.67 (2H, s), 2.87 (1H, sept, J=6.9), 3.43 (2H, s), 7.11-7.29 (6H, m), 7.68 (2H, d, J=8.1)
I-275		1.07 (6H, s), 1.26 (6H, d, J=6.9), 1.38 (3H, t, J=7.2), 2.71 (2H, s), 2.93 (1H, sept, J=6.9), 3.51 (2H, s), 3.60 (2H, q, J=7.2), 7.20-7.30 (4H, m)
I-276		1.19 (6H, s), 1.23 (6H, d, J=6.9), 2.77 (2H, s), 2.87 (1H, sept, J=6.9), 3.58 (2H, s), 6.65-6.69 (2H, m), 6.91 (1H, d, J=7.5), 7.20 (1H, t, J=7.5), 7.51 (2H, d, J=9.3), 8.22 (2H, d, J=9.3)
I-277		0.99 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 2.67 (2H, s), 2.88 (1H, sept, J=6.9), 3.44 (2H, s), 3.85 (3H, s), 6.86-6.90 (2H, m), 7.11-7.26 (4H, m), 7.72-7.76 (2H, m)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (83)

(表 4 0)

化合物 編號	物性	
No	融點	N M R (CHCl ₃)
I-278		1.03 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 2.70 (2H, s), 2.88 (1H, sept, J=6.9), 3.44 (2H, s), 7.08-7.31 (4H, m), 7.60 (1H, t, J=8.4), 8.04 (1H, d, J=8.4), 8.39 (d, J=8.4), 8.74 (1H, s)
I-279		1.01 (6H, s), 1.19 (6H, d, J=6.9), 2.69 (2H, s), 2.88 (1H, sept, J=6.9), 3.42 (2H, s), 7.09-7.32 (4H, m), 7.68 (2H, d, J=8.4), 7.92 (2H, d, J=8.4),
I-280		1.19 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.23-1.30 (6H, m), 2.62 (1H, d, J=12), 2.82 (1H, sept, J=6.9), 3.02 (1H, d, J=12), 3.46-3.70 (2H, m), 6.53-6.60 (2H, m), 6.86 (1H, d, J=7.8), 7.13 (1H, t, J=7.8), 7.28-7.40 (2H, m), 7.61-7.66 (1H, m), 7.90 (1H, dd, J=7.5, 1.2)

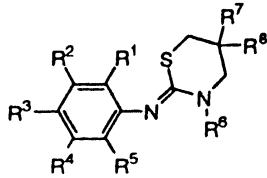
本發明化合物亦包含以下表中所示之化合物。此些化合物可同上述實施例合成。尚、表中左欄之數字為表示化合物 No.。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(84)

(表 4 1 - A)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
A-1	H	Pr	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-2	Pr ⁱ	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
A-3	H	Bu ^s	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-4	H	H	Bu ^s	H	H	CSSMe	Me	Me
A-5	OPr	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-6	OBu	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-7	H	SEt	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-8	H	H	SEt	H	H	CSSMe	Me	Me
A-9	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-10	H	H	SPr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
A-11	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-12	Pr ⁱ	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
A-13	Pr ⁱ	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-14	Et	Et	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-15	H	Et	Et	H	H	CSSMe	Me	Me
A-16	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-17	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-18	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
A-19	H	N(Me)Et	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-20	H	N(Me)Pr	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-21	NPr ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-22	H	NPr ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-23	H	H	NPr ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
A-24	H	NPr ₂	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
A-25	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

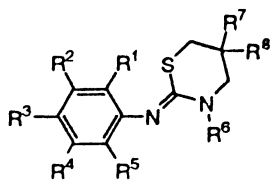
裝

訂

線

五、發明說明 (86)

(表 4 1 - B)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
A-26	H	CH ₃ OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-27	H	H	CH ₃ OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
A-28	CH ₃ OEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-29	H	CH ₃ OEt	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-30	H	H	CH ₃ OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
A-31	CH ₃ SMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-32	H	CH ₃ SMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-33	H	H	CH ₃ SMe	H	H	CSSMe	Me	Me
A-34	CH ₃ SEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-35	H	CH ₃ SEt	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-36	H	H	CH ₃ SEt	H	H	CSSMe	Me	Me
A-37	CH ₃ NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-38	H	CH ₃ NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-39	H	H	CH ₃ NMe ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
A-40	CH ₃ NEt ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-41	H	CH ₃ NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-42	H	H	CH ₃ NEt ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
A-43	OCH ₂ CH ₂ OMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-44	H	OCH ₂ CH ₂ OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-45	H	H	OCH ₂ CH ₂ OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
A-46	OCH ₂ CH ₂ SM	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-47	H	OCH ₂ CH ₂ SMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-48	H	H	OCH ₂ CH ₂ SM	H	H	CSSMe	Me	Me
A-49	OCH ₂ CH ₂ NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-50	H	OCH ₂ CH ₂ NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

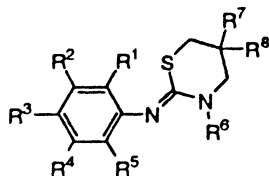
裝

訂

線

五、發明說明 (87)

(表 4 1 - C)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
A-51	H	H	OCH ₂ CH ₂ NMe ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
A-52	F	H	F	H	H	CSSMe	Me	Me
A-53	Cl	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
A-54	OMe	Cl	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-55	OMe	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
A-56	OMe	Me	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-57	OMe	Et	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-58	OMe	H	Et	H	H	CSSMe	Me	Me
A-59	OMe	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
A-60	OMe	H	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
A-61	OMe	H	OPr	H	H	CSSMe	Me	Me
A-62	OMe	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-63	OMe	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-64	OEt	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-65	OEt	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-66	H	OMe	F	H	H	CSSMe	Me	Me
A-67	H	OMe	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
A-68	H	OMe	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
A-69	H	OEt	OPr	H	H	CSSMe	Me	Me
A-70	H	OEt	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
A-71	H	OEt	OBu	H	H	CSSMe	Me	Me
A-72	SMe	SMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-73	SMe	H	SMe	H	H	CSSMe	Me	Me
A-74	NMe ₂	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
A-75	NMe ₂	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

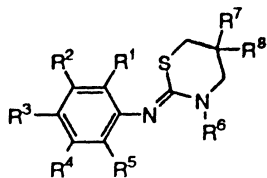
裝

訂

線

五、發明說明 (87)

(表 4 2)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
B-1	H	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-2	Cl	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-3	Br	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-4	Me	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-5	Et	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-6	Bu	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-7	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-9	OEt	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-10	OPr	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-11	OCHF ₂	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-12	OCF ₃	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-13	CF ₃	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-14	SMe	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-15	SEt	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-16	SPr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-17	NMe ₂	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-18	NEt ₂	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-19	H	Cl	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-20	H	Br	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-21	H	Me	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-22	H	Et	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-23	H	Pr	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-24	H	Bu	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-25	H	Bu ⁱ	H	H	H	COSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

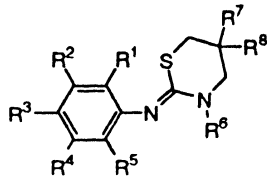
裝

訂

線

五、發明說明 (89)

(表 4 3)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
B-26	H	Bu ^s	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-27	H	Bu ^t	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-28	H	OMe	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-29	H	OEt	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-30	H	OPr	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-31	H	OCHF ₂	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-32	H	OCF ₃	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-33	H	CF ₃	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-34	H	SMe	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-35	H	SEt	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-36	H	SP ^r	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-37	H	NMe ₂	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-38	H	NEt ₂	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-39	H	H	Cl	H	H	COSMe	Me	Me
B-40	H	H	Br	H	H	COSMe	Me	Me
B-41	H	H	Me	H	H	COSMe	Me	Me
B-42	H	H	Pr	H	H	COSMe	Me	Me
B-43	H	H	Bu	H	H	COSMe	Me	Me
B-44	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSMe	Me	Me
B-45	H	H	Bu ^s	H	H	COSMe	Me	Me
B-46	H	H	Bu ^t	H	H	COSMe	Me	Me
B-47	H	H	OMe	H	H	COSMe	Me	Me
B-48	H	H	OEt	H	H	COSMe	Me	Me
B-49	H	H	OPr	H	H	COSMe	Me	Me
B-50	H	H	OCHF ₂	H	H	COSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

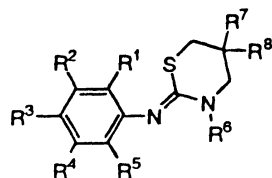
裝

訂

線

五、發明說明(89)

(表 4 4)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
B-51	H	H	OCF ₃	H	H	COSMe	Me	Me
B-52	H	H	CF ₃	H	H	COSMe	Me	Me
B-53	H	H	SMe	H	H	COSMe	Me	Me
B-54	H	H	SEt	H	H	COSMe	Me	Me
B-55	H	H	SPr ⁱ	H	H	COSMe	Me	Me
B-56	H	H	NMe ₂	H	H	COSMe	Me	Me
B-57	H	H	NEt ₂	H	H	COSMe	Me	Me
B-58	Me	Me	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-59	H	Me	Me	H	H	COSMe	Me	Me
B-60	Et	Et	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-61	H	Et	Et	H	H	COSMe	Me	Me
B-62	OMe	Me	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-63	OMe	H	Me	H	H	COSMe	Me	Me
B-64	NMe ₂	Me	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-65	H	NMe ₂	Me	H	H	COSMe	Me	Me
B-66	Me	NMe ₂	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-68	Me	NEt ₂	H	H	H	COSMe	Me	Me
B-69	H	NEt ₂	Me	H	H	COSMe	Me	Me
B-70	Pr ⁱ	H	F	H	H	COSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

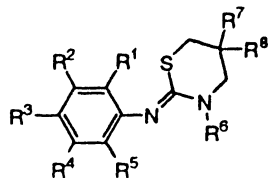
裝

訂

線

五、發明說明(90)

(表 4 5)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
C-1	H	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-2	Cl	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-3	Br	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-4	Me	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-5	Et	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-6	Pr	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-7	Bu	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-10	OMe	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-11	OPr	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-12	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-13	OCF ₃	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-14	CF ₃	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-15	SEt	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-16	SPr ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-17	NEt ₂	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-18	H	Cl	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-19	H	Br	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-20	H	Me	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-21	H	Et	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-22	H	Pr	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-23	H	Bu	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-24	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-25	H	Bu ^s	H	H	H	CSSEt	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

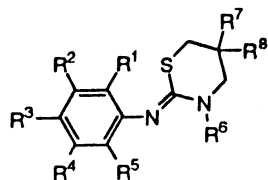
裝

訂

線

五、發明說明(91)

(表46)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
C-26	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-27	H	OMe	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-28	H	OEt	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-29	H	OPr	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-30	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-31	H	OCF ₃	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-32	H	CF ₃	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-33	H	SMe	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-34	H	SEt	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-35	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-36	H	NEt ₂	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-37	H	H	Cl	H	H	CSSEt	Me	Me
C-38	H	H	Br	H	H	CSSEt	Me	Me
C-39	H	H	Me	H	H	CSSEt	Me	Me
C-40	H	H	Et	H	H	CSSEt	Me	Me
C-41	H	H	Pr	H	H	CSSEt	Me	Me
C-42	H	H	Bu	H	H	CSSEt	Me	Me
C-43	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSEt	Me	Me
C-44	H	H	Bu ^s	H	H	CSSEt	Me	Me
C-45	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSEt	Me	Me
C-46	H	H	OMe	H	H	CSSEt	Me	Me
C-47	H	H	OEt	H	H	CSSEt	Me	Me
C-48	H	H	OPr	H	H	CSSEt	Me	Me
C-49	H	H	OCHF ₂	H	H	CSSEt	Me	Me
C-50	H	H	OCF ₃	H	H	CSSEt	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

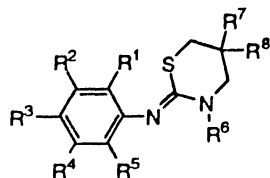
裝

訂

線

五、發明說明(92)

(表 47)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
C-51	H	H	CF ₃	H	H	CSSEt	Me	Me
C-52	H	H	SMe	H	H	CSSEt	Me	Me
C-53	H	H	SEt	H	H	CSSEt	Me	Me
C-54	H	H	SP ⁱ	H	H	CSSEt	Me	Me
C-55	H	H	NMe ₂	H	H	CSSEt	Me	Me
C-56	H	H	NEt ₂	H	H	CSSEt	Me	Me
C-57	Me	Me	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-58	H	Me	Me	H	H	CSSEt	Me	Me
C-59	Et	Et	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-60	H	Et	Et	H	H	CSSEt	Me	Me
C-61	OMe	Me	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-62	OMe	H	Me	H	H	CSSEt	Me	Me
C-63	NMe ₂	Me	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-64	H	NMe ₂	Me	H	H	CSSEt	Me	Me
C-65	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-66	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-67	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSEt	Me	Me
C-68	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSEt	Me	Me
C-69	Pr ⁱ	H	F	H	H	CSSEt	Me	Me
C-70	OMe	H	OMe	H	H	CSSEt	Me	Me
C-71	H	OMe	OMe	H	H	CSSEt	Me	Me
C-72	H	OMe	OEt	H	H	CSSEt	Me	Me
C-73	H	OEt	OMe	H	H	CSSEt	Me	Me
C-74	H	OEt	OEt	H	H	CSSEt	Me	Me
C-75	OMe	H	Me	H	H	CSSEt	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

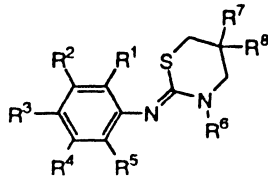
裝

訂

線

五、發明說明 (43)

(表 4 8)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
D-1	Br	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-2	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-3	OPr	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-4	OCHF ₂	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-5	OCF ₃	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-6	NEt ₂	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-7	H	Cl	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-8	H	Br	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-9	H	Et	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-10	H	Pr	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-11	H	Bu	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-12	H	Bu ⁱ	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-13	H	Bu ^s	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-14	H	Bu ^t	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-15	H	OEt	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-16	H	OPr	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-17	H	OCHF ₂	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-18	H	OCF ₃	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-19	H	CF ₃	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-20	H	SMe	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-21	H	SEt	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-22	H	SP ^r	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-23	H	NMe ₂	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-24	H	NEt ₂	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-25	H	H	Br	H	H	COSEt	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

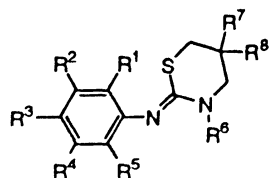
裝

訂

線

五、發明說明 (74)

(表 4 9)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
D-26	H	H	Et	H	H	COSEt	Me	Me
D-27	H	H	Pr	H	H	COSEt	Me	Me
D-28	H	H	Bu	H	H	COSEt	Me	Me
D-29	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSEt	Me	Me
D-30	H	H	Bu ^s	H	H	COSEt	Me	Me
D-31	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSEt	Me	Me
D-32	H	H	OMe	H	H	COSEt	Me	Me
D-33	H	H	OEt	H	H	COSEt	Me	Me
D-34	H	H	OPr	H	H	COSEt	Me	Me
D-35	H	H	OCHF ₂	H	H	COSEt	Me	Me
D-36	H	H	OCF ₃	H	H	COSEt	Me	Me
D-37	H	H	CF ₃	H	H	COSEt	Me	Me
D-38	H	H	SMe	H	H	COSEt	Me	Me
D-39	H	H	SEt	H	H	COSEt	Me	Me
D-40	H	H	SPr ⁱ	H	H	COSEt	Me	Me
D-41	H	H	NMe ₂	H	H	COSEt	Me	Me
D-42	H	H	NEt ₂	H	H	COSEt	Me	Me
D-43	Et	Et	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-44	H	Et	Et	H	H	COSEt	Me	Me
D-45	OMe	Me	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-46	OMe	H	Me	H	H	COSEt	Me	Me
D-47	NMe ₂	Me	H	H	H	COSEt	Me	Me
D-48	H	NMe ₂	Me	H	H	COSEt	Me	Me
D-49	H	OEt	OMe	H	H	COSEt	Me	Me
D-50	H	OEt	OEt	H	H	COSEt	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

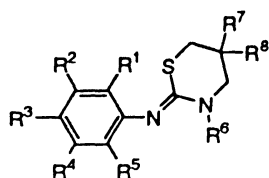
裝

訂

線

五、發明說明 (95)

(表 5 0)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
E-1	H	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-2	Cl	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-3	Br	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-4	Me	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-5	Et	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-6	Pr	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-7	Bu	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-10	OMe	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-11	OEt	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-13	OPr	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-14	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-15	OCF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-16	CF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-17	SMe	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-18	SEt	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-20	NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-21	NEt ₂	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-22	H	Cl	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-23	H	Br	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-24	H	Me	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-25	H	Et	H	H	H	CSSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

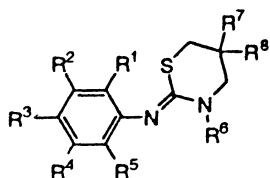
裝

訂

線

五、發明說明 (96)

(表 5 1)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
E-26	H	Pr	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-28	H	Bu	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-30	H	Bu ^s	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-31	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-32	H	OMe	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-33	H	OEt	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-34	H	OPr	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-36	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-37	H	OCF ₃	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-38	H	CF ₃	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-39	H	SMe	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-40	H	SEt	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-42	H	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-43	H	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-44	H	H	Cl	H	H	CSSMe	Et	Et
E-45	H	H	Br	H	H	CSSMe	Et	Et
E-46	H	H	Me	H	H	CSSMe	Et	Et
E-47	H	H	Et	H	H	CSSMe	Et	Et
E-48	H	H	Pr	H	H	CSSMe	Et	Et
E-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	Et	Et
E-50	H	H	Bu	H	H	CSSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

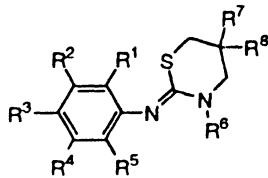
裝

訂

線

五、發明說明 (9)

(表 5 2)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
E-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	Et	Et
E-52	H	H	Bu ^s	H	H	CSSMe	Et	Et
E-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	Et	Et
E-54	H	H	OMe	H	H	CSSMe	Et	Et
E-55	H	H	OEt	H	H	CSSMe	Et	Et
E-56	H	H	OPr	H	H	CSSMe	Et	Et
E-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	Et	Et
E-58	H	H	OCHF ₂	H	H	CSSMe	Et	Et
E-59	H	H	OCF ₃	H	H	CSSMe	Et	Et
E-60	H	H	CF ₃	H	H	CSSMe	Et	Et
E-61	H	H	SMe	H	H	CSSMe	Et	Et
E-62	H	H	SEt	H	H	CSSMe	Et	Et
E-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	CSSMe	Et	Et
E-64	H	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	Et	Et
E-65	H	H	NEt ₂	H	H	CSSMe	Et	Et
E-66	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-68	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Et	Et
E-69	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSMe	Et	Et
E-70	Pr ⁱ	H	F	H	H	CSSMe	Et	Et
E-71	OMe	H	OMe	H	H	CSSMe	Et	Et
E-72	H	OMe	OMe	H	H	CSSMe	Et	Et
E-73	H	OMe	OEt	H	H	CSSMe	Et	Et
E-74	H	OEt	OMe	H	H	CSSMe	Et	Et
E-75	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

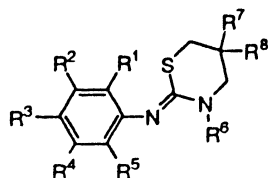
裝

訂

線

五、發明說明(99)

(表 5 3)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
F-1	H	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-2	Cl	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-3	Br	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-4	Me	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-5	Et	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-6	Pr	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-7	Bu	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-10	OMe	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-11	OE ^t	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-12	OP ^r	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-13	OP ^r	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-14	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-15	OCF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-16	CF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-17	SMe	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-18	SE ^t	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-19	SP ^r	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-20	NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-21	NE ^t	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-22	H	Cl	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-23	H	Br	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-24	H	Me	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-25	H	Et	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

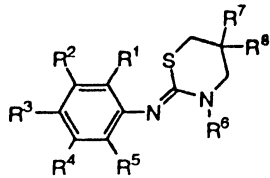
裝

訂

線

五、發明說明 (99)

(表 5 4)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
F-26	H	Pr	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-28	H	Bu	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-30	H	Bu ^s	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-31	H	Bu ^t	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-32	H	OMe	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-33	H	OEt	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-34	H	OPr	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-36	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-37	H	OCF ₃	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-38	H	CF ₃	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-39	H	SMe	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-40	H	SEt	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-42	H	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-43	H	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-44	H	H	Cl	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-45	H	H	Br	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-46	H	H	Me	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-47	H	H	Et	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-48	H	H	Pr	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-50	H	H	Bu	H	H	CSSMe	Pr	Pr

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

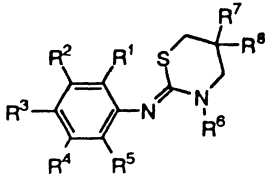
裝

訂

線

五、發明說明 (100)

(表 55)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
F-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-52	H	H	Bu ^s	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-54	H	H	OMe	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-55	H	H	OEt	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-56	H	H	OPr	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-58	H	H	OCHF ₂	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-59	H	H	OCF ₃	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-60	H	H	CF ₃	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-61	H	H	SMe	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-62	H	H	SEt	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-64	H	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-65	H	H	NEt ₂	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-66	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-68	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-69	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-70	Bu ^s	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-71	OMe	H	OMe	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-72	H	OMe	OMe	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-73	H	OMe	OEt	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-74	H	OEt	OMe	H	H	CSSMe	Pr	Pr
F-75	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	Pr	Pr

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

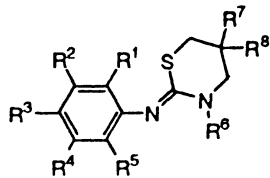
裝

訂

線

五、發明說明(101)

(表 5 6)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
G-1	H	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-2	Cl	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-3	Br	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-4	Me	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-5	Et	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-6	Pr	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-7	Bu	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-9	Bu ^t	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-10	OMe	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-11	OEt	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-13	OPr	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-14	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-15	OCF ₃	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-16	CF ₃	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-17	SMe	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-18	SEt	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-20	NMe ₂	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-21	NEt ₂	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-22	H	Cl	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-23	H	Br	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-24	H	Me	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-25	H	Et	H	H	H	CSSEt	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

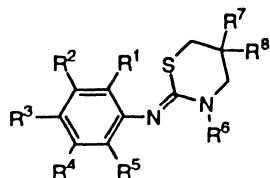
裝

訂

線

五、發明說明 (10²)

(表 5 7)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
G-26	H	Pr	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-28	H	Bu	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-30	H	Bu ^s	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-31	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-32	H	OMe	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-33	H	OEt	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-34	H	OPr	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-36	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-37	H	OCF ₃	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-38	H	CF ₃	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-39	H	SMe	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-40	H	SEt	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-42	H	NMe ₂	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-43	H	NEt ₂	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-44	H	H	Cl	H	H	CSSEt	Et	Et
G-45	H	H	Br	H	H	CSSEt	Et	Et
G-46	H	H	Me	H	H	CSSEt	Et	Et
G-47	H	H	Et	H	H	CSSEt	Et	Et
G-48	H	H	Pr	H	H	CSSEt	Et	Et
G-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSEt	Et	Et
G-50	H	H	Bu	H	H	CSSEt	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

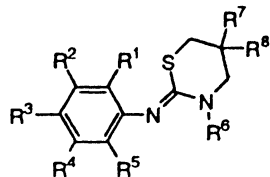
裝

訂

線

五、發明說明(103)

(表 5 8)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
G-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSEt	Et	Et
G-52	H	H	Bu ^s	H	H	CSSEt	Et	Et
G-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSEt	Et	Et
G-54	H	H	OMe	H	H	CSSEt	Et	Et
G-55	H	H	OEt	H	H	CSSEt	Et	Et
G-56	H	H	OPr	H	H	CSSEt	Et	Et
G-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSEt	Et	Et
G-58	H	H	OCHF ₂	H	H	CSSEt	Et	Et
G-59	H	H	OCF ₃	H	H	CSSEt	Et	Et
G-60	H	H	CF ₃	H	H	CSSEt	Et	Et
G-61	H	H	SMe	H	H	CSSEt	Et	Et
G-62	H	H	SEt	H	H	CSSEt	Et	Et
G-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	CSSEt	Et	Et
G-64	H	H	NMe ₂	H	H	CSSEt	Et	Et
G-65	H	H	NEt ₂	H	H	CSSEt	Et	Et
G-66	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-68	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-69	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSEt	Et	Et
G-70	Bu ^s	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
G-71	OMe	H	OMe	H	H	CSSEt	Et	Et
G-72	H	OMe	OMe	H	H	CSSEt	Et	Et
G-73	H	OMe	OEt	H	H	CSSEt	Et	Et
G-74	H	OEt	OMe	H	H	CSSEt	Et	Et
G-75	H	OEt	OEt	H	H	CSSEt	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

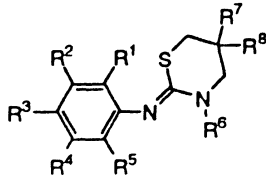
裝

訂

線

五、發明說明 (104)

(表 5 9)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
H-1	H	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-2	Cl	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-3	Br	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-4	Me	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-5	Et	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-6	Pr	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-7	Bu	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-10	OMe	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-11	OEt	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-13	OPr	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-14	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-15	OCF ₃	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-16	CF ₃	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-17	SMe	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-18	SEt	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-20	NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-21	NEt ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-22	H	Cl	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-23	H	Br	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-24	H	Me	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-25	H	Et	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

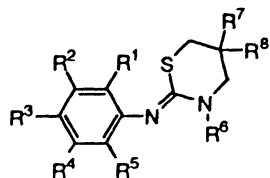
裝

訂

線

五、發明說明 (105)

(表 60)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
H-26	H	Pr	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-28	H	Bu	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-30	H	Bu ^s	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-31	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-32	H	OMe	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-33	H	OEt	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-34	H	OPr	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-36	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-37	H	OCF ₃	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-38	H	CF ₃	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-39	H	SMe	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-40	H	SEt	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-42	H	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-43	H	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-44	H	H	Cl	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-45	H	H	Br	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-46	H	H	Me	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-47	H	H	Et	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-48	H	H	Pr	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-50	H	H	Bu	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

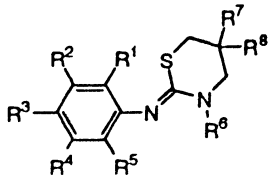
裝

訂

線

五、發明說明 (106)

(表 6 1)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
H-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-52	H	H	Bu ^s	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-54	H	H	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-55	H	H	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-56	H	H	OPr	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-58	H	H	OCHF ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-59	H	H	OCF ₃	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-60	H	H	CF ₃	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-61	H	H	SMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-62	H	H	SEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-64	H	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-65	H	H	NEt ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-66	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-68	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-69	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-70	Bu ^s	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-71	OMe	H	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-72	H	OMe	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-73	H	OMe	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-74	H	OEt	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	
H-75	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ -	

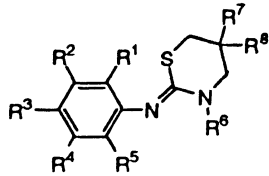
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(107)

(表 6 2)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
N-1	H	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-2	Cl	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-3	Br	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-4	Me	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-5	Et	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-6	Pr	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-7	Bu	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-10	OMe	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-11	OEt	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-13	OPr	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-14	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-15	OCF ₃	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-16	CF ₃	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-17	SMe	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-18	SEt	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-20	NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-21	NEt ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-22	H	Cl	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-23	H	Br	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-24	H	Me	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-25	H	Et	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

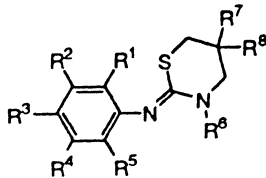
裝

訂

線

五、發明說明(109)

(表 6 3)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
N-26	H	Pr	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-28	H	Bu	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-30	H	Bu ^s	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-31	H	Bu ^t	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-32	H	OMe	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-33	H	OEt	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-34	H	OPr	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-36	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-37	H	OCF ₃	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-38	H	CF ₃	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-39	H	SMe	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-40	H	SEt	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-42	H	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-43	H	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-44	H	H	Cl	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-45	H	H	Br	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-46	H	H	Me	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-47	H	H	Et	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-48	H	H	Pr	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-50	H	H	Bu	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

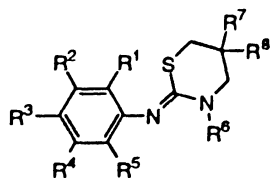
裝

訂

線

五、發明說明(109)

(表 6 4)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
N-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-52	H	H	Bu ^s	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-53	H	H	Bu ^t	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-54	H	H	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-55	H	H	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-56	H	H	OPr	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-58	H	H	OCHF ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-59	H	H	OCF ₃	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-60	H	H	CF ₃	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-61	H	H	SMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-62	H	H	SEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-64	H	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-65	H	H	NEt ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-66	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-68	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-69	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-70	Bu ^s	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-71	OMe	H	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-72	H	OMe	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-73	H	OMe	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-74	H	OEt	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
N-75	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

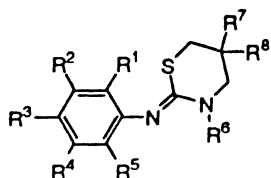
裝

訂

線

五、發明說明(110)

(表 6 5)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
J-1	H	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-2	Cl	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-3	Br	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-4	Me	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-5	Et	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-6	Pr	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-7	Bu	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-10	OMe	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-11	OEt	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-13	OPr	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-14	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-15	OCF ₃	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-16	CF ₃	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-17	SMe	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-18	SEt	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-20	NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-21	NEt ₂	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-22	H	Cl	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-23	H	Br	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-24	H	Me	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-25	H	Et	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

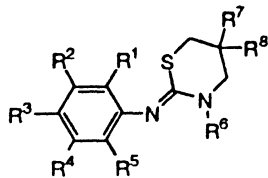
裝

訂

線

五、發明說明 (111)

(表 6 6)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
J-26	H	Pr	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-28	H	Bu	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-30	H	Bu ^s	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-31	H	Bu ^t	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-32	H	OMe	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-33	H	OEt	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-34	H	OPr	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-36	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-37	H	OCF ₃	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-38	H	CF ₃	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-39	H	SMe	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-40	H	SEt	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-42	H	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-43	H	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-44	H	H	Cl	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-45	H	H	Br	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-46	H	H	Me	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-47	H	H	Et	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-48	H	H	Pr	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-50	H	H	Bu	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

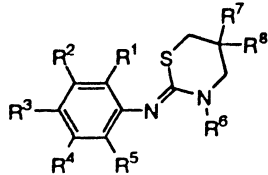
裝

訂

線

五、發明說明 (117)

(表 6 7)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
J-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-52	H	H	Bu ^s	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-54	H	H	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-55	H	H	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-56	H	H	OPr	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-58	H	H	OCHF ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-59	H	H	OCF ₃	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-60	H	H	CF ₃	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-61	H	H	SMc	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-62	H	H	SEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-64	H	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-65	H	H	NEt ₂	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-66	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-68	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-69	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-70	Bu ^s	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-71	OMe	H	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-72	H	OMe	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-73	H	OMe	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-74	H	OEt	OMe	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	
J-75	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

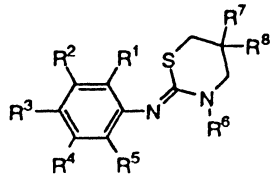
裝

訂

線

五、發明說明(13)

(表 6 8)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
K-1	H	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-2	Cl	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-3	Br	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-4	Me	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-5	Et	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-6	Pr	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-7	Bu	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-10	OMe	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-11	OEt	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-13	OPr	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-14	OCHF ₂	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-15	OCF ₃	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-16	CF ₃	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-17	SMe	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-18	SEt	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-20	NMe ₂	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-21	NEt ₂	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-22	H	Cl	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-23	H	Br	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-24	H	Me	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-25	H	Et	H	H	H	COSEt	Et	Et

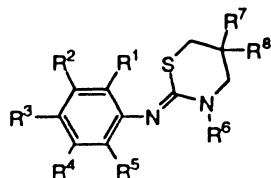
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (114)

(表 6 9)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
K-26	H	Pr	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-28	H	Bu	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-30	H	Bu ^s	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-31	H	Bu ⁱ	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-32	H	OMe	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-33	H	OEt	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-34	H	OPr	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-36	H	OCHF ₂	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-37	H	OCF ₃	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-38	H	CF ₃	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-39	H	SMe	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-40	H	SEt	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-42	H	NMe ₂	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-43	H	NEt ₂	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-44	H	H	Cl	H	H	COSEt	Et	Et
K-45	H	H	Br	H	H	COSEt	Et	Et
K-46	H	H	Me	H	H	COSEt	Et	Et
K-47	H	H	Et	H	H	COSEt	Et	Et
K-48	H	H	Pr	H	H	COSEt	Et	Et
K-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	COSEt	Et	Et
K-50	H	H	Bu	H	H	COSEt	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

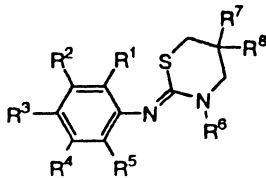
裝

訂

線

五、發明說明 (114)

(表 70)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
K-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSEt	Et	Et
K-52	H	H	Bu ^s	H	H	COSEt	Et	Et
K-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSEt	Et	Et
K-54	H	H	OMe	H	H	COSEt	Et	Et
K-55	H	H	OEt	H	H	COSEt	Et	Et
K-56	H	H	OPr	H	H	COSEt	Et	Et
K-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	COSEt	Et	Et
K-58	H	H	OCHF ₂	H	H	COSEt	Et	Et
K-59	H	H	OCF ₃	H	H	COSEt	Et	Et
K-60	H	H	CF ₃	H	H	COSEt	Et	Et
K-61	H	H	SMe	H	H	COSEt	Et	Et
K-62	H	H	SEt	H	H	COSEt	Et	Et
K-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	COSEt	Et	Et
K-64	H	H	NMe ₂	H	H	COSEt	Et	Et
K-65	H	H	NEt ₂	H	H	COSEt	Et	Et
K-66	Me	NMe ₂	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-68	Me	NEt ₂	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-69	H	NEt ₂	Me	H	H	COSEt	Et	Et
K-70	Bu ^s	H	H	H	H	COSEt	Et	Et
K-71	OMe	H	OMe	H	H	COSEt	Et	Et
K-72	H	OMe	OMe	H	H	COSEt	Et	Et
K-73	H	OMe	OEt	H	H	COSEt	Et	Et
K-74	H	OEt	OMe	H	H	COSEt	Et	Et
K-75	H	OEt	OEt	H	H	COSEt	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

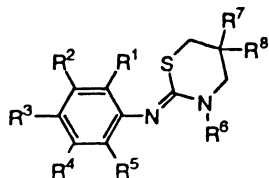
裝

訂

線

五、發明說明 (16)

(表 7 1)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
L-1	H	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-2	Cl	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-3	Br	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-4	Me	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-5	Et	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-6	Pr	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-7	Bu	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-9	Bu ^t	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-10	OMe	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-11	OEt	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-13	OPr	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-14	OCHF ₂	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-15	OCF ₃	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-16	CF ₃	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-17	SMe	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-18	SEt	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-20	NMe ₂	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-21	NEt ₂	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-22	H	Cl	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-23	H	Br	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-24	H	Me	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-25	H	Et	H	H	H	COSMe	Et	Et

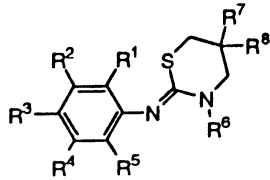
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(117)

(表 7 2)



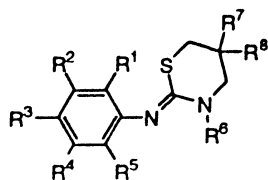
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
L-26	H	Pr	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-28	H	Bu	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-30	H	Bu ^s	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-31	H	Bu ⁱ	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-32	H	OMe	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-33	H	OEt	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-34	H	OPr	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-36	H	OCHF ₂	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-37	H	OCF ₃	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-38	H	CF ₃	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-39	H	SMe	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-40	H	SEt	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-42	H	NMe ₂	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-43	H	NEt ₂	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-44	H	H	Cl	H	H	COSMe	Et	Et
L-45	H	H	Br	H	H	COSMe	Et	Et
L-46	H	H	Me	H	H	COSMe	Et	Et
L-47	H	H	Et	H	H	COSMe	Et	Et
L-48	H	H	Pr	H	H	COSMe	Et	Et
L-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	COSMe	Et	Et
L-50	H	H	Bu	H	H	COSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 · 線

五、發明說明(19)

(表 7 3)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
L-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSMe	Et	Et
L-52	H	H	Bu ^s	H	H	COSMe	Et	Et
L-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSMe	Et	Et
L-54	H	H	OMe	H	H	COSMe	Et	Et
L-55	H	H	OEt	H	H	COSMe	Et	Et
L-56	H	H	OPr	H	H	COSMe	Et	Et
L-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	COSMe	Et	Et
L-58	H	H	OCHF ₂	H	H	COSMe	Et	Et
L-59	H	H	OCF ₃	H	H	COSMe	Et	Et
L-60	H	H	CF ₃	H	H	COSMe	Et	Et
L-61	H	H	SMe	H	H	COSMe	Et	Et
L-62	H	H	SEt	H	H	COSMe	Et	Et
L-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	COSMe	Et	Et
L-64	H	H	NMe ₂	H	H	COSMe	Et	Et
L-65	H	H	NEt ₂	H	H	COSMe	Et	Et
L-66	Me	NMe ₂	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-68	Me	NEt ₂	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-69	H	NEt ₂	Me	H	H	COSMe	Et	Et
L-70	Bu ^s	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-71	Pr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	Et	Et
L-72	H	OMe	OMe	H	H	COSMe	Et	Et
L-73	H	OMe	OEt	H	H	COSMe	Et	Et
L-74	H	OEt	OMe	H	H	COSMe	Et	Et
L-75	H	OEt	OEt	H	H	COSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

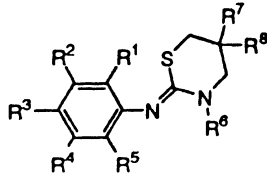
裝

訂

線

五、發明說明(119)

(表 7 4)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
M-1	H	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-2	Cl	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-3	Br	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-4	Me	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-5	Et	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-6	Pr	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-7	Bu	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-8	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-9	Bu ⁱ	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-10	OMe	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-11	OEt	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-12	OPr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-13	OPr	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-14	OCHF ₂	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-15	OCF ₃	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-16	CF ₃	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-17	SMe	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-18	SEt	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-19	SPr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-20	NMe ₂	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-21	NEt ₂	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-22	H	Cl	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-23	H	Br	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-24	H	Me	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-25	H	Et	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

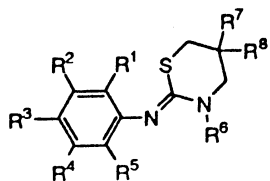
裝

訂

線

五、發明說明 (120)

(表 7 5)



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
M-26	H	Pr	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-27	H	Pr ⁱ	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-28	H	Bu	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-29	H	Bu ⁱ	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-30	H	Bu ^s	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-31	H	Bu ^t	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-32	H	OMe	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-33	H	OEt	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-34	H	OPr	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-35	H	OPr ⁱ	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-36	H	OCHF ₂	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-37	H	OCF ₃	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-38	H	CF ₃	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-39	H	SMe	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-40	H	SEt	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-41	H	SPr ⁱ	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-42	H	NMe ₂	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-43	H	NEt ₂	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-44	H	H	Cl	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-45	H	H	Br	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-46	H	H	Me	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-47	H	H	Et	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-48	H	H	Pr	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-49	H	H	Pr ⁱ	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-50	H	H	Bu	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	

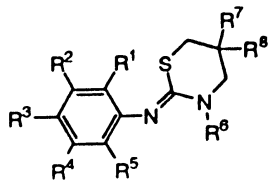
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(一)

(表 7 6)



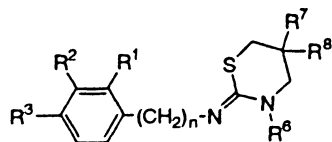
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
M-51	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-52	H	H	Bu ^s	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-53	H	H	Bu ⁱ	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-54	H	H	OMe	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-55	H	H	OEt	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-56	H	H	OPr	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-57	H	H	OPr ⁱ	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-58	H	H	OCHF ₂	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-59	H	H	OCF ₃	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-60	H	H	CF ₃	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-61	H	H	SMe	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-62	H	H	SEt	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-63	H	H	SPr ⁱ	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-64	H	H	NMe ₂	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-65	H	H	NEt ₂	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-66	Me	NMe ₂	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-67	NMe ₂	Cl	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-68	Me	NEt ₂	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-69	H	NEt ₂	Me	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-70	Bu ^s	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-71	Pr ⁱ	H	H	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-72	H	OMe	OMe	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-73	H	OMe	OEt	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-74	H	OEt	OMe	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	
M-75	H	OEt	OEt	H	H	COSMe	-(CH ₂) ₄ -	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明 (125)

(表 7 7)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
R-1	H	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-2	Cl	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-3	Br	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-4	Me	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-5	Et	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-6	Pr	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-7	Bu	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-8	Bu ⁱ	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-9	Bu ^t	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-10	Pr ⁱ	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-11	OEt	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-12	OPr ⁱ	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-13	OPr	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-14	OCHF ₂	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-15	OCF ₃	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-16	CF ₃	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-17	SMe	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-18	SEt	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-19	SPr ⁱ	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-20	NMe ₂	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-21	NEt ₂	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-22	H	Cl	H	1	CSSMe	Me	Me
R-23	H	Br	H	1	CSSMe	Me	Me
R-24	H	Me	H	1	CSSMe	Me	Me
R-25	H	Et	H	1	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

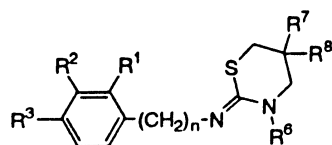
裝

訂

線

五、發明說明(123)

(表 7 8)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
R-26	H	Pr	H	1	CSSMe	Me	Me
R-27	H	Pr ⁱ	H	1	CSSMe	Me	Me
R-28	H	Bu	H	1	CSSMe	Me	Me
R-29	H	Bu ⁱ	H	1	CSSMe	Me	Me
R-30	H	Bu ^s	H	1	CSSMe	Me	Me
R-31	H	Bu ⁱ	H	1	CSSMe	Me	Me
R-32	H	OMe	H	1	CSSMe	Me	Me
R-33	H	OEt	H	1	CSSMe	Me	Me
R-34	H	OPr	H	1	CSSMe	Me	Me
R-35	H	OPr ⁱ	H	1	CSSMe	Me	Me
R-36	H	OCHF ₂	H	1	CSSMe	Me	Me
R-37	H	OCF ₃	H	1	CSSMe	Me	Me
R-38	H	CF ₃	H	1	CSSMe	Me	Me
R-39	H	SMe	H	1	CSSMe	Me	Me
R-40	H	SEt	H	1	CSSMe	Me	Me
R-41	H	SPr ⁱ	H	1	CSSMe	Me	Me
R-42	H	NMe ₂	H	1	CSSMe	Me	Me
R-43	H	NEt ₂	H	1	CSSMe	Me	Me
R-44	Cl	H	Cl	1	CSSMe	Me	Me
R-45	H	H	Br	1	CSSMe	Me	Me
R-46	H	H	Me	1	CSSMe	Me	Me
R-47	H	H	Et	1	CSSMe	Me	Me
R-48	H	H	Pr	1	CSSMe	Me	Me
R-49	H	H	Pr ⁱ	1	CSSMe	Me	Me
R-50	H	H	Bu	1	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

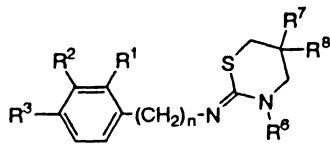
裝

訂

線

五、發明說明 (1~4)

(表 7 9)



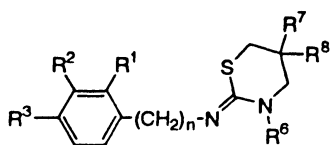
	R^1	R^2	R^3	n	R^6	R^7	R^8
R-51	H	H	Bu ⁱ	1	CSSMe	Me	Me
R-52	H	H	Bu ^s	1	CSSMe	Me	Me
R-53	H	H	Bu ⁱ	1	CSSMe	Me	Me
R-54	H	H	OMe	1	CSSMe	Me	Me
R-55	H	H	OEt	1	CSSMe	Me	Me
R-56	H	H	OPr	1	CSSMe	Me	Me
R-57	H	H	OPr ⁱ	1	CSSMe	Me	Me
R-58	H	H	OCHF ₂	1	CSSMe	Me	Me
R-59	H	H	OCF ₃	1	CSSMe	Me	Me
R-60	H	H	CF ₃	1	CSSMe	Me	Me
R-61	H	H	SMc	1	CSSMe	Me	Me
R-62	H	H	SEt	1	CSSMe	Me	Me
R-63	H	H	SPr ⁱ	1	CSSMe	Me	Me
R-64	H	H	NMe ₂	1	CSSMe	Me	Me
R-65	H	H	NEt ₂	1	CSSMe	Me	Me
R-66	Me	NMe ₂	H	1	CSSMe	Me	Me
R-67	NMe ₂	Cl	H	1	CSSMe	Me	Me
R-68	Me	NEt ₂	H	1	CSSMe	Me	Me
R-69	H	NEt ₂	Me	1	CSSMe	Me	Me
R-70	Bu ^s	H	H	1	CSSMe	Me	Me
R-71	OMe	H	OMe	1	CSSMe	Me	Me
R-72	H	OMe	OMe	1	CSSMe	Me	Me
R-73	H	OMe	OEt	1	CSSMe	Me	Me
R-74	H	OEt	OMe	1	CSSMe	Me	Me
R-75	H	OEt	OEt	1	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明(125)

(表 8 0)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
O-1	H	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-2	Cl	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-3	Br	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-4	Me	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-5	Et	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-6	Pr	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-7	Bu	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-8	Bu ⁱ	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-9	Bu ⁱ	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-10	Pr ⁱ	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-11	OE _t	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-12	OPr ⁱ	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-13	OPr	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-14	OCHF ₂	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-15	OCF ₃	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-16	CF ₃	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-17	SMe	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-18	SEt	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-19	SPr ⁱ	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-20	NMe ₂	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-21	NEt ₂	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-22	H	Cl	H	2	CSSMe	Me	Me
O-23	H	Br	H	2	CSSMe	Me	Me
O-24	H	Me	H	2	CSSMe	Me	Me
O-25	H	Et	H	2	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

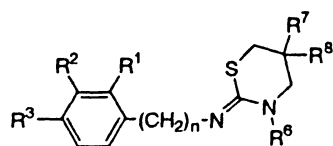
裝

訂

線

五、發明說明 (127)

(表 8 1)



	R ¹	R ²	R ³	m	R ⁶	R ⁷	R ⁸
O-26	H	Pr	H	2	CSSMe	Me	Me
O-27	H	Pr ⁱ	H	2	CSSMe	Me	Me
O-28	H	Bu	H	2	CSSMe	Me	Me
O-29	H	Bu ⁱ	H	2	CSSMe	Me	Me
O-30	H	Bu ^s	H	2	CSSMe	Me	Me
O-31	H	Bu ^t	H	2	CSSMe	Me	Me
O-32	H	OMe	H	2	CSSMe	Me	Me
O-33	H	OEt	H	2	CSSMe	Me	Me
O-34	H	OPr	H	2	CSSMe	Me	Me
O-35	H	OPr ⁱ	H	2	CSSMe	Me	Me
O-36	H	OCHF ₂	H	2	CSSMe	Me	Me
O-37	H	OCF ₃	H	2	CSSMe	Me	Me
O-38	H	CF ₃	H	2	CSSMe	Me	Me
O-39	H	SMe	H	2	CSSMe	Me	Me
O-40	H	SEt	H	2	CSSMe	Me	Me
O-41	H	SPr ⁱ	H	2	CSSMe	Me	Me
O-42	H	NMe ₂	H	2	CSSMe	Me	Me
O-43	H	NEt ₂	H	2	CSSMe	Me	Me
O-44	F	H	F	2	CSSMe	Me	Me
O-45	H	H	Br	2	CSSMe	Me	Me
O-46	H	H	Me	2	CSSMe	Me	Me
O-47	H	H	Et	2	CSSMe	Me	Me
O-48	H	H	Pr	2	CSSMe	Me	Me
O-49	H	H	Pr ⁱ	2	CSSMe	Me	Me
O-50	H	H	Bu	2	CSSMe	Me	Me

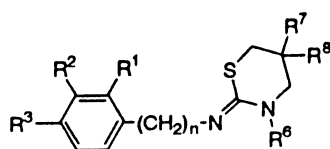
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (17)

(表 8 2)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
O-51	H	H	Bu ⁱ	2	CSSMe	Me	Me
O-52	H	H	Bu ^s	2	CSSMe	Me	Me
O-53	H	H	Bu ⁱ	2	CSSMe	Me	Me
O-54	H	H	OMe	2	CSSMe	Me	Me
O-55	H	H	OEt	2	CSSMe	Me	Me
O-56	H	H	OPr	2	CSSMe	Me	Me
O-57	H	H	OPr ⁱ	2	CSSMe	Me	Me
O-58	H	H	OCHF ₂	2	CSSMe	Me	Me
O-59	H	H	OCF ₃	2	CSSMe	Me	Me
O-60	H	H	CF ₃	2	CSSMe	Me	Me
O-61	H	H	SMe	2	CSSMe	Me	Me
O-62	H	H	SEt	2	CSSMe	Me	Me
O-63	H	H	SPr ⁱ	2	CSSMe	Me	Me
O-64	H	H	NMe ₂	2	CSSMe	Me	Me
O-65	H	H	NEt ₂	2	CSSMe	Me	Me
O-66	Me	NMe ₂	H	2	CSSMe	Me	Me
O-67	NMe ₂	Cl	H	2	CSSMe	Me	Me
O-68	Me	NEt ₂	H	2	CSSMe	Me	Me
O-69	H	NEt ₂	Me	2	CSSMe	Me	Me
O-70	Bu ^s	H	H	2	CSSMe	Me	Me
O-71	OMe	H	OMe	2	CSSMe	Me	Me
O-72	H	OMe	OMe	2	CSSMe	Me	Me
O-73	H	OMe	OEt	2	CSSMe	Me	Me
O-74	H	OEt	OMe	2	CSSMe	Me	Me
O-75	H	OEt	OEt	2	CSSMe	Me	Me

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

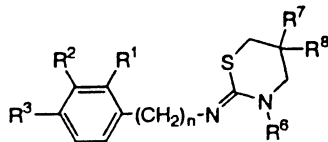
裝

訂

線

五、發明說明 (128)

(表 8 3)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
P-1	H	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-2	Cl	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-3	Br	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-4	Me	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-5	Et	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-6	Pr	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-7	Bu	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-8	Bu ⁱ	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-9	Bu ^t	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-10	Pr ⁱ	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-11	OEt	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-12	OPr ⁱ	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-13	OPr	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-14	OCHF ₂	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-15	OCF ₃	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-16	CF ₃	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-17	SMe	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-18	SEt	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-19	SPR ⁱ	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-20	NMe ₂	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-21	NEt ₂	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-22	H	Cl	H	1	CSSMe	Et	Et
P-23	H	Br	H	1	CSSMe	Et	Et
P-24	H	Me	H	1	CSSMe	Et	Et
P-25	H	Et	H	1	CSSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

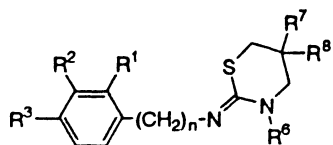
裝

訂

線

五、發明說明(129)

(表 8 4)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
P-26	H	Pr	H	1	CSSMe	Et	Et
P-27	H	Pr ⁱ	H	1	CSSMe	Et	Et
P-28	H	Bu	H	1	CSSMe	Et	Et
P-29	H	Bu ⁱ	H	1	CSSMe	Et	Et
P-30	H	Bu ^s	H	1	CSSMe	Et	Et
P-31	H	Bu ⁱ	H	1	CSSMe	Et	Et
P-32	H	OMe	H	1	CSSMe	Et	Et
P-33	H	OEt	H	1	CSSMe	Et	Et
P-34	H	OPr	H	1	CSSMe	Et	Et
P-35	H	OPr ⁱ	H	1	CSSMe	Et	Et
P-36	H	OCHF ₂	H	1	CSSMe	Et	Et
P-37	H	OCF ₃	H	1	CSSMe	Et	Et
P-38	H	CF ₃	H	1	CSSMe	Et	Et
P-39	H	SMe	H	1	CSSMe	Et	Et
P-40	H	SEt	H	1	CSSMe	Et	Et
P-41	H	SPr ⁱ	H	1	CSSMe	Et	Et
P-42	H	NMe ₂	H	1	CSSMe	Et	Et
P-43	H	NEt ₂	H	1	CSSMe	Et	Et
P-44	OMe	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-45	H	H	Br	1	CSSMe	Et	Et
P-46	H	H	Me	1	CSSMe	Et	Et
P-47	H	H	Et	1	CSSMe	Et	Et
P-48	H	H	Pr	1	CSSMe	Et	Et
P-49	H	H	Pr ⁱ	1	CSSMe	Et	Et
P-50	H	H	Bu	1	CSSMe	Et	Et

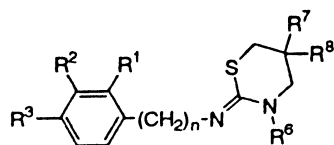
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (137)

(表 8 5)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
P-51	H	H	Bu ⁱ	1	CSSMe	Et	Et
P-52	H	H	Bu ^s	1	CSSMe	Et	Et
P-53	H	H	Bu ^t	1	CSSMe	Et	Et
P-54	H	H	OMe	1	CSSMe	Et	Et
P-55	H	H	OE _t	1	CSSMe	Et	Et
P-56	H	H	OPr	1	CSSMe	Et	Et
P-57	H	H	OPr ⁱ	1	CSSMe	Et	Et
P-58	H	H	OCHF ₂	1	CSSMe	Et	Et
P-59	H	H	OCF ₃	1	CSSMe	Et	Et
P-60	H	H	CF ₃	1	CSSMe	Et	Et
P-61	H	H	SMe	1	CSSMe	Et	Et
P-62	H	H	SEt	1	CSSMe	Et	Et
P-63	H	H	SPr ⁱ	1	CSSMe	Et	Et
P-64	H	H	NMe ₂	1	CSSMe	Et	Et
P-65	H	H	NEt ₂	1	CSSMe	Et	Et
P-66	Me	NMe ₂	H	1	CSSMe	Et	Et
P-67	NMe ₂	Cl	H	1	CSSMe	Et	Et
P-68	Me	NEt ₂	H	1	CSSMe	Et	Et
P-69	H	NEt ₂	Me	1	CSSMe	Et	Et
P-70	Bu ^s	H	H	1	CSSMe	Et	Et
P-71	OMe	H	OMe	1	CSSMe	Et	Et
P-72	H	OMe	OMe	1	CSSMe	Et	Et
P-73	H	OMe	OE _t	1	CSSMe	Et	Et
P-74	H	OE _t	OMe	1	CSSMe	Et	Et
P-75	H	OE _t	OE _t	1	CSSMe	Et	Et

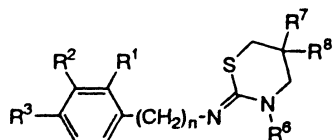
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (134)

(表 8 6)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
Q-1	H	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-2	Cl	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-3	Br	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-4	Me	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-5	Et	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-6	Pr	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-7	Bu	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-8	Bu ⁱ	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-9	Bu ⁱ	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-10	Pr ⁱ	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-11	OEt	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-12	OPr ⁱ	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-13	OPr	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-14	OCHF ₂	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-15	OCF ₃	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-16	CF ₃	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-17	SMe	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-18	SEt	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-19	SPr ⁱ	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-20	NMe ₂	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-21	NEt ₂	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-22	H	Cl	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-23	H	Br	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-24	H	Me	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-25	H	Et	H	2	CSSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

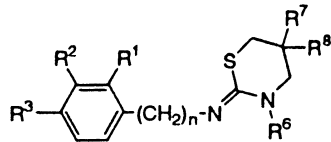
裝

訂

線

五、發明說明(133)

(表 8 7)



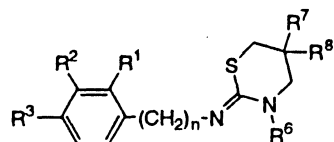
	R ¹	R ²	R ³	m	R ⁶	R ⁷	R ⁸
Q-26	H	Pr	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-27	H	Pr ⁱ	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-28	H	Bu	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-29	H	Bu ⁱ	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-30	H	Bu ^s	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-31	H	Bu ^t	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-32	H	OMe	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-33	H	OEt	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-34	H	OPr	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-35	H	OPr ⁱ	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-36	H	OCHF ₂	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-37	H	OCF ₃	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-38	H	CF ₃	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-39	H	SMe	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-40	H	SEt	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-41	H	SPr ⁱ	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-42	H	NMe ₂	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-43	H	NEt ₂	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-44	OMe	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-45	H	H	Br	2	CSSMe	Et	Et
Q-46	H	H	Me	2	CSSMe	Et	Et
Q-47	H	H	Et	2	CSSMe	Et	Et
Q-48	H	H	Pr	2	CSSMe	Et	Et
Q-49	H	H	Pr ⁱ	2	CSSMe	Et	Et
Q-50	H	H	Bu	2	CSSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明 (123)

(表 8 8)



	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁶	R ⁷	R ⁸
Q-51	H	H	Bu ⁱ	2	CSSMe	Et	Et
Q-52	H	H	Bu ^s	2	CSSMe	Et	Et
Q-53	H	H	Bu ⁱ	2	CSSMe	Et	Et
Q-54	H	H	OMe	2	CSSMe	Et	Et
Q-55	H	H	OEt	2	CSSMe	Et	Et
Q-56	H	H	OPr	2	CSSMe	Et	Et
Q-57	H	H	OPr ⁱ	2	CSSMe	Et	Et
Q-58	H	H	OCHF ₂	2	CSSMe	Et	Et
Q-59	H	H	OCF ₃	2	CSSMe	Et	Et
Q-60	H	H	CF ₃	2	CSSMe	Et	Et
Q-61	H	H	SMc	2	CSSMe	Et	Et
Q-62	H	H	SEt	2	CSSMe	Et	Et
Q-63	H	H	SPr ⁱ	2	CSSMe	Et	Et
Q-64	H	H	NMe ₂	2	CSSMe	Et	Et
Q-65	H	H	NEt ₂	2	CSSMe	Et	Et
Q-66	Me	NMe ₂	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-67	NMe ₂	Cl	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-68	Me	NEt ₂	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-69	H	NEt ₂	Me	2	CSSMe	Et	Et
Q-70	Bu ^s	H	H	2	CSSMe	Et	Et
Q-71	OMe	H	OMe	2	CSSMe	Et	Et
Q-72	H	OMe	OMe	2	CSSMe	Et	Et
Q-73	H	OMe	OEt	2	CSSMe	Et	Et
Q-74	H	OEt	OMe	2	CSSMe	Et	Et
Q-75	H	OEt	OEt	2	CSSMe	Et	Et

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(1~4)

以下示出上述本發明化合物之試驗例。

試驗例 1 人類 CB2 受體結合抑制實驗

將編碼人類 CB2 受體之 cDNA 序列(Munro 等, Nature, 1993, 365, 61-65), 於動物細胞用表現載體 pSVL SV40 Late Promoter Expression Vector(Amersham Pharmacia Biotech 公司)之啟動基因下游, 以順方向插入。所得之表現載體使用 Lipofect AMINE 試藥(Gibco BRL 公司), 根據使用說明書, 轉移感染宿主 CHO, 取得 CB2 受體安定表現細胞。

將表現 CB2 受體之 CHO 細胞所調製之膜樣品, 與受試化合物及 38,000dpm 之 [3H]CP55940(終濃度 0.5nM: NEN Life Science Products 公司製)共同於分析緩衝液(含有 0.5%牛血清白蛋白之 50mM Tris-HCl 緩衝液(pH7.4)、1mM EDTA、3mM MgCl₂)中, 25℃、培養 2 小時後, 以 1%聚乙二醇處理之玻璃濾器 GF/C 予以過濾。以含有 0.1% BSA 之 50mM Tris-HCl 緩衝液(pH7.4)予以洗淨後, 以液體閃爍計數器求出玻璃濾器上的放射活性。於 10 μM WIN55212-2(US 5081122 記載之大麻素受體激動劑、Research Biochemicals International 公司製)存在下測定非專一性結合, 求出相對於專一性結合之受試化合物的 50%抑制濃度(IC₅₀值)。

對於人類 CB1 受體之結合實驗為將安定表現 CB1 受體之 CHO 細胞, 以上述相同之方法製作, 並且使用其膜鹼分進行實驗。此些結合實驗之結果, 所得受試化合物對

五、發明說明 (135)

於各人類大麻素受體之 K_i 值示於表中。如表中所示般，本發明一系列之化合物令 CB2 受體比 CB1 受體對於 CP55940 (US 4371720 記載之大麻素受體激動劑) 之結合受到更選擇性地抑制。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (136)

(表 89)

化 合 物	K _i (nM)	
	CB1 受 體	CB2 受 體
1-5	>5000	61
1-23	>5000	29
1-50	>5000	39
1-51	n. t.	23
1-52	n. t.	35
1-56	n. t.	54
1-6	>5000	9
1-57	4134	6
1-69	n. t.	33
1-60	2097	18
1-62	n. t.	44
1-63	n. t.	43
1-74	n. t.	48
1-77	n. t.	53
1-84	>5000	35
1-85	n. t.	25
n. t. : 未 測 試		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (127)

試驗例 2 透過人類 CB2 受體之 cAMP 生成抑制實驗

於人類 CB2 受體所表現之 CHO 細胞中，添加受試化合物並且培養 15 分鐘後，加入 Forskolin(終濃度 $4\mu\text{M}$ 、SIGMA 公司)並培養 20 分鐘。添加 1NHC1 令反應停止後，使用 Amersham Pharmacia Biotech 公司製之 EIA 套件測定上清液中之 cAMP 量。將 Forskolin 刺激所生成之 cAMP 相對於 Forskolin 未刺激者視為 100%，求出顯示 50%抑制作用之受試化合物的濃度 (IC_{50} 值)。此結果所得之受試化合物的 IC_{50} 值示於表 90。如表 90 所示般，本發明化合物對於 CB2 受體顯示出激動作用。

尚，根據同樣試驗，亦可試驗關於拮抗作用。

(表 90)

化合物	IC_{50} (nM)
1-5	6.5
1-23	2.6
1-51	2.8
1-6	2.7
1-57	5.5

試驗例 3 綿羊紅血球 (SRSC) 誘發延遲型過敏反應 (DTH) 模型實驗

將 ddY 母鼠 (7 週齡) 使用於綿羊紅血球 (SRBC) 誘發延遲型過敏反應 (DTH) 模型。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (139)

將大麻素受體作用藥 I - 6、I - 60、I - 77 及 I - 118 懸浮於 0.6% 阿拉伯膠溶液中。對鼠左後肢足蹠皮內 (40 毫升) 注射 10^7 個之 SRBC 令其致敏。其 5 日後，對右後肢足蹠皮內 (40 毫升) 注射 10^8 個之 SRBC 惹起 DTH 反應。藥物為在 DTH 反應惹起 1 小時前及 5 小時後經口投與 (10 毫克 / 公斤)。以水取代法測定 SRBC 注射 24 小時後之左右後肢容積，根據右足容積與左足容積所求出之差，算出足浮腫容量，將其視為 DTH 反應之指標。

以各化合物之抑制率示出數據。根據 Welch 之 t 檢測法進行統計性測定， $p < 0.05$ 時判定為有意義差。

(表 91)

化合物 投與量 (mg/kg) 抑制率 (%)

1-6	40	45.2
1-60	30	31.1
1-77	30	33.8
1-118	30	33.0

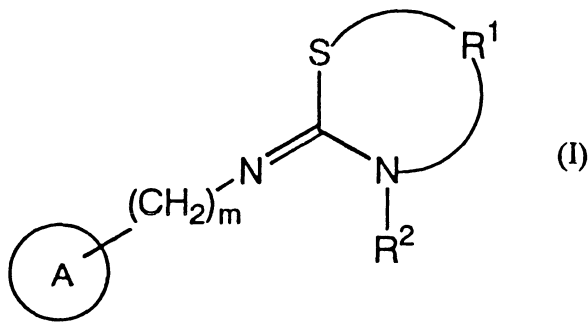
產業上之可利用性

式 (I) 及式 (II) 所示之本發明化合物為選擇性地結合大麻素 2 受體 (CB2R)，並且顯示出 CB2R 拮抗作用或 CB2R 激動作用。因此，可迴避來自大麻素 1 受體 (CB1R) 之中樞神經系的副作用 (幻覺等)，且亦不會引起大麻素 1 受體 (CB1R) 所關連之依賴性，於治療或預防大麻素 2 受體 (CB2R) 所參與疾病之目的中可使用。

四、中文發明摘要(發明之名稱：

具大麻素 2 受體親和性或大麻素 2 受體作用性之醫藥組成物

發現式(I)所示之本發明化合物為選擇性地結合大麻素 2 受體(CB2R)，且顯示 CB2R 拮抗作用或 CB2R 激動作用。



(式中， R^1 為亦可經取代之伸烷基； R^2 為氫、烷基、式： $-C(=R^5)-R^6$ (式中， R^5 為 O 或 S； R^6 為烷基、烷氧基、烷硫基等) 所示之基、或式： $-SO_2R^7$ (式中， R^7 為烷基等) 所示之基； m 為 0~2 之整數； A 為亦可經取代之芳香族碳環等)。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

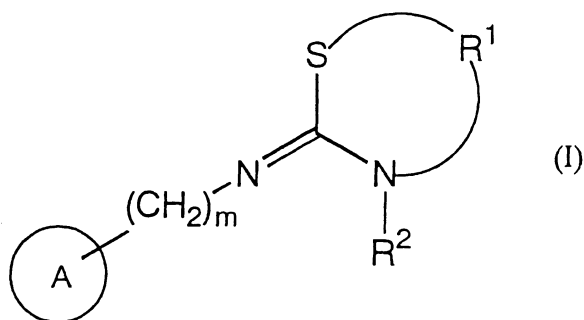
訂

英文發明摘要 (發明之名稱 :

)

A PHARMACEUTICAL COMPOSITION HAVING THE AFFINITY
FOR CANNABINOID 2 RECEPTOR (CB2R) AND THE FUNCTION
AS CANNABINOID 2 RECEPTOR (CB2R)

The compound of present invention shown by formula (I) is found to
be selective bond to cannabinoid (CB2R), and CB2R antagonistic action
or CB2R agonist action is shown.



(wherein, R^1 is alkylene group which maybe substituted; R^2 is hydrogen,
alkyl group, a group shown by formula: $-C(=R^5)R^6$ - (wherein, R^5 is O or S;
 R^6 is alkyl group, alkoxy group, alkylthio group, etc.), or a group shown
by formula: $-SO_2R^7$ (wherein, R^7 is alkyl group, etc.); m is an integral
number of 0~2; A is aromatic carbonic ring which maybe substituted).

- 2a -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

訂

線

2006 年 12 月 19 日

修正
補充 本 95 年 12 月 19 日

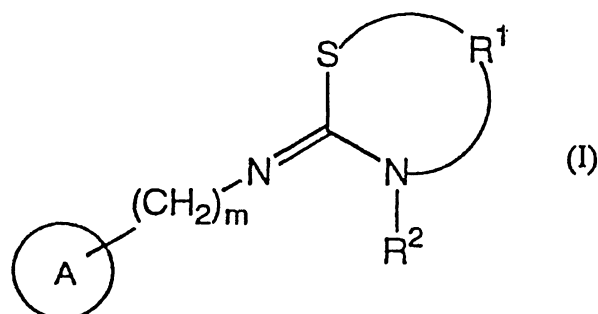
六、申請專利範圍

第 89118689 號「具大麻素 2 受體親和性或大麻素 2 受體作用性之醫藥組成物」專利案

(2006 年 12 月 19 日修正)

六、申請專利範圍：

1. 一種具大麻素 2 受體親和性或大麻素 2 受體作用性之醫藥組成物，其含有式 (I) 所示化合物或其製藥上所容許鹽

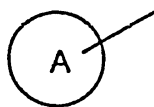


(式中， R^1 為表示亦可經 C_1-C_6 烷基或 C_2-C_5 伸烷基取代之 C_2-C_3 伸烷基， R^2 為表示 C_1-C_6 烷基、式： $-C(=R^5)-R^6$ (式中， R^5 為表示 O 或 S， R^6 為表示 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、亦可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基、苯 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、或 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷基) 所示之基、或式： $-SO_2R^7$ (式中， R^7 為表示 C_1-C_6 烷基；可經 C_1-C_6 烷基、鹵 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷基氧基、或硝基取代之苯基；噻吩基) 所示之基， m 為表示 0~2 之整數，A 為表示可經鹵素、 C_1-C_6 烷基、鹵 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷基、可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基 C_1-C_6 烷基、苯基、 C_1-C_6 烷基氧基、鹵 C_1-C_6 烷氧

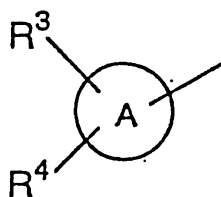
六、申請專利範圍

基、苯氧基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷氧基、可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、可經 C_1-C_6 烷基取代之胺甲醯基、可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基、 C_1-C_6 烷基羰基胺基、 C_1-C_6 烷基羰基 (C_1-C_6 烷基胺基)、硝基、亞甲二氧基、 C_1-C_6 烷基亞磺醯基、 C_1-C_6 烷基磺醯基、 C_1-C_6 烷氧基亞胺基 C_1-C_6 烷基、吡啶基、嗎啉基、哌啶基、吡咯烷基、2-氧基吡咯烷基、或嗎啉基羰基取代之苯基；或萘基；或可經鹵素、 C_1-C_6 烷氧基、或 C_1-C_6 烷硫基取代之吡啶基或喹啉基)。

2. 如申請專利範圍第 1 項之醫藥組成物，其中式：



所示之基為表示式：

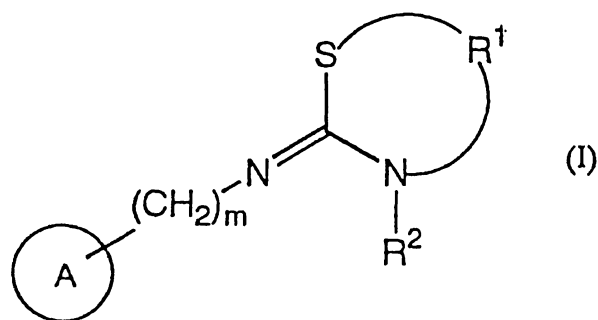


(式中， R^3 及 R^4 分別獨立表示氫、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基、 C_1-C_6 烷基羰基胺基、 C_1-C_6 烷基羰基 (C_1-C_6 烷基胺基)、苯基、苯氧基、鹵素、硝基、鹵 C_1-C_6 烷基、鹵 C_1-C_6 烷氧基、

六、申請專利範圍

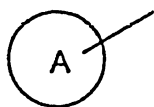
可經 C_1-C_6 烷基取代之胺甲鹽基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷基亞磺鹽基、 C_1-C_6 烷基磺鹽基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷基、亦可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷氧基、吡啶基、嗎啉基、吡咯烷基、2-氧基吡咯烷基、 C_1-C_6 烷氧基亞胺基 C_1-C_6 烷基、或式： $-C(=O)-R^H$ (R^H 為氫、 C_1-C_6 烷基、或嗎啉基)所示之基，或 R^3 及 R^4 為共同表示亞甲二氧基，A 為表示苯基或萘基，或吡啶基、異噁唑基、嘧啶基或吡唑基)。

- 3.如申請專利範圍第 1 或 2 項之醫藥組成物，其為大麻素 2 受體親和性。
- 4.如申請專利範圍第 3 項之醫藥組成物，其為大麻素 2 受體作用性。
- 5.如申請專利範圍第 3 項之醫藥組成物，其為消炎劑。
- 6.如申請專利範圍第 3 項之醫藥組成物，其為免疫抑制劑。
- 7.如申請專利範圍第 3 項之醫藥組成物，其為腎炎治療劑。
- 8.一種式(I)所示化合物或其製藥上所容許鹽，

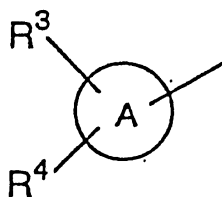


其中式：

六、申請專利範圍



所示之基為表示式：



(式中， R^1 為表示亦可經 C_1-C_6 烷基或 C_2-C_5 伸烷基取代之 C_2-C_3 伸烷基， R^2 為表示式： $-C(=R^5)-R^6$ (式中， R^5 為表示 O 或 S， R^6 為表示 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、亦可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、或 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷基)所示之基、或式： $-SO_2R^7$ (式中， R^7 為表示 C_1-C_6 烷基、可經 C_1-C_6 烷基、鹵 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷基氧基、或硝基取代之苯基、噻吩基)所示之基，且 R^3 及 R^4 分別獨立表示氫、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基、 C_1-C_6 烷基羰基胺基、 C_1-C_6 烷基羰基 (C_1-C_6 烷基胺基)，苯基、鹵素、硝基、鹵 C_1-C_6 烷基、鹵 C_1-C_6 烷氧基、亦可經 C_1-C_6 烷基取代之胺甲醯基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷基亞磺醯基、 C_1-C_6 烷基磺醯基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷基、亦可經 C_1-C_6 烷基取代之胺基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷氧基、吡啶基、嗎

六、申請專利範圍

- 啉基、吡咯烷基、2-氧基吡咯烷基、 C_1-C_6 烷氧亞胺 C_1-C_6 烷基、或式： $-C(=O)-R^H$ (R^H 為氫、 C_1-C_6 烷基、或嗎啉基)所示之基，或 R^3 及 R^4 為共同表示亞甲二氧基， m 為表示 0~2 之整數， A 為表示苯基或萘基，或吡啶基、異噁唑基、嘧啶基或吡唑基)。
- 9.如申請專利範圍第 8 項之化合物或其製藥上所容許鹽，其中 m 為 0。
- 10.如申請專利範圍第 8 項之化合物或其製藥上所容許鹽，其中 R^1 為亦可經 C_2-C_3 伸烷基所取代之碳數 2~3 個之直鏈狀伸烷基。
- 11.如申請專利範圍第 8~10 項中任一項之化合物或其製藥上所容許鹽，其中 R^1 為可經 C_2-C_3 伸烷基所取代之碳數 2~3 個之直鏈狀伸烷基。
- 12.如申請專利範圍第 8~10 項中任一項之化合物或其製藥上所容許鹽，其中 R^6 為 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 烷硫基， R^7 為可經 C_1-C_6 烷基、鹵 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷基氧基、或硝基取代之苯基。
- 13.如申請專利範圍第 8~10 項中任一項之化合物或其製藥上所容許鹽，其中 R^3 及 R^4 分別獨立為氫、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、或 C_1-C_6 烷硫基， A 為苯基或萘基。
- 14.如申請專利範圍第 8 項之化合物或其製藥上所容許鹽，其中 R^1 為 2,2-二甲基伸丙基、2,2-二乙基伸丙基、2,2-伸乙基伸丙基、1-甲基伸丙基、2-甲基伸丙基、伸丙基、

六、申請專利範圍

2,2-二-正丙基伸丙基、2,2-伸丁基伸丙基、2,2-伸戊基伸丙基、1,1-二甲基伸乙基、或1-甲基伸乙基, R^6 為甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、異丁硫基、第二丁硫基、甲氧甲基、乙氧甲基、甲硫甲基、乙硫甲基、或乙胺基, R^7 為甲基、乙基、4-甲苯基、4-硝苯基、3-硝苯基、2-硝苯基、4-甲氧苯基、4-三氟甲基苯基、2-噻吩基、或2-萘基, R^3 為氫、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、二甲胺基、乙醯胺基、N-乙醯甲胺基、二乙胺基、乙基甲胺基、丙基甲胺基、苯基、苯氧基、氟、氯、溴、硝基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、N-甲基胺甲醯基、甲氧羰基、甲烷亞磺醯基、乙烷亞磺醯基、甲烷磺醯基、乙烷磺醯基、乙醯基、甲氧甲基、1-甲氧乙基、3-吡啶基、嗎啉基、吡咯烷基、哌啶基、2-氧基吡咯烷基、1-甲氧亞胺乙基、或嗎啉羰基, R^4 為氫、甲基、乙基、氟、氯、硝基、甲氧基、或乙氧基, 或 R^3 及 R^4 共同表示亞甲二氧基(-O-CH₂-O-), A 為苯環、萘環、吡啶環、或喹啉環。

15. 一種具大麻素 2 受體親和性 or 大麻素 2 受體作用性之醫藥組成物, 其含有如申請專利範圍第 8~14 項中任一項之化合物或其製藥上所容許鹽。

16. 如申請專利範圍第 15 項之醫藥組成物, 其為消炎劑。

六、申請專利範圍

17.如申請專利範圍第 15 項之醫藥組成物，其為免疫抑制劑。

18.如申請專利範圍第 15 項之醫藥組成物，其為腎炎治療劑。