(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201212917 A1
(43)公開日： 中華民國 101 (2012) 年 04 月 01 日

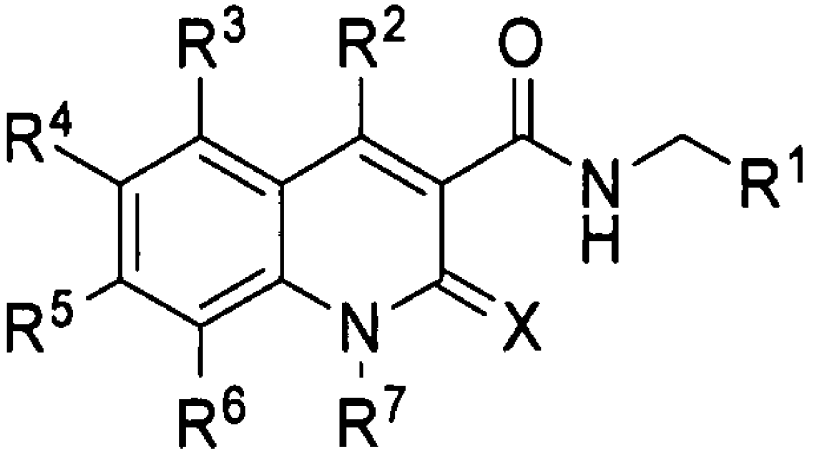
(21)申請案號：100130611 (22)申請日： 中華民國 100 (2011) 年 08 月 26 日
(51)Int. Cl.： *A61K31/47 (2006.01)* *C07D215/00 (2006.01)*
*A61P25/00 (2006.01)*
(30)優先權：2010/08/27 歐洲專利局 10008920.0
(71)申請人：歌林達股份有限公司 (德國) (DE)
德國
(72)發明人：庫內爾特 史芬 (DE)；巴仁貝爾格 葛雷格歐爾 BAHRENBERG, GREGOR (DE)；克雷斯 亞錫姆 KLESS, ACHIM (DE)；施羅得 沃夫崗 (DE)
(74)代理人：李品佳
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：0 共 148 頁

(54)名稱

作為ＫＣＮＱ２／３鉀離子通道調節劑之經取代之２－氧基－及２－硫基－二氫喹啉－３－羧醯胺
SUBSTITUTED 2-OXO-AND 2-THIOXO-DIHYDROQUINOLINE-3-CARBOXAMIDES AS KCNQ2/3 MODULATORS

(57)摘要

本發明係有關包含經取代 2-氧基-及 2-硫基-二氫喹啉-3-羧醯胺(2-oxo- and 2-thioxo-dihydroquinoline-3-carboxamides)之化合物成份之藥物且有關用於治療且或預防疼痛以及另外之疾病及/或失調。




(I)

(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201212917 A1
(43)公開日： 中華民國 101 (2012) 年 04 月 01 日

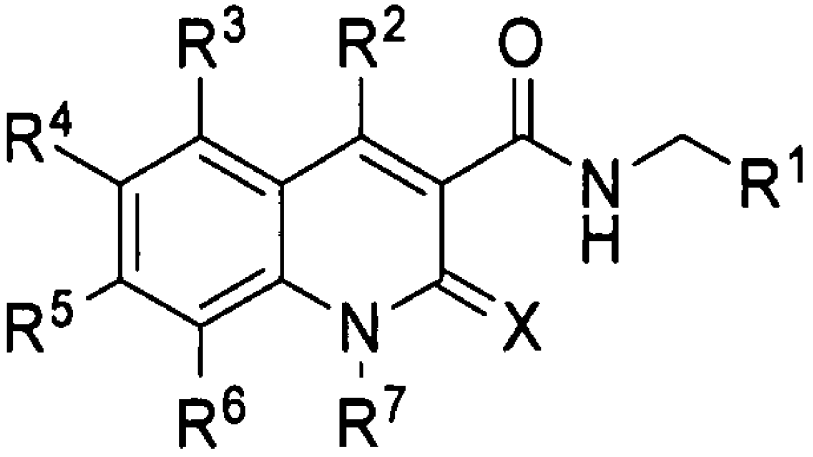
(21)申請案號：100130611 (22)申請日： 中華民國 100 (2011) 年 08 月 26 日
(51)Int. Cl.： *A61K31/47 (2006.01)* *C07D215/00 (2006.01)*
*A61P25/00 (2006.01)*
(30)優先權：2010/08/27 歐洲專利局 10008920.0
(71)申請人：歌林達股份有限公司 (德國) (DE)
德國
(72)發明人：庫內爾特 史芬 (DE)；巴仁貝爾格 葛雷格歐爾 BAHRENBERG, GREGOR (DE)；克雷斯 亞錫姆 KLESS, ACHIM (DE)；施羅得 沃夫崗 (DE)
(74)代理人：李品佳
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：0 共 148 頁

(54)名稱

作為ＫＣＮＱ２／３鉀離子通道調節劑之經取代之２－氧基－及２－硫基－二氫喹啉－３－羧醯胺
SUBSTITUTED 2-OXO-AND 2-THIOXO-DIHYDROQUINOLINE-3-CARBOXAMIDES AS KCNQ2/3 MODULATORS

(57)摘要

本發明係有關包含經取代 2-氧基-及 2-硫基-二氫喹啉-3-羧醯胺(2-oxo- and 2-thioxo-dihydroquinoline-3-carboxamides)之化合物成份之藥物且有關用於治療且或預防疼痛以及另外之疾病及/或失調。




(I)

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係有關包含經取代 2-氧基-及 2-硫基-二氫喹啉-3-羧醯胺之化合物成份之藥物，且有關用於治療且或預防疼痛以及另外之疾病及/或失調。

【先前技術】

疼痛治療，尤其係神經性疼痛，在醫學上有相當的重要性。世界各地都需要一種有效之疼痛治療。對病患而言，針對目標為導向之治療慢性及非慢性狀態疼痛有相當迫切之需要，對於了解如何成功及滿意地於病人身上治療疼痛，最近已有相當多的科學研究發表在應用止痛及痛覺基礎研究之領域上。

慢性疼痛之一病理生理特徵係神經細胞之過度興奮。鉀離子通道之活性對於神經細胞之興奮性有決定性之影響，因其斷然地決定了細胞之靜止膜電位，因此決定了興奮性之閾值。具有分子亞型 KCNQ2/ 3 (KV7.2/7.3)之異聚合体體鉀離子通道表現在中樞神經系統（海馬迴，杏仁核）及周邊神經系統（背根神經節）中各種區域之神經細胞上，且調節其興奮性。KCNQ2/3 鉀離子通道之活化導致細胞膜過極化，進而伴隨著神經細胞電位興奮性之下降。位於背根神經節上之表現出 KCNQ2/3 鉀離子通道之神經細胞參與將痛覺刺激自末梢神經傳輸至脊椎末端（巴斯摩等人.，神經科學期刊. 2003; 23(18): 7227-36) [*PASSMORE ET AL., J. NEUROSCI. 2003; 23(18): 7227-36*]。

因此可以檢測出 KCNQ2/3 鉀離子通道促效劑 Retigabine 在臨床前之神經性病變及發炎性疼痛模型上之止痛作用(布拉克班-蒙羅及堅申，歐洲藥理學期刊. 2003; 460(2-3); 109-16; 都斯特等人.， Naunyn Schmiedebergs 藥理檔案期刊 2004; 369(4): 382-390)

[*Blackburn-Munro and Jensen, Eur J Pharmacol. 2003; 460(2-3); 109-16; Dost et al., Naunyn Schmiedebergs Arch Pharmacol 2004; 369(4): 382-390*]。

因此對疼痛治療而言，KCNQ2/3 鉀離子通道代表一適合之起點；尤其係由下列之群所組成之疼痛，其包括慢性疼痛、急性疼痛、神經性疼痛、發炎性疼痛、內臟性疼痛及肌肉性疼痛所涵蓋之疼痛（尼爾生等人.，歐洲藥理學期刊. 2004; 487(1-3): 93-103) [*Nielsen et al., Eur J Pharmacol. 2004; 487(1-3): 93-103*]，特別係神經性疼痛及發炎性疼痛。

此外，對於許多另外之疾病，如偏頭痛（美國專利 US2002/0128277）、認知疾病（顧理克夫，治療目標之專家意見期刊 2003; 7(6): 737-748) [*Gribkoff, Expert Opin Ther Targets 2003; 7(6): 737-748*]、焦慮症（可爾斯嘎德 等人.，藥理學和實驗療法期刊. 2005， 14(1): 282-92) [*Korsgaard et al., J Pharmacol Exp Ther. 2005, 14(1): 282-92*]、癲癇（威肯登等人.，治療專利之專家意見期刊 2004; 14(4): 457-469; 顧理克夫，治療目標之專家意見期刊 2008， 12(5): 565-81; 米舍利等人.，現時藥理學之意見期刊 2008， 8(1): 65-74) [*Wickenden et al., Expert Opin Ther Pat 2004; 14(4): 457-469; Gribkoff, Expert Opin Ther Targets 2008, 12(5): 565-81; Miceli et al., Curr Opin Pharmacol 2008, 8(1): 65-74*]、小便失禁（史祖連等人.，泌尿學期刊 2004; 172: 2054-2058) [*Streng et al., J Urol 2004; 172: 2054-2058*]、成癮症(韓申等人.，歐洲藥理學期刊 2007， 570(1-3): 77-88) [*Hansen et al., Eur J Pharmacol 2007, 570(1-3): 77-88*]、躁鬱症/雙極性異常（登克等人.，癲癇及行為期刊 2008， 12(1): 49-53) [*Dencker et al., Epilepsy Behav 2008, 12(1): 49-53*]及肌張力障礙相關的運動異常（理炔等人.，英

國藥理學期刊 2006， 149(6): 747-53) [*Richter et al., Br J Pharmacol 2006, 149(6): 747-53*]，KCNQ2/3 鉀離子通道係一適合治療之目標。

經取代之喹啉及其它化合物已被得知，從歐洲專利 EP 1 142 877; I.V. 烏克連特等人.，雜環化合物化學期刊， 克魯維爾集團， Vol. 42， No. 4， 2006， pages 475-487; I.V. 烏克連特等人.， 雜環化合物化學期刊，克魯維爾集團， Vol. 46， No. 4， 2010， pages 445-451; I.V. 烏克連特 等人.，雜環化合物化學期刊，克魯維爾集團， Vol. 43， No. 1， 2007， pages 58-62; 美國專利 US 2007/254862， 美國專利 US 2007/249605，及世界專利 WO 2005/049608 等文獻 [*EP 1 142 877; I.V. Ukrainets et al., Chemistry of Heterocyclic Compounds, Kluwer, Vol. 42, No. 4, 2006, pages 475-487; I.V. Ukrainets et al., Chemistry of Heterocyclic Compounds, Kluwer, Vol. 46, No. 4, 2010, pages 445-451; I.V. Ukrainets et al., Chemistry of Heterocyclic Compounds, Kluwer, Vol. 43, No. 1, 2007, pages 58-62; US 2007/254862, US 2007/249605, and WO 2005/049608*]。

對 KCNQ2/3 $K^+$鉀離子通道具親合性之經取代之化合物已從先前技藝中 (世界專利 WO 2008/046582，WO 2010/046108)得知。經取代之喹諾酮(Quinolone)已從世界專利 WO2007/070359 得知。經取代喹諾酮環酮之化合物則另外從世界專利 WO 2008/113006 得知。

另外之具有相當或較好性質，不只限於 KCNQ2/3 鉀離子通道親和性本身(*強度，療效*)之化合物，有其需要性。

因此，改善新陳代謝之穩定性，水性媒介中之溶解度或通透性可能會有助益。這些因素可對口服生物可利用率持有利之影響或

改變 PK/PD(藥物動力學/藥效學)之特性；例如，這可導致更長及有利之療效長度。負責吸收及排出藥學組成物之運送分子僅有微弱或幾近不存在之互動，被視為改善生物可用率及與其它藥學組成物持有最低互動之一特徵。

此外，與負責分解及排出作用藥物組成物之酵素之互動作用應係越低越佳，此測試結果也暗示可期待藥學組成物僅有最低或無任何之互動作用。此外，假如這些化合物對其他 KCNQ 家族之受體(*專一性*)，如針對 KCNQ1，KCNQ3/5 或 KCNQ4，表現出高選擇性，可視為具有優勢。高選擇性可對副作用之表現產生正面之影響：例如，對 KCNQ1 鉀離子通道(也)具有親和性之化合物較容易有心臟副作用之可能性。因此，對 KCNQ1 鉀離子通道具有高選擇性較為理想。然而，假如這些化合物對其他受體表現出高選擇性，他們也可被視為具有優勢。例如，這些化合物可視為具有優勢，假如他們對 hERG (Human Ether-a-go-go Related Gene)鉀離子通道或 L-型鈣離子通道表現出低親合力 (如苯基烷基胺基，硫氮雜環庚三烯，二氫吡啶之結合部位)，因這些受體已知對心臟有副作用之可能性。此外，改善與其他內源性蛋白 (即受體或酵素)結合之選擇性，可能會導致較好之副作用表現，進而導致較佳之耐藥性。

【發明內容】

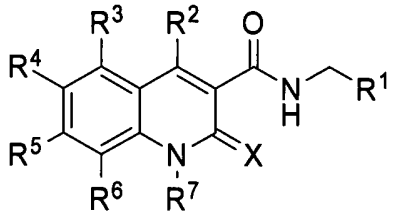
因此本發明之目的係提供新穎，且優於先前技藝之化合物。該諸化合物應，特別係作為藥物組成物中之藥理活性成份，較佳為適合治療及/或預防至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之失調及/或疾病之藥物組成物。

此一目標藉由本專利申請範圍中之範圍標的所達成。

出乎意料地，人們已經發現，根據下列通式(I)之經取代之化

合物係適合用於治療疼痛。出乎意料地，根據下列通式（I）之經取代之化合物也對 KCNQ2/3 鉀離子通道具有良好親和性，因而適合預防及/或治療至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之失調及/或疾病。該經取代化合物因此作用為一調控劑，即 KCNQ2/3 鉀離子通道之促效劑或拮抗劑。

本發明因此係有關一通式(I)之經取代之化合物。



(I)，

其中

X　代表氧或硫原子，較佳為氧原子。

$R^1$　表示一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基($C_{1-10}$-aliphatic residue)，未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基($C_{3-10}$-cycloaliphatic residue)或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基(3 to 10 membered heterocycloaliphatic residue)，其等各自為未經取代或經取代一次或數次，且其等各自隨意地經由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴連接，其可為未經取代或經取代一或數次；芳香基(Aryl)或雜芳香基(Heteroaryl)，其等各自為未經取代或經取代一或數次且其等各自隨意地經由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴連接，其可為未經取代或經取代一或數次；

$R^2$　代表表示氟、氯、溴、碘等原子；氰基(CN)；三氟甲基($CF_3$)；醛基 C(=O)H；硝基($NO_2$)；三氟甲氧基($OCF_3$)；三氟甲硫基

($SCF_3$)；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基($C_{1-4}$-aliphatic residue)、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基(C(=O)-$C_{1-4}$-aliphatic residue)、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基(C(=O)-O-$C_{1-4}$ aliphatic residue)、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基(C(=O)NH-$C_{1-4}$-aliphatic residue)、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基(C(=O)-N($C_{1-4}$-aliphatic residue)$_2$)，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或經取代一或數次；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基(O-$C_{1-4}$-aliphatic residue)、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基(O-C(=O)-$C_{1-4}$-aliphatic residue)、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基(S(=O)$_2$-O-$C_{1-4}$- aliphatic residue)，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基($C_{3-6}$-cycloaliphatic residue)或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基(3 to 6 membered heterocycloaliphatic residue)且各自隨意地經由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴連結，其為未經取代或或經取代一或數次；

$R^3$、$R^4$、$R^5$及$R^6$彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；醛基；羧基(C(=O)-OH)；醯胺基；三氟甲硫基；羥基磺醯基(S(=O)$_2$-OH)；硝基；三氟甲氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基，其中

含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或經取代一或數次；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或經取代一或數次；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基 (NH($C_{1-4}$-aliphatic residue))、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基(N($C_{1-4}$-aliphatic residue)$_2$)、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基 (NH-C(=O)-$C_{1-4}$ aliphatic residue)、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基 (NH-S(=O)$_2$-$C_{1-4}$-aliphatic residue)、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基 (N($C_{1-4}$-aliphatic residue)-C(=O)-$C_{1-4}$aliphatic residue)或一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基 (N($C_{1-4}$-aliphatic residue)-S(=O)$_2$-$C_{1-4}$ aliphatic residue)，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且其等各自隨意地經由一含 1 至 4 個碳原子之

脂肪烴連結，其可為未經取代或經取代一或數次；較佳之情況為 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中至少有一個不等於氫原子，

$R^7$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基($C_{3-10}$-cycloaliphatic residue)或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且其等各自隨意地經由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴連結，其可為未經取代或經取代一或數次；

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基之情況下，該 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基係經由一碳原子連結。

其中“脂肪基”及“脂肪烴殘基”可各自為支鏈或直鏈，飽合或未飽合，

其中“環脂肪烴殘基”及“雜環脂肪烴殘基”可各自為飽合或未飽合；

對於“脂肪烴”及“脂肪烴殘基”之“一或數次取代”，其對應之殘基或官能基而言，“經取代一或數次”係指以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數個彼此各自無關之氫原子，其包括氟，氯，溴，碘等原子；硝基；氨基($NH_2$)；被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂基羰基取代之胺基(NH-C(=O)-$C_{1-4}$-aliphatic residue)；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基；羥基；三氟甲氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基；硫氫基(SH)；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基；羥基磺醯基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基；一

被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基 ($S(=O)_2$-NH-$C_{1-4}$- aliphatic residue)；氰基(CN)；三氟甲基；醛基；羧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基；一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基；醯胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基；

對於 “環脂肪烴殘基” 及 “雜環脂肪烴殘基” 之“一或數次取代”，其對應之殘基而言，經取代一或數次係指以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數個彼此各自無關之氫原子，其包括氟、氯、溴、碘等原子，硝基；氨基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基；一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂基羰基取代之胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基；側氧基(=O)；羥基(OH)；三氟甲氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基；硫氫基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基；羥基磺醯基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基；氰基；三氟甲基；醛基；羧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基；一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基；醯胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基；

對於“芳香基”及“雜芳香基”之“一或數次取代”，其對應之殘

基而言，經取代一或數次係指以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數個彼此各自無關之氫原子，其包括氟、氯、溴、碘等原子，硝基；氨基；；；；；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基；一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基；烴基；三氟甲氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基；硫氫基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基；羥基磺醯基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基($S(=O)_2$-$C_{1-4}$-aliphatic residue)；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基；氰基；三氟甲基；醛基；羧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基；一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基；苯甲基(Benzyl)；芳香基；雜芳香基；醯胺基；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基；

下列之化合物為例外：

1-乙基-N-(-甲氧苯甲基)-4-甲基-2-氧基-1,2-二氫喹啉-3-羧醯(1-ethyl-N-(4-methoxybenzyl)-4-methyl-2-oxo-1,2-dihydroquinoline-3-carboxamide)，

其形式為游離化合物；消旋物(Racemate)；對映異構物(Enantiomers)、非對映異構物(Diastereomers)、對映異構物或以任何比例混合之非對映異構物或獨立對映異構物或非對映異構物之混合物；或生理可接受之酸或鹼鹽之形式，或溶劑化物之形式，

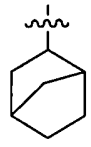
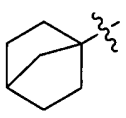
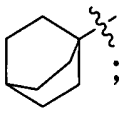
特別是水合物。

本發明之術語 “含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基”，“含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基”，“含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基”，“含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基”及“含 1 至 2 個碳原子之脂肪烴殘基”等於本發明之定義中包含飽和或未飽和之無環脂肪烴烴基，其可為支鍵或直鍵以及未經取代或經取代一或數次，包括 1 至 10 個，或 1 至 8 個或 1 至 6 個或 1 至 4 個或 1 至 2 個碳原子，即各自為含 1 至 10 個碳原子之烷基($C_{1-10}$-Alkanyl)，含 2 至 10 個碳原子之烯基($C_{2-10}$-Alkenyl)及含 2 至 10 個碳原子之炔基($C_{2-10}$-Alkynyl)以及含 1 至 8 個碳原子之烷基($C_{1-8}$-Alkanyl)，含 2 至 8 個碳原子之烯基($C_{2-8}$-Alkenyl)及含 2 至 8 個碳原子之炔基($C_{2-8}$-Alkynyl)以及含 1 至 6 個碳原子之烷基($C_{1-6}$-Alkanyl)，含 2 至 6 個碳原子之烯基($C_{2-6}$-Alkenyl)及含 2 至 6 個碳原子之炔基($C_{2-6}$-Alkynyl)以及含 1 至 4 個碳原子之烷基($C_{1-4}$-Alkanyl)，含 2 至 4 個碳原子之烯基($C_{2-4}$-Alkenyl)及含 2 至 4 個碳原子之炔基($C_{2-4}$-Alkynyl)，以及含 1 至 2 個碳原子之烷基，含 2 個碳原子以上之烯基及含 2 個碳原子之炔基。這種情況下，烯基包括至少一個 C-C 雙鍵(一 C=C-鍵)且炔基包括至少一個 C-C 三鍵(一 C≡C-鍵)。較佳之脂肪烴殘基係選自烷基(烷)及烯基組成之群，更較佳為烷基。較佳之含 1 至 10 個碳原子之烷基之殘基係選自由下列組成之群、其包括甲基(Methyl)、乙基(Ethyl)、正丙基(n-Propyl)、2-丙基(2-Propyl)、正丁基(n-Butyl)、異丁基(Isobutyl)、第二丁基(sec.Butyl)、第三丁基(ter. Butyl)、正戊基(n-Pentyl)、異戊基(Isopentyl)、新戊基(Neopentyl)、正己基(n-Hexyl)、正庚基(n-Heptyl)、正辛基(n-Octyl)、壬基(Nonyl)及癸基(Decyl)。較佳之含 1 至 8 個碳原子之烷基之殘基係選自由下列組成之群、其包括

甲基、乙基、正丙基、2-丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、正戊基、異戊基、新戊基、正己基、正庚基及正辛基。較佳之含 1 至 6 個碳原子之烷基之殘基係選自由下列組成之群，其包括甲基、乙基、正丙基、2-丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、正戊基、異戊基、新戊基及正己基。較佳之含 1 至 4 個碳原子之烷基之殘基係選自甲基、乙基、正丙基、2-丙基、正丁基、異丁基、次級戊基及第三戊基。較佳之含 2 至 10 個碳原子之烯基之殘基係選自由下列組成之群，其包括乙烯基(乙烯)(Ethenyl/Vinyl)、丙烯基(Propenyl) [丙-2-烯基(-$CH_2CH=CH_2$)、丙-1-烯基(-$CH=CH-CH_3$)、異丙烯基(-$C(=CH_2)-CH_3$)]、丁烯基(Butenyl)、戊烯基(Pentenyl)、己烯基(Hexenyl)、庚烯基(Heptenyl)、辛烯基(Octenyl)、壬烯基(Nonenyl)及癸烯基(Decenyl)。較佳之含 2 至 8 個碳原子之烯基之殘基係選自由下列組成之群，其包括乙烯基(乙烯)、丙烯基 (丙-2-烯基、丙-1-烯基、異丙烯基)、丁烯基、戊烯基、己烯基、庚烯基及辛烯基。較佳之含 2 至 6 個碳原子之烯基之殘基係選自由下列組成之群，其包括乙烯基(乙烯)、丙烯基(丙-2-烯基、丙-1-烯基、異丙烯基)、丁烯基、戊烯基及己烯基。較佳之含 2 至 4 個碳原子之烯基之殘基係選自由下列組成之群，其包括乙烯基(乙烯)、丙烯基(丙-2-烯基、丙-1-烯基、異丙烯基)及丁烯基。較佳之含 2 至 10 個碳原子之炔基之殘基係選自由下列組成之群，其包括乙炔基(Ethynyl)、丙炔基(Propynyl)[丙-2-炔基(-$CH_2$-C≡CH)、丙-1-炔基(-C≡C-$CH_3$)]、丁炔基(Butynyl)、戊炔基(Pentynyl)、己炔基(Hexynyl)、庚炔基(Heptynyl)、辛炔基(Octynyl)、壬炔基(nonynyl)及癸炔基(decynyl)。較佳之含 2 至 8 個碳原子之炔基之殘基係選自由下列組成之群，其包括乙炔基、丙炔基(丙-2-炔基、丙-1-炔基)、丁炔基、戊炔基、己炔基、庚炔

基及辛炔基。較佳之含 2 至 6 個碳原子之炔基之殘基係選自由下列組成之群，其包括乙炔基、丙炔基(丙-2-炔基、丙-1-炔基)、丁炔基、戊炔基及己炔基。較佳之含 2 至 4 個碳原子之炔基之殘基係選自乙炔基、丙炔基(丙-2-炔基、丙-1-炔基)及丁炔基。

本發明目的中之術語“含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基”及“含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基"係指各自包括 3、4、5 或 6 個碳原子及 3、4、5、6、7、8、9、或 10 個碳原子之環狀脂肪烴碳氫化合物，其等各自之烴基可為飽和或未飽和 (但不為芳香族)，未經取代或經取代一或數次。環脂肪烴殘基可藉由任何期望及可能之環脂肪烴殘基之環成員結合至對應之上級通式。環脂肪烴殘基也可與另外之飽和，(部分)未飽和，(雜)環狀，芳香族(Aromatic group)，或雜芳香烴環系統縮合，即未經取代或經取代一或數次之環脂肪烴，雜環脂肪烴，芳香基或雜芳香基等殘基。含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基可進一步以單一或多重型式連接，例如金剛烷基，雙環[2.2.1]庚基或雙環[2.2.2]辛基。較佳之含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基係選自由下列組成之群，其包括環丙基(Cyclopropyl)；環丁基(Cyclobutyl)；環戊基(Cyclopentyl)；環己基(Cyclohexyl)；環庚基(Cycloheptyl)；環辛基(Cyclooctyl)；環壬基(Cyclononyl)；環癸基(Cyclodecyl)；金剛烷基(Adamantyl)；

；；；；環戊烯基(Cyclopentenyl)；環己烯基(Cyclohexenyl)；環庚烯基(Cyclo 及環辛烯基(Cycloоctenyl)。較佳之含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基係選自由下列組成之群，其包括環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環戊烯基及環己烯基。

本發明目的中之術語“3至6員雜環脂肪烴殘基”及“3至10員雜環脂肪烴殘基”係指分別包含3至6個，即3、4、5或6個環成員及3至10，即3、4、5、6、7、8、9或10個環成員之飽和或未飽和(但不包括芳香族)之雜環脂肪烴殘基，其等各自有，至少一個，假如適當，二或三個碳原子被由選自下列組成之群之彼此無關之雜原子或雜原子族所取代，其包括氧、硫原子等，礦醯基，氮原子，亞氨基及被含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之亞甲胺基(N($C_{1-8}$ alkyl))，較佳為甲基亞胺基(N($CH_3$)-)，其中之環成員可係未經取代或經取代一或數次。雜環脂肪烴殘基可藉由任何期望及可能之雜環脂肪烴殘基之環成員連接至對應之上級通式。雜環脂肪烴殘基也可與另外之飽和，(部分)未飽和，(雜)環脂肪烴，芳香族，或雜芳香烴環系統縮合，即未經取代或經取代一或數次之環脂肪烴，雜環脂肪烴，芳香基或雜芳香基。較佳之雜環脂肪烴殘基係選自由下列組成之群，其包括含氮雜環丁基(Azetidinyl)、氮丙啶基(Aziridinyl)、氮雜環庚基(Azepanyl)、氮雜環辛基(Azocanyl)、二氮雜環庚基(Diazepanyl)、二硫雜環戊基(Dithiolanyl)、二氫喹啉基(Dihydroquinolinyl)、二氫吡咯基(Dihydropyrrolyl)、二氧環己基(Dioxanyl)、二氧環戊基(Dioxolanyl)、二氧環庚基(Dioxepanyl)、二氫茚基(Dihydroindenyl)、二氫吡啶基(Dihydropyridinyl)、二氫呋喃基(Dihydrofuranyl)、二氫異喹啉基(Dihydroisoquinolinyl)、二氫吲哚基(Dihydroindolinyl)、二氫異吲哚基(Dihydroisoindolyl)、咪唑烷基(Imidazolidinyl)、異噁唑烷基(Isoxazolidinyl)、嗎啉基(Morpholinyl)、環氧乙烷基(Oxiranyl)、環氧丙烷(Oxetanyl)、吡咯烷基(Pyrrolidinyl)、哌口井基(Piperazinyl)、4-甲基六氫啶基(4-Methylpiperazinyl)、六氫啶基(Piperidinyl)、吡唑啶基(Pyrazolidinyl)、吡喃基(Pyranyl)、四氫吡咯基

(Tetrahydropyrrolyl)、四氫吡喃基(Tetrahydropyranyl)、四氫喹啉基(Tetrahydroquinolinyl)、四氫異喹啉基(Tetrahydroisoquinolinyl)、四氫吲哚基啉基(Tetrahydroindolinyl)、四氫呋喃基(Tetrahydrofuranyl)、四氫吡啶基(Tetrahydropyridinyl)、四氫噻吩基(Tetrahydrothiophenyl)、四氫吡啶吲哚基(Tetrahydropyridoindolyl)、四氫萘基(Tetrahydronaphthyl)、四氫咔啉基(Tetrahydrocarbolinyl)、四氫異噁唑吡啶基(Tetrahydroisoxazolopyridinyl)、四氫噻唑基(Thiazolidinyl)及硫代嗎啉基(Thiomorpholinyl)。

本發明目的中之術語“芳香基”係指含 6 至 14 環成員之芳基碳氫化合物，包含苯基(Phenyl)及萘基(Naphthyl)。每一芳香基可為未經取代或經取代一或數次，其中芳香基之取代基可為相同或不同且可在任何期望或可能之芳香基之位置上。芳香基可藉由任何期望及可能之芳香基之環成員與上級通式結合。芳香基也可與另外飽和，(部分)未飽和，(雜)環脂肪烴，芳香族，或雜芳香烴環系統縮合，即未經取代或經取代一或數次之環脂肪烴，雜環狀，芳香基或雜芳香基殘基。經縮合之芳香基之例子包括苯並二氧環戊基 (Benzodioxolanyl) 及苯並二氧環己基 (Benzodioxanyl)。較佳為芳香基係選自由下列組成之群，其包括苯基，1-萘基、2-萘基、茀基及蒽基，其等各自可為未經取代或經取代一或數次。一特別較佳之芳香基為苯基，未經取代或經取代一或數次。

本發明目的中之術語 “雜芳香基” 代表一包含至少 1，如果適合，2、3、4 或 5 個雜原子之 5 或 6 員之環芳香族殘基，其中之雜原子係選自彼此各自無關之下列組成之群，其包括硫、氮及氧原子且該雜芳香基殘基可為未經取代或經一或數次取代；於取代雜芳香基之情況下，取代基可為相同或不同且可在任何期望或可

能之雜芳香基之位置上。與上級通式之連接可藉由任何期望及可能之雜芳香基殘基之環成員達成。雜芳香基也可為包含最多達 14 員之雙或多環系統之一部份，其中該環系統可藉由另外之飽和，(部份)飽和，(雜)環脂肪烴或芳香族或雜芳香族構成，即係與未經取代或單次取代或數次取代之環脂肪烴，雜環脂肪烴，芳香基或雜芳香基殘基。較佳之雜芳香基係選自由下列組成群，其包括苯並呋喃基(Benzofuranyl)、苯並咪唑基(Benzoimidazolyl)、苯並噻吩基(Benzothienyl)、苯並噻二唑基(Benzothiadiazolyl)、苯並噻唑基(Benzothiazolyl)、苯並三唑基(Benzotriazolyl)、苯並噁唑基(Benzooxazolyl)、苯並噁二唑基(Benzooxadiazolyl)、喹唑啉基(Quinazolinyl)、喹噁啉基(Quinoxalinyl)、咔唑基(Carbazolyl)、喹啉基(Quinolinyl)、二苯並呋喃基(Dibenzofuranyl)、二苯並噻吩基(Dibenzothienyl)、呋喃基(Furyl/Furanyl)、咪唑基(Imidazolyl)、咪唑並噻唑基(Imidazothiazolyl)、吲唑基(Indazolyl)、氮茚基(Indolizinyl)、吲哚基(Indolyl)、異喹啉基(Isoquinolinyl)、異噁唑基(Isoxazoyl)、異噻唑基(Isothiazolyl)、吲哚基(Indolyl)、萘啶基(Naphthyridinyl)、噁唑基(Oxazolyl)、噁二唑基(Oxadiazolyl)、啡口井基(Phenazinyl)、吩噻嗪基(Phenothiazinyl)、苯並嗒口井基(Phthalazinyl)、吡唑基(Pyrazolyl)、吡啶基(Pyridyl) (2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基)(2-Pyridyl、3-Pyridyl、4-Pyridyl)、吡咯基(Pyrrolyl)、嗒口井基(Pyridazinyl)、嘧啶基(Pyrimidinyl)、吡口井基(Pyrazinyl)、嘌呤基(Purinyl)、啡口井基(Phenazinyl)、噻吩基(Thienyl)(Thiophenyl)、三唑基(Triazolyl)、四唑基(Tetrazolyl)、噻唑基(Thiazolyl)、噻二唑基(Thiadiazolyl)及三口井基(Triazinyl)。呋喃基、吡啶基、噁唑基、噻唑基及噻吩基為特別較佳。

本發明目的中之術語“芳香基，雜芳香基，雜環脂肪烴殘基或

環脂肪烴殘基經由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴或一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴連結”係表示 “芳香基，雜芳香基，雜環脂肪烴殘基或環脂肪烴殘基”有上述界定之意義且可各自藉由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴或一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴與各自之上級通式連接。所有情況之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴及含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴可為支鍵或直鍵，未經取代或經取代一或數次。所有情況之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴可為進一步飽和或未飽和，即可為一含 1 至 4 個碳原子之炔烴基($C_{1-4}$-alkylene)，一含 2 至 4 個碳原子之伸烯基($C_{2-4}$-alkenylene)或含 2 至 4 個碳原子之亞炔基($C_{2-4}$-alkynylene)。同樣之定義條件也可引申至含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴，即其等各自之含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴可為飽和或未飽和，即指可為含 1 至 8 個碳原子之炔屬烴基($C_{1-8}$-alkylene)，含 2 至 8 個碳原子之伸烯基($C_{2-8}$-alkenylene)，或含 2 至 8 個碳原子之亞炔基($C_{2-8}$-alkynylene)。較佳之選擇為含 1 至 4 個碳原子之脂肪基為一含 1 至 4 個碳原子之炔屬烴基或一含 2 至 4 個碳原子之伸烯基，含 1 至 4 個碳原子之炔屬烴基為更較佳之選擇。較佳之選擇為含 1 至 8 個碳原子之脂肪基係一含 1 至 8 個碳原子之炔屬烴基或一含 2 至 8 個碳原子之伸烯基，含 1 至 8 個碳原子之炔屬烴基為更較佳之選擇。較佳之含 1 至 4 個碳原子之炔屬烴基係選自由下列組成之群，其包括亞甲基(-$CH_2$-)、1,2-亞乙基(-$CH_2$-$CH_2$-)、甲基亞甲基(-CH($CH_3$)-)、1,3-亞丙基(-$CH_2$-$CH_2$-$CH_2$-)、甲基-1,2-亞乙基(-CH($CH_3$)-$CH_2$-)、乙基亞甲基(-CH($CH_2CH_3$)-)、1,4-亞丁基(-$CH_2$-($CH_2$)$_2$-$CH_2$-)、1-甲基-1,3-亞丙基(-CH($CH_3$)-CH2-$CH_2$-)、2-甲基-1,3-亞丙基(-$CH_2$-CH($CH_3$)-$CH_2$-)、1,2-二甲基-1,2-亞乙基(-CH($CH_3$)-CH($CH_3$)-)、乙基-1,2-亞乙基(-CH($CH_2CH_3$)-$CH_2$-)、1,2-

亞異丁基(-C($CH_3$)$_2$-$CH_2$-)、丙基亞甲基(-CH($CH_2CH_2CH_3$)-)、1-甲基-1-乙基亞甲基(-C($CH_3$)($CH_2CH_3$)-)。較佳之含2至4個碳原子之伸烯基係選自由下列組成之群，其包括乙烯基(-CH=CH-)、1,3-亞丙烯基(-CH=CH-$CH_2$-)、1-甲基-1,2-亞乙烯基(-C($CH_3$)=$CH_2$-)、1,4-亞丁-1-烯基(-CH=CH-$CH_2$-$CH_2$-)、1,4-亞丁-2-烯基(-$CH_2$-CH=CH-$CH_2$-)、1,4-亞丁-1,3-二烯基(-CH=CH-CH=CH-)、1-甲基-1,3-亞丙烯基(-C($CH_3$)=CH-$CH_2$-)、2-甲基-1,3-亞丙烯基(-CH=C($CH_3$)-$CH_2$-)、1,2-二甲基-1,2-亞乙烯基(-C($CH_3$)=C($CH_3$)-)、1-乙基-1,3-亞乙烯基(-C($CH_2CH_3$)=CH-)。較佳之含2至4個碳原子之亞炔基係選自由下列組成之群，其包括1,2-亞乙炔基(-C≡C-)、1,3-亞丙炔基(-C≡C-$CH_2$-)、1,4-亞丁-1-炔基(-C≡C-$CH_2$-$CH_2$-)、3-甲基-1,3-亞丙炔基(-C≡C-CH($CH_3$)-)、1,4-亞丁-2-炔基(-$CH_2$-C≡C-$CH_2$-)、亞丁-1,3-二炔基(-C≡C-C≡C-)。較佳之含1至8個碳原子之炔屬烴基係選自由下列組成之群，其包括亞甲基、1,2-亞乙基、1,2-亞乙基、甲基亞甲基、1,3-亞丙基、甲基-1,2-亞乙基、乙基亞甲基、1,4-亞丁基、1-甲基-1,3-亞丙基、2-甲基-1,3-亞丙基、1,2-二甲基-1,2-亞乙基、乙基-1,2-亞乙基、1,2-亞異丁基、丙基亞甲基、1-甲基-1-乙基亞甲基、1,5-亞戊基(-$CH_2$-($CH_2$)$_3$-$CH_2$-)、1-甲基-1,4-亞丁基(-CH($CH_3$)-$CH_2$-$CH_2$-$CH_2$-)、2-甲基-1,4-亞丁基(-$CH_2$-CH($CH_3$)-$CH_2$-$CH_2$-)、1,3-二甲基-1,3-亞丙基(-CH($CH_3$)-$CH_2$-CH($CH_3$)- )、1,2-二甲基-1,3-亞丙基(-CH(CH3)-CH($CH_3$)-$CH_2$-)、1,3-亞異戊基(-C($CH_3$)$_2$-$CH_2$-$CH_2$-)、2,2-甲基-1,3-亞丙基(-$CH_2$-C($CH_3$)$_2$-$CH_2$-)、1-乙基-1,3-亞丙基(-CH($CH_2CH_3$)-$CH_2$-$CH_2$-)、2-乙基-1,3-亞丙基(-$CH_2$-CH($CH_2CH_3$)-$CH_2$-)、甲基亞異丁基(-C($CH_3$)$_2$-CH($CH_3$)- )、

1-乙基-2-甲基-1,2-亞乙基(-CH($CH_2CH_3$)-CH($CH_3$)-)、1-甲基-1-乙基-1,2-亞乙基(-C($CH_3$)($CH_2CH_3$)-$CH_2$-)、1-丙基-1,2-亞乙基(-CH($CH_2CH_2CH_3$)-$CH_2$-)、1-丙基-1,2-亞乙基(-C($CH_2CH_2CH_3$)-$CH_2$-)、丁基亞甲基(-CH($CH_2CH_2CH_2CH_3$)-)、甲基丙基亞甲基(-C($CH_3$)($CH_2CH_2CH_3$)-)、二乙基亞甲基(-C($CH_2CH_3$)$_2$-)、1,6-亞己基(-$CH_2$-($CH_2$)$_4$-$CH_2$-)。較佳之含2至8個碳原子之伸烯基係選自由下列組成之群，其包括乙烯基、1,3-亞丙烯基、1-甲基-1,2-亞乙烯基、1,4-亞丁-1-烯基、1,4-亞丁-2-烯基、1,4-亞丁-1,3-二烯基、1-甲基-1,3-亞丙烯基、2-甲基-1,3-亞丙烯基、1,2-二甲基-1,2-亞乙烯基、1-乙基-1,3-亞乙烯基、1,5-亞戊-1-烯基(-CH=CH-$CH_2$-$CH_2$-$CH_2$-)、1,5-亞戊-2-烯基(-$CH_2$-CH=$CH_2$-$CH_2$-$CH_2$-)、1,5-亞戊-1,2-二烯基(-CH=CH=CH-$CH_2$-$CH_2$-)、1,5-亞戊-1,4-二烯基(-CH=$CH_2$-CH-CH=$CH_2$-)。較佳之含2至8個碳原子之亞炔基係選自由下列組成之群，其包括 1,2-亞乙炔基、1,3-亞丙炔基、1,4-亞丁-1-炔基、3-甲基-1,3-亞丙炔基、1,4-亞丁-2-炔基、亞丁-1,3-二炔基、1,3-亞異戊炔基(-C≡C-C($CH_3$)$_2$-)、1,5-亞戊-1-炔基(-C≡C-$CH_2$-$CH_2$-$CH_2$-)、1,5-亞戊-2-炔基(-$CH_2$-C≡C-$CH_2$-$CH_2$-)、1,5-亞戊-1,3-二炔基(-C≡C-C≡C-$CH_2$-)、1,5-亞戊-1,4-二炔基(-C≡C-$CH_2$-C≡C )。

關於 “脂肪烴殘基”與“脂肪烴官能基”，對於對應之殘基或官能基，本發明之術語 “經取代一或數次”，係指單次取代或數次取代，例如以至少一個選自由下列組成之群之取代基雙次取代，三次取代及四次取代一或多個彼此各自無關之氫原子，其包括氟、氯、溴、碘等原子，硝基、氨基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴

殘基羰基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、羥基(OH)、三氟甲氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、羥基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、醛基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基、一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基、醯胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基。關於經多次取代殘基及官能基之術語“經數次取代”包括於不同或相同原子上多次取代殘基或官能基，例如三次取代一相同碳原子，如三氟甲基或 2,2,2-三氟乙基之情況，或於不同位置上，如 1-羥基-4,4-二氯-丁-2-烯基之情況。如適合其取代之部位，取代基可被一次或數次取代。數次取代可藉由相同或不同取代基達成。

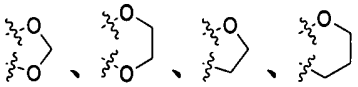
關於 “環脂肪烴殘基”與 “雜環脂肪烴殘基”，對於對應之殘基，本發明之術語 “經取代一或數次”係指單次取代或數次取代，例如以至少一個選自由下列組成之群之取代基雙次取代，三次取代及四次取代一或數個彼此各自無關之氫原子，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氨基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、側氧基、羥基、三氟甲氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基

氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、硫氫基、三氟甲硫基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、羥基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、醛基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基，一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基，一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，醯胺基，一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基。關於經多次取代之殘基及官能基，術語“經數次取代”包括於不同或相同原子上數次取代殘基或官能基，例如雙次取代一相同碳原子，如 1,1-二氟環己酯之情況，或於不同位置上，如 1-氯-3-氟環己酯之情況。如適合其取代之部位，取代基可被一次或數次取代。數次取代可藉由相同或不同取代基達成。

較佳之“脂肪烴殘基”及“脂肪烴”之取代基係選自由下列組成之群，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氨基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、三氟甲氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基-含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基(O-($C_{1-4}$-aliphatic residue)-O-$C_{1-4}$- aliphatic residue)、一羥基-含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基(O-($C_{1-4}$-aliphatic residue)-OH)、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一

含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、羧基、醯胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基。

較佳之“環脂肪烴殘基”及“雜環脂肪烴殘基”之取代基係選自由下列組成之群，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氨基、被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、側氧基、羥基、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基(S-$C_{1-4}$-aliphatic residue)、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基(S(=O)2-$C_{1-4}$-aliphatic residue)、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、醯胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基。

關於”芳香基”與”雜芳香基”，本發明之術語“經一次或數次取代”係指單次取代或數次取代，例如以至少一個選自由下列組成之群之取代基雙次取代，三次取代及四次取代一或多個彼此各自無關之氫原子於一或適當之不同原子上，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氨基、、被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、羥基、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、羥基磺醯基、一含 1 至 4 個

碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、醛基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基、一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基、苯甲基、芳香基、雜芳香基、醯胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基於一或適當之不同原子，其中如適合其取代之部位，取代基可被一次或數次取代。數次取代可藉由相同或不同取代基達成。

較佳之“芳香基”及“雜芳香基”之取代基係選自由下列組成之群，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氨基、、、、、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、羥基、三氟甲氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、羥基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基、一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基、醯胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基，一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基，芳香基，較佳為苯基或苯甲基，其等各

自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、氰基、三氟甲基、甲基、乙基、異丙基、第三丁基、羧基、乙醯基、乙基羰基($C(=O)-C_2H_5$)、甲酯及甲酸乙酯($C(=O)-O-C_2H_5$)、甲氧基($O-CH_3$)、三氟甲氧基、羥基甲氧基、甲氧基甲氧基($O-CH_2-O-CH_3$)、硫氫基、甲硫基、三氟甲硫基、硝基、氨基、二甲基胺基、甲基乙基胺基及二乙基胺基、雜芳香基，較佳為啶基、吩基、呋喃基、噻唑基或噁唑基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、氰基、三氟甲基、甲基、乙基、異丙基、第三丁基、羧基、乙醯基、丙醛、甲酯及甲酸乙酯、甲氧基、三氟甲氧基、羥基甲氧基 ($O-CH_2-OH$)、甲氧基乙氧基、硫氫基、甲硫基、三氟甲硫基、硝基、氨基、二甲基胺基、甲基乙基胺基及二乙基胺基。

根據本發明之化合物係由取代基定義，例如由 $R^1$、$R^2$ 及 $R^3$ (第一代取代基)，其等本身於需要時被取代(第二代取代物)。根據其定義，這些取代基之取代基於其位置可再被適當地取代(第三代取代基）。例如如果，$R^1$ 等於一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基 (第一代取代基)，則該含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基可於其位置被，例如一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基 (第二代取代基) 所取代。其產生一官能基 $R^1$ = (含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基 - 被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基)。該被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基可再於其位置被，例如氯原子 (第三代取代基) 所取代。總體而言，其產生一官能基 $R^1$=含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基-被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基，其中被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基被氯原子

所取代。

然而，在一較佳之具體實施例中，該第三代取代基未必會被再取代，即之後無第四代取代基。

在另一較佳實施例中，該第二代取代基未必會被再取代，即甚至連第三代取代基亦不存在。換言之，在這具體實施例中，於該通式(I)之情況下，例如，$R^1$ 至 $R^7$ 之官能基可各自適當地被取代；然而，然而其等各別之取代基本身則無法再度被取代。

在某些情況下，根據本發明之化合物係由取代基所定義，其等係或帶有一各自為未經取代或經取代一或數次之芳香基或雜芳香基，或其等和與其等連接，作為環成員或作為(諸)環成員，之(諸)碳原子或(諸)雜原子共同形成一環，例如一芳香基或雜芳香基殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次。以此構成之芳香基或雜芳香基殘基及(雜)芳香烴環系統可適合地與一環脂肪烴，較佳為一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或雜環脂肪烴殘基，較佳為一 3 至 6 員之雜環基脂肪烴殘基，或與芳香基或雜芳香基，例如一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基如環戊基，或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基如嗎啉基，或一芳香基如苯基，或一雜芳香基如吡啶基縮合，其中以此方式縮合之環脂肪烴或雜環脂殘基，芳香基或雜芳香基殘基其等本身可各自為未經取代或經取代一或數次。

在某些情況下，本發明之化合物係由諸等取代基所定義，其等係或攜帶有一各自為未經取代或經取代一或數次之環脂肪烴殘基或雜環脂肪烴殘基，或其等和與其等連接，作為環成員或作為(諸)環成員，之(諸)碳原子或(諸)雜原子共同形成一環，例如一環脂肪烴或一雜環脂肪烴環系統。以此構成之環脂肪烴或雜環脂肪烴環系統及可適合地與一芳香基，或一雜芳香基或一環脂肪烴殘基，較佳為一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基，或一雜環脂肪烴殘基，較佳為一 3

至 6 員之雜環脂肪烴殘基，例如與芳香基如苯基或雜芳香基如啶基，或一環脂肪烴如環己基，或一雜環脂肪烴殘基如嗎啉基，其中以此方式縮合之芳香基或雜芳香基殘基或環脂肪烴或雜環脂肪烴殘基於該位置上可為未經取代或經取代一或數次。

於本發明之範圍內，用於通式之符號 $-\!\!\!\!\!\!\sim$ 表示一連接對應殘基至各自上級通式之化學鍵。

假設一殘基在一分子內以複數形式存在，那麼這殘基對於不同取代基可有各自不同之意義：假設，例如 $R^2$ 及 $R^3$ 二者代表一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，則該 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，例如在 $R^2$ 可代表嗎啉基且在 $R^3$ 可代表哌口井基。

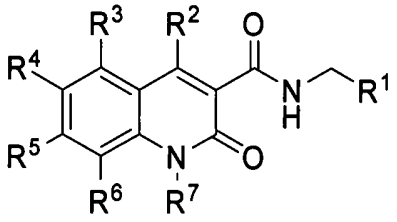
本發明之術語“生理上可接受之酸形成之鹽類”係指每種活性物質與生理學上，尤其是被使用於人類及/或其他哺乳動物身上可被接受之無機酸或有機酸所形成之鹽類。特別較佳為氯化氫。生理上可接受之酸類之例子有：鹽酸(Hydrochloric acid)、氫溴酸(Hydrobromic acid)、硫酸(Sulphuric acid)、甲磺酸(Methanesulphonic acid)、苯甲基磺酸(p-Toluenesulphonic acid)、碳酸(Carbonic acid)、蟻酸(Formic acid)、醋酸(Acetic acid)、草酸(Oxalic acid)、琥珀酸(Succinic acid)、酒石酸(Tartaric acid)、杏仁酸(Mandelic acid)、反丁烯二酸(Fumaric acid)、順丁烯二酸(Maleic acid)、乳酸(Lactic acid)、檸檬酸(Citric acid)、麩胺酸(Glutamic acid)、糖二酸(Sacchaic acid)、單甲基癸二酸(Monomethylsebacic acid)、氧脯氨酸(5-Oxoproline)、已烷-1-磺酸(Hexane-1-sulphonic acid)、菸鹼酸(Nicotinic acid)、2, 3 或 4-氨基苯酸(2, 3 or 4-Aminobenzoic acid)、2, 4, 6-三苯甲基甲酸(2, 4, 6-Trimethylbenzoic acid)、α-硫辛酸(α-Lipoic acid)、乙醯甘胺酸(Acetyl glycine)、馬尿酸(Hippuric acid)、磷酸(Phosphoric acid)、天冬胺酸(Aspartic acid)。特別較佳

為係檸檬酸及鹽酸。

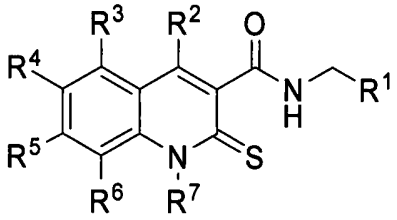
本發明之術語“生理上可接受之鹼形成之鹽類”係指每種根據本發明之化合物-作為例如當一適當之官能基被去質子時之陰離子-與至少一陽離子或鹼-較佳者與至少一無機陽離子-形成鹽類，其等為生理上可接受者-尤其是當被使用於人類或其他哺乳動物時。特別較佳為鹼金族和鹼土族金屬形成之鹽，特別是(單-)或(二)鈉，(單-)或(二)鉀，鎂或鈣形成之鹽，以及銨鹽 $[NH_xR_{4-X}]+$，其中 x=0、1、2、3或4且R代表一支鍵或直鍵之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基。

【實施方式】

根據通式(I)之化合物之較佳之具體實施例具有通式(I-I)，及/或 (I-II):



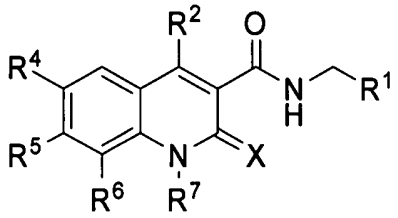
(I-I)



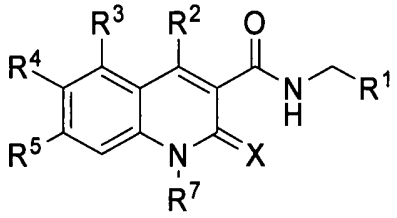
(I-II)

特別較佳之根據通式(I-I)之化合物，即根據通式(I)之化合物，其中X代表氧原子。

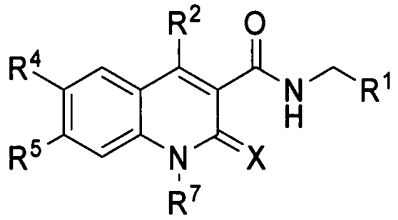
根據通式(I)之進一步較佳具體實施例具有通式(Ia)，(Ib)，(Ic)及/或(Id):



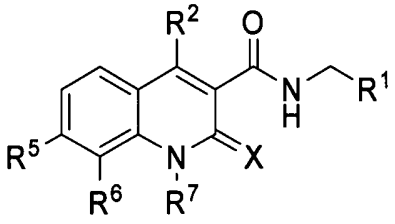
(Ia)



(Ib)



(Ic)



(Id)

本發明之另一較佳具體實施例係根據通式(I)之一化合物，其中

$R^1$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

其等各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，

其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 10 員雜

環脂肪烴殘基可各自隨意地藉由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基；

或代表一芳香基或雜芳香基，其等各自可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基、一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基、、、、、苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基，

其等各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三

氟甲氧基、三氟甲基及一未飽和之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其等各自之苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、羥基甲氧基、甲氧基乙氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，且

其等各自之含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲硫基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中之芳香基及雜芳香基可各自隨意地藉由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，其可為未經取代或以至少一個選自由

下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基)、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基及羧基；

X 代表氧或硫原子；

$R^2$ 代表氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或取代一或數次；一 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且各自隨意地藉由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或經取代一或數次，較佳代表氟、氯、溴、碘等原子，氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基及一未飽和之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，其各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自下列群組之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘、側氧基、羥基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可各自隨意地藉由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

$R^3$、$R^4$、$R^5$及$R^6$彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子，氰基；三氟甲基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；醛基；羧基；醯胺基；羥基磺醯基；硝基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基及一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基，其中各自之含 1 至 4

個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴雜基或一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，其各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且各自隨意地藉由一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，

較佳之情況為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子；

$R^7$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基及羧基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子，硝基，胺基，一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基，一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基，羥基，側氧基，一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，三氟甲氧基，硫氫基，三氟甲硫基，一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基，三氟甲基，氰基，一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，羧基，一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員之雜環脂殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員雜

環脂肪烴殘基可各自隨意地藉由一未經取代之含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連結，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基之情況下，該 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基係由一碳原子連接。

較佳之根據通式(I)之具體實施例之化合物中，殘基

$R^1$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10

員之雜環脂肪烴殘基，其各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基，及一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中各自之含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員之雜環族殘基可各自隨意地藉由一含 1 至 8 個碳原子之

脂肪烴官能基連結，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

或代表一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴雜基、一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基、、、、、苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子

之脂肪烴殘基氧基，且

其中之苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、羥基甲氧基、甲氧基乙氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，且

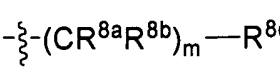
其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員雜環族殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中芳香基或雜芳香基可各自隨意地藉由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連結，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、

溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基及羧基。

根據通式(I)之化合物之另外較佳之具體實施例中，殘基

$R^1$ 代表局部結構 (T1)



(T1) ，

其中

m 代表 0、1、2、3 或 4，較佳為代表 0、1 或 2，

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基或羧基，

較佳為彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

更較佳為彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

甚至更較佳為彼此各自無關地代表氫、氟等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，且

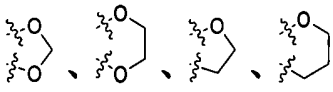
$R^{8c}$ 代表一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，較佳為當 m 不等於 0 時，其各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基，一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個

碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中各自之含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次、其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

或代表一芳香基或雜芳香基－較佳為當 m 等於 0 時，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基、一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基、、苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取

代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中各自之苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基，一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，且

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基。

較佳為，

$R^1$ 代表局部結構 **(T1)**，

其中

m　　代表 0、1 或 2，

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$　　彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

較佳為彼此各自無關地代表氫、氟等原子、一含 1 至 2 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 2 個碳原子之脂肪烴殘基，且

$R^{8c}$　　代表一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基；

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子，羥基，三氟甲氧基，三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員

之雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

或代表一芳香基或一雜芳香基－較佳之情況為當 m 等於 0，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基、一3至6員雜環脂肪烴殘基、苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基，

其中各自之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基可各自為未經取代或經取代一或數次，較佳為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基單取代或雙取代，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘

基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，較佳為至少一個選自由下列組成之群之取代基，其包含氟、氯等原子、甲基、甲氧基、三氟甲基及三氟甲氧基，

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基。

更較佳為，

$R^1$　代表局部結構 **(T1)**，

其中

m　代表 0、1 或 2，

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$　彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

較佳為彼此各自無關地代表氫、氟等原子、一含 1 至 2 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 2 個碳原子之脂肪烴殘基，且

$R^{8c}$　代表一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中各自之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含3至10個碳原子之環脂肪烴殘基或3至10員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基，及一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基，

其中各自之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一芳香基或雜芳香基－較佳為當m等於0，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基、一3至6員雜環脂肪烴殘基、苯甲基、苯基、噻吩基或吡啶基，

其中之苯甲基，苯基，噻吩基或吡啶基可各自為

未經取代或取代一或數次，較佳為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，較佳為至少一個選自由下列組成之群之取代基，其包含氟、氯等原子、甲基、甲氧基、三氟甲基及三氟甲氧基，且

其中含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基及3至6員雜環族殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及羧基。

根據通式(I)之化合物之另一較佳具體實施例中，該殘基

$R^1$　代表局部結構 (T1)，

其中

m　為0、1或2且

$R^{8a}$及 $R^{8b}$　彼此各自無關地代表氫、氟等原子，一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基；較佳為氫、氟等原子，甲基或甲氧基；

$R^{8c}$　代表一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一未經

取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

或

其中

m 為 0，

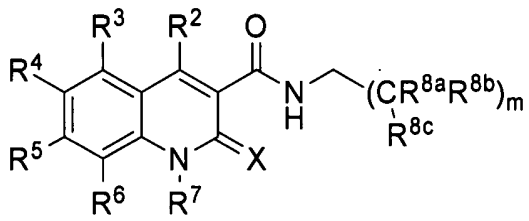
$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟等原子，一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；較佳為氫、氟等原子，甲基或甲氧基；且

$R^{8c}$ 代表一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基及苯基，

其中苯基可為未經取代或取代一或數次，較佳為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群

之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，較佳為至少一個選自由下列組成之群之取代基，其包含氟、氯等原子、甲基、甲氧基、三氟甲基及三氟甲氧基。

特別較佳之根據通式(I)之化合物具有下列之通式(Ie):



。

特別係，

$R^1$ 代表芳香基，較佳為苯基，或雜芳香基，較佳為吡啶基或噻吩基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基，及甲基，

較佳代表苯基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基及甲基，

或代表一未經取代之含1至6個碳原子之脂肪烴殘基($C_{1-6}$-aliphatic residue)。

根據通式(I)之化合物之另一較佳具體實施例中，殘基 X 代表氧原子。

根據通式(I)之化合物之另一較佳具體實施例係，殘基 X 代表硫原子。

根據通式(I)之化合物之較佳具體實施例中，殘基

$R^2$ 代表氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或取代一或數次；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或取代一或數次且各自隨意地經由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或經取代一或數次。

較佳為，

$R^2$ 代表氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員

雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

且其中含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基及3至6員之雜環脂肪烴殘基可各自隨意地藉由一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基。

更較佳為，

$R^2$ 代表氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基或一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘

等原子、羥基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

環丙基、環丁基、環戊基、環已基、咯啶烷基、哌口井基、4-甲基哌口井基、嗎啉基，或六氫啶基，較佳為環丙基、環丁基、環戊基、環已基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且其中之環丙基、環丁基、環戊基、環已基、咯啶烷基、哌口井基、4-甲基哌口井基、嗎啉基，或六氫啶基可各自隨意地藉由一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、羥基，一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基。

甚至更較佳為，

$R^2$ 代表氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；甲基；乙基；正丙基；異丙基；正丁基；第二丁基；第三丁基；甲氧基；甲乙基；甲氧基乙氧基；乙氧基羥基；甲硫基；乙硫基；環丙基，環丁基，環戊基及環已基。

仍然更較佳，

$R^2$ 係選自由下列組成之群，其包含氟、氯、溴等原子；三氟甲基；氰基；三氟甲硫基；三氟甲氧基；甲基；

乙基；正丙基；異丙基；第三丁基；環丙基；甲氧基及乙氧基(O-ethyl)。

特別係，

$R^2$ 係選自由下列組成之群，其包含氟、氯、溴等原子；三氟甲基；甲基；乙基，異丙基；環丙基；及甲氧基。

根據通式(I)之化合物之一較佳具體實施例中，殘基

$R^3$、$R^4$、$R^5$及$R^6$ 彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；醛基；羧基；醯胺基；羥基磺醯基；硝基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基及一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個

選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子，羥基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基或一3至6員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且其等各自隨意地藉由一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴官能基連接，較佳為至少 $R^3$, $R^4$, $R^5$ 及 $R^6$ 之一不等於氫原子。

較佳為，

$R^3$、 $R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；醛基；羧基；醯胺基；羥基磺醯基；硝基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基，其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟，氯，溴，碘等

原子、羥基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟，氯，溴，碘等原子、側氧基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且其等各自可隨意地藉由一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，

較佳之情況為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 之一不等於氫原子。

更較佳為，

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；醛基；硝基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數

次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且其等各自隨意地藉由一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，

較佳為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子。

於本發明之另外較佳之具體實施例中，

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包含氫、氟、氯、溴、碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子，羥基，及甲氧基；

較佳為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子。

較佳為，

$R^3$, $R^4$, $R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包含氫、氟、氯、溴、碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；甲基；乙基；正丙基；異丙基；正丁基；第二丁基；第三丁基；環丙基；甲基羰基(C(=O)-methyl)；乙基羰基(C(=O)-ethyl)；異丙基羰基((C=O)-isopropyl)；第三丁基羰基((C=O)-t-butyl)；甲氧基；乙氧基；

異丙基氧基(O-isopropyl)；第三丁基氧基(O-t-butyl)；甲氧基乙氧基(O-$(CH_2)_2$-O-$CH_3$)；甲基硫基；乙基硫基；

較佳之情況為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子。

特別係，

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包含氫、氟、氯、溴、碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；甲基羰基；乙基羰基； 異丙基羰基；第三丁基羰基；甲基；乙基；異丙基；第三丁基；甲氧基；乙氧基；氧基異丙基；氧基第三丁基；三氟甲氧基；甲硫基；乙硫基；及三氟甲硫基；

較佳之情況為至少 R3、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子。

更較佳為，

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包含氫、氟、氯、溴等原子；三氟甲基；氰基；三氟甲氧基及硝基；

較佳之情況為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子。

最佳為，

$R^3$、$R^4$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地代表氫或氟原子，較佳為各自代表氫原子；且

$R^5$ 代表氫、氟、氯、溴等原子；三氟甲基；三氟甲氧基；氰基；或硝基；較佳為代表氟、氯、溴等原子；三氟甲基；三氟甲氧基；或氰基。

根據通式(I)之化合物之特別較佳之具體實施例中，

至少殘基 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子。

根據通式(I)之化合物之另一較佳之具體實施例中，至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 之中兩個殘基代表氫原子，較佳為至少 $R^3$、$R^4$ 及 $R^6$ 之中兩個代表氫原子。

根據通式(I)之化合物之較佳具體實施例中，殘基

$R^7$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基及羧基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪

烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基，氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中各自之含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基可隨意地藉由一未經取代之含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，可為未經取

代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基之情況時，該 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

根據通式(I)之化合物之另一較佳具體實施例中，殘基

$R^7$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子，硝基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、羧基、三氟甲基、氰基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未

經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

且其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10

員雜環脂肪烴殘基可各自隨意地藉由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基，及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員之雜環脂肪烴雜基之情況時，該 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

較佳為

$R^7$ 代表一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、羧基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基，三氟甲基及一未經取代之含 1

至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

且其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基可各自隨意地藉由一未經取代之含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，較佳為含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基，氰基、或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員之雜環脂肪烴雜基之情況

時，該 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

更較佳為，

$R^7$ 代表一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為一含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基硫基、羧基、三氟甲基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為

未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基可各自連接，較佳為藉由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基、氰基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員之雜環脂肪烴雜基之情況時，該 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

甚至更為較佳，

$R^7$ 代表一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為一含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴

硫基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

且其中含3至10個碳原子之環脂肪烴殘基或3至10員之雜環脂肪烴殘基可各自連接，較佳為藉由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基，較佳為一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員之雜環脂肪烴雜基之情況

時，該 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

仍然更較佳為，

$R^7$ 代表一含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟原子、羥基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基，三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以羥基或一未經取代之含 1 至 4 個

碳原子之脂肪烴殘基氧基取代一或數次。

且其中含3至10個碳原子之環脂肪烴殘基或3至10員雜環脂肪烴殘基可各自連接，較佳為藉由一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴連接，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員之雜環脂肪烴雜基之情況時，該3至10員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

特別係，

$R^7$ 代表一含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、羧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含羥基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或

以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，假如 $R^7$ 代表一 3 至 6 員之雜環脂肪烴雜基之情況時，該 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

最佳為，

$R^7$ 代表一含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、羧基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，較佳為至少一個選自由下列組成之群之取代基，其包含羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、羧基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含羥基，及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

或代表一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，其等各自未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、

一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 6 員之雜環脂肪烴雜基之情況時，該 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

特別最佳為，

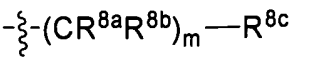
$R^7$ 係選自由下列組成之群，其包含甲基，乙基，丙基，丁基，戊基，異丙基($CH(CH_3)_2$)、異戊基($C_2H_4$-$CH(CH3)_2$)、異己基($C_3H_6$-$CH(CH_3)_2$)、甲醇基($CH_2OH$)、乙醇基($C_2H_4OH$)、甲氧基甲基($CH_2$-$OCH_3$)、甲氧基乙基($C_2H_4$-$OCH_3$)、甲氧基丙基($C_3H_6$-$OCH_3$)、甲基乙基醚基($CH_2$-O-$C_2H_5$)、乙醚基($C_2H_4$-O-$C_2H_5$)、2-甲氧基丙基($CH_2$-$CH(CH_3)(OCH_3)$)、2-甲氧基丁基($CH_2$-$CH(C_2H_5)(OCH_3)$)、2-甲氧基-異丙基($CH(CH_3)(CH_2$-$OCH_3)$)、1,5-二甲氧基-第三戊基($CH(C_2H_4$-$OCH_3)_2$)、1-甲氧基-第二丁基($CH(C_2H_5)(CH_2$-$OCH_3)$)、甲基乙氧基乙氧基($C_2H_4$-O-$C_2H_4$-O-$CH_3$)、甲基乙氧基甲基($CH_2$-O-$C_2H_4$-O-$CH_3$)、乙醇基乙基醚基($C_2H_4$-O-$C_2H_4$-OH)、甲基-乙醇基醚基($CH_2$-O-$C_2H_4$-OH)、乙酸乙酯($CH_2$-C(=O)O-$CH_3$)、丙酸乙酯($C_2H_4$-C(=O)$OCH_3$)、丁烯酸($C_2H_4$-C(=O)OH)、2-丙烯酸($CH_2$-C(=O)OH)；

或代表一未經取代之含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴

殘基或一未經取代之 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基，較佳為四氫吡喃基或六氫啶基。

另一特別較佳之根據通式(I)之之化合物，

其中 $R^1$ 代表局部結構 **(T1)**，



**(T1)** ，

其中 m 為 0、1 或 2 且

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；較佳為氫、氟等原子、甲基或甲氧基；

$R^{8c}$ 代表一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基、及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

或

其中

m 為 0，

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟等原子，一含 1 至 4 個

碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；較佳為氫、氟等原子、甲基或甲氧基；且

$R^{8c}$ 代表一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基及苯基，

其中苯基可為未經取代或經取代一至數次，較佳為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基，較佳為至少一個為選自由下列組成之群之取代基，其包含氟、氯等原子、甲基、甲氧基、三氟甲基及三氟甲氧基，

X 代表氧或硫原子，較佳為氧原子；

$R^2$ 係選自由下列組成之群，其包含氟、氯、溴等原子；三氟甲基；甲基；乙基，異丙基；環丙基；及甲氧基；

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 係彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包含氫、氟、氯、溴等原子；三氟甲基；氰基；三氟

甲氧基及硝基；

較佳之情況為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子，

$R^7$ 代表一含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，較佳為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含羥基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

或代表一未經取代之含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一未經取代之 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 6 員之雜環脂肪烴雜基之情況時，該 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

根據通式(I)之化合物另一特別較佳之具體實施例，其中

$R^1$ 代表一芳香基，較佳為苯基，或雜芳香基，較佳為吡啶基或噻吩基，其等各自為未經取代或以至少一

個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基及甲基，

較佳為代表苯基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基及甲基，

X　係氧原子；

$R^2$　係選自由下列組成之群，其包含氟、氯等原子、三氟甲基、甲基、乙基、異丙基、環丙基及甲氧基；較佳為選自由下列組成之群，其包含甲基、乙基、甲氧基及三氟甲基；

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$　係彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包含氫、氟、氯、溴等原子、三氟甲基、氰基、三氟甲氧基及硝基；

較佳之情況為至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 其中之一不等於氫原子，更較佳之情況為 $R^5$ 不等於氫原子；

$R^7$　代表一含 1 至 6 各碳原子之飽和脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、甲氧基、乙氧基、三氟甲氧基、甲氧基乙氧基、羧基、甲氧基羰基($C(=O)-O-CH_3$)、三氟甲硫基及三氟甲基，

較佳為代表一飽和之含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或二次，其包含羥基、甲氧基、乙氧

基、三氟甲氧基、甲氧基乙氧基、羧基及甲氧基羰基。

尤其特別較佳之根據通式(I)之化合物是選自下列之群，其包括:

1 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

2 1-丁基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

3 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

4 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

5 1-乙基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

6 N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

7 N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

8 1-乙基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

9 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

10 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

11 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-丙基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

12 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-1-(3-甲基-丁基)-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

13 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-1-(4-甲基-戊基)-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

14 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(3-甲氧基-丙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

15 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[2-(2-甲氧基-乙氧基)-乙基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

16 7-溴-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

17 7-溴-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

18 7-溴-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

19 7-溴-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

20 7-氰-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

21 7-氰-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

22 7-氰-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

23 7-氰-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

24 N-(4,4-二甲基-戊基)-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

25 N-(4,4-二甲基-戊基)-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

26 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-乙酸甲基酯；

27 3-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-丙酸甲基酯；

28 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-乙酸；

29 3-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-丙酸；

30 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[1-(甲氧基甲基)-丙基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

31 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[2-甲氧基-1-(甲氧基甲基)-乙基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

32 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-丁基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

33 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲氧基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

34 7-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

35 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-1-甲基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

36 N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

37 7-氯基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

38 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-羥基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

39 1-(2-乙氧基-乙基)-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

40 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-異丙基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

41 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-戊基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

42 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-甲基-2-氧基-4-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

43 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-丙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

44 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-四氫-吡喃-4-基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；及

45 N-[(3-氟苯基)- 甲基]-4-甲氧基-1-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

各自其形式為游離化合物；消旋酯；對映異構物，非對映異構物，對映異構物或以任何比例混合之非對映異構物或獨立對映異構物或非對映異構物之混合物；或生理可接受之酸或鹼形成之鹽類之形式；或溶劑化物之形式，特別係水合物。

根據先前說明之通式(I)之發明之取代化合物，及相應之立體異構物以及其對應之鹽類及溶劑化物在毒性上係安全的，因此適合作為藥物組合物中的藥物有效成分。

本發明係另外有關包含根據通式(I)之至少一種化合物之一藥物組合物，其等各自如適合，可以其一種純立體異構物之形式，特別係對映異構物或非對映異構物，其消旋物或以立體異構物之

混合物之形式，特別係對映異構物及/或非對映異構物，以任何期望之混合比率，或各自以生理上可接受之鹽類，或各自以對應溶劑化物之形式，以及任意至少一種藥學上可接受之輔助及/或任意至少另外一有效成份。

此外，1-乙基-N-(4-甲氧基苄基-4-甲基-2-氧基-1,2-二氫喹啉-3-羧醯胺，以及其各自對應之鹽類及溶劑化物在毒性上係安全的，因此適合作為藥物組合物中的藥物有效成分。

因此本發明係有關另外一種包含 1-乙基-N-(4-甲氧基苄基)4-甲基-2-氧基-1,2-二氫喹啉, 3-羧醯胺之藥學組成物，如需要,以生理上可接受之鹽類之形式，或其各自對應之溶劑化物之形式，以及任意至少一種藥學上可接受之輔助及/或任意至少一另外有效成份。

根據本發明之藥物組成份特別適合作為 KCNQ2/3 鉀離子通道調節劑，較佳為 KCNQ2/3 鉀離子通道之抑制及/或 KCNQ2/3 鉀離子通道之刺激，即其發揮促效或拮抗作用。

同樣地，根據本發明之藥物組成份係特別係適合預防及/或治療至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之失調及/或疾病。

根據本發明之藥物組合物係適合施予成人及兒童，包括學齡前兒童及嬰兒。

根據本發明之藥物組成物可配製成液體、半固體或固體藥劑型，例如以注射式液體、滴劑、汁、糖漿、噴劑、懸液劑、錠劑、貼劑、囊劑、敷貼劑、栓劑、軟膏劑、乳脂、洗滌劑、凝膠劑、乳劑、噴霧劑或以複粒形式，例如以小丸劑或顆粒之形式，如需要,可適當地壓製成錠劑，倒出至囊劑或懸浮於一液體，並且施予同樣之份量。

除了根據通式(I)之至少一取代化合物，如需要,可於每一情況

中以其純立體異構物之形式，特別係對映異構物或非對映異構物，其消旋物或以立體異構物之混合物之形式，特別係對映異構物或非對映異構物，以任何期望之混合比率，或如需要,可適當地以對應之鹽類，或各自以對應之溶劑化物之形式，根據本發明之藥學化合物依慣例可包含另外之生理上可接受之藥學輔助劑，例如，可選自由下列組成之群，其包括賦形劑、填充劑、溶劑、稀釋劑、界面活性物質、染料、防腐劑、爆破劑、助滑添加劑、潤滑劑、香氣成份及黏合劑。

生理上可接受之輔助劑以及其欲使用之份量之選擇取決於該藥物化合物是以口服、皮下、腸外、靜脈、腹腔、皮內、肌肉內、鼻內、頰內、直腸內，或局部應用，例如皮膚，黏膜及眼睛之感染。以錠劑、糖衣錠、囊劑、顆粒、小丸劑、滴劑、汁及糖漿之形式係特別適合口服應用；液體、懸液劑、容易重新構成之乾燥製劑以及噴霧劑係較適合作為注射、局部及吸入式應用。根據使用於藥物組成物於容器內之發明，該取代化合物以溶解形式或於敷貼劑內，以及適合添加促進皮膚滲透之物質，如需要，係適合經皮應用之配製。口服或經皮應用之配製之形式也可延後釋放根據本發明之各自取代化合物。

根據本發明之藥物組成物可藉由已知技藝之常規手段，器具，方法及過程，如 “雷明頓之藥學科學”, A.R. 簡那羅 (主編)，第 17 版，魅克出版公司，依斯頓市，賓州，1985 [*Remington’s Pharmaceutical Sciences “, A.R. Gennaro (Editor), 17th edition, Mack Publishing Company, Easton, Pa, 1985*] 特別係章節 76 至 93 中之第 8 部份,所敘述之範例之輔助而調製。對應之說明係藉著參考及形式部份揭露取得。根據本發明上述通式(I)之諸取代化合物施與病人之份量可變更且取決於如病人體重或年紀以及應用之形

式，指示及病症之嚴重度。依常規， 0.001 至 100 毫克/公斤，較佳為 0.05 至 75 毫克/公斤，特別較佳為 0.05 至 50 毫克之至少一種根據本發明之化合物/公斤病人體重。

根據本發明之藥物組成物較佳適合用於治療及/或預防選自疼痛組成之群中一或多種疾病及/或病症，特別係由急性疼痛、慢性疼痛、神經性疼痛、肌肉性疼痛、內臟性疼痛及發炎性疼痛、癲癇、小便失禁、焦慮症、成癮症、躁鬱症、雙極性異常、偏頭痛、認知疾病及肌張力障礙相關之運動異常所組成之群之疼痛。

根據本發明之藥物組成物係特別較佳適合於疼痛之治療，更特別較佳適合於急性疼痛、慢性疼痛、神經性疼痛、內臟性疼痛、發炎性疼痛及肌肉性疼痛，且最為適合於神經性疼痛之治療。

本發明之藥物組成物也較佳適合於癲癇之治療及/或預防。

本發明因此係另外有關根據通式(I)之至少一種化合物，以及如需要，一或多種藥學可接受之輔助劑以用於 KCNQ2/3 鉀離子通道之調節，較佳用於 KCNQ2/3 鉀離子通道之抑制及/或刺激。

因此本發明係另外有關根據通式(I)之至少一化合物，以及適合地一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為預防及/或治療至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之異常及/或疾病。

本發明係另外有關 1-乙基-N-(4-甲氧基苄基)-4-甲基-2-氧基-1,2-二氫喹啉-3-羧醯胺，以及如需要，一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為 KCNQ2/3 鉀離子通道之調節，較佳用於 KCNQ2/3 鉀離子通道之抑制及/或刺激。

本發明係另外有關 1-乙基-N-(4-甲氧基苄基)-4-甲基-2-氧基-1,2-二氫喹啉-3-羧醯胺，以及任意一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為預防及/或治療至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之異常及/或疾病。

優先選擇根據通式(I)之至少一化合物，及任意一或多種藥物上可接受之輔助劑以用於治療及/或預防選自疼痛組成之群中一或多種失調及/或疾病，特別係選自由急性疼痛，慢性疼痛，神經性疼痛，肌肉性疼痛，內臟性疼痛及發炎性疼痛，癲癇，小便失禁，焦慮症，成癮症，躁鬱症，雙極性異常，偏頭痛，認知疾病及肌張力障礙相關之運動異常所組成之群之疼痛。

也優先選擇 1-乙基-N-(4-甲氧基苄基)-4-甲基-2-氧基-1, 2-二氫喹啉-3-羧醯胺，以及任意一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為治療及/或預防選自疼痛組成之群中一或多種疾病及/或病症，特別係選自由急性疼痛，慢性疼痛，神經性疼痛，肌肉性疼痛，內臟性疼痛及發炎性疼痛，癲癇，小便失禁，焦慮症，成癮症，躁鬱症，雙極性異常，偏頭痛，認知疾病及肌張力障礙相關之運動異常所組成之群之疼痛。

特別優先選擇根據通式(I)之至少一化合物及隨意地一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為治療及/或預防選自疼痛組成之群中一或多種疾病及/或病症，特別係選自由急性疼痛、慢性疼痛、神經性疼痛、肌肉性疼痛、內臟性疼痛及發炎性疼痛所組成之群組之疼痛，最特別係神經性疼痛。

特別優先選擇也給予根據通式(I)之至少一化合物及隨意地一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為癲癇之預防及/或治療。

本發明因此係有關另外根據通式(I)之至少一化合物及如需要，隨意地一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為 KCNQ2/3 鉀離子通道之調節，較佳用於 KCNQ2/3 鉀離子通道之抑制及/或刺激。

本發明因此係另外有關根據通式(I)之至少一化合物及，如需要，隨意地一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為預防及/或治療至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之異常及/或疾病。

優先選擇根據通式(I)之至少一化合物及任意一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為預防及/或治療選自疼痛組成之群中一或多種疾病及/或失調，特別係選自由急性疼痛、慢性疼痛、神經性疼痛、肌肉性疼痛、內臟性疼痛及發炎性疼痛、癲癇、小便失禁、焦慮症、成癮症、躁鬱症、雙極性異常、偏頭痛、認知疾病及肌張力障礙相關之運動異常所組成之群之疼痛。

特別優先選擇根據通式(I)之至少一化合物及任意一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為預防及/或治療疾病及/或失調，特別係選自由急性疼痛，慢性疼痛，神經性疼痛，肌肉性疼痛，內臟性疼痛及發炎性疼痛所組成之群組之疼痛，最尤其係神經性疼痛。

特別優先選擇也給予根據通式(I)之至少一化合物及任意一或多種藥學上可接受之輔助劑以作為癲癇之預防及/或治療。

本發明之另一觀點係一治療及/或預防在一哺乳類上至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之失調及/或疾病之方法，由施予一有效份量之根據通式(I)之至少一化合物至一哺乳類上，較佳為疼痛組成之群中之疾病及/或失調，較佳為選自由急性疼痛、慢性疼痛、神經性疼痛、肌肉性疼痛、內臟性疼痛及發炎性疼痛、癲癇、小便失禁、焦慮症、成癮症、躁鬱症、雙極性異常、偏頭痛、認知疾病及肌張力障礙相關之運動異常所組成之群組之疼痛。

對疼痛之有效性可由，如班內特 (Bennett) 或鍾 (Chung) 模型 (班內特及謝[Bennett, G.J. and Xie, Y.K.]，有如在人類上觀察到之由大鼠之神經病變所產生之痛覺病症，疼痛期刊 1988, 33(1), 87-107; 金及鍾等人，在大鼠上由脊椎節式脊神經結紮手術(疼痛期刊 1992, 50(3), 355-363)所產生之末梢神經病變之實驗模型,) [*Bennett, G.J. and Xie, Y.K., A peripheral mononeuropathy in rat that produces disorders of pain sensation like those seen in man, Pain*

*1988, 33(1), 87-107; Kim, S.H. and Chung, J.M., An experimental model for peripheral neuropathy produced by segmental spinal nerve ligation in the rat, Pain 1992, 50(3), 355-363*]，甩尾試驗(例如，根據迪阿瑪及史密斯 (藥學實驗理論期刊，72, 74 79 (1941))[ *e.g. according to D'Amour und Smith (J. Pharm. Exp. Ther. 72, 74 79 (1941))*或福馬林試驗(例如，根據 D. 杜布森等人,疼痛期刊 1977, 4, 161-174)[*e.g. according to D. Dubuisson et al., Pain 1977, 4, 161-174*] 中顯示出來。對癲癇之有效性可由，如 DBA/2 小鼠模型 (地沙羅業特等人, Naunyn Schmiedebergs 藥理檔案期刊. 2001, 363, 330-336) [*De Sarro et al., Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol. 2001, 363, 330-336*] 所顯示。

根據本發明之化合物較佳為具有半效應濃度($EC_{50}$)不超過 10000 毫微莫耳濃度或不超過 8000 毫微莫耳濃度，更較佳為不超過 7000 毫微莫耳濃度或不超過 6000 毫微莫耳濃度，然而更較佳為不超過 5000 毫微莫耳濃度或不超過 3000 毫微莫耳濃度，甚至更較佳為不超過 2000 毫微莫耳濃度或不超過 1000 毫微莫耳濃度，然而甚至更較佳為不超過 800 毫微莫耳濃度或不超過 700 毫微莫耳濃度，依然更較佳為不超過 600 毫微莫耳濃度或不超過 500 毫微莫耳濃度，然而還更較佳為不超過 400 毫微莫耳濃度或不超過 300 毫微莫耳濃度，最較佳為不超過 200 毫微莫耳濃度或不超過 150 毫微莫耳濃度且特別係不超過 120 毫微莫耳濃度或不超過 100 毫微莫耳濃度。決定半效應濃度之方法係該技術領域中具有通常知識者所熟知。半效應濃度較佳以螢光檢測法決定，特別較佳以在藥理學實驗(**"Pharmacological Experiments"**)中描述之方法所決定。

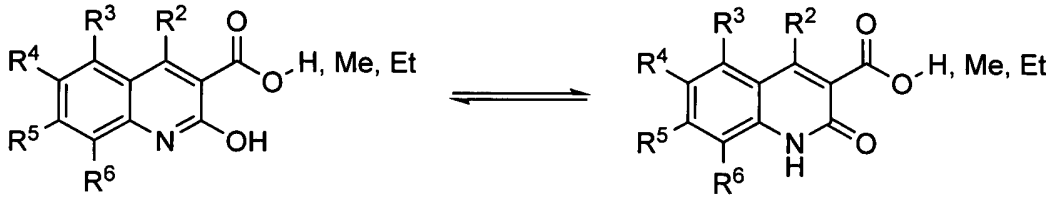
本發明另外提供根據該發明之取代化合物之調製過程。

使用於下列所述反應及計畫之化學物及反應成份可在市面上取得或各自以該技術領域中具有通常知識者所熟知之常規方法調製。

所敘述之反應可以各自以在該技術領域中具有通常知識者所熟知之常規方法完成，例如壓力或成份之加入順序。假如需要，該技術領域中具有通常知識者可以簡易初步之測試於各自情況下決定最佳步驟。如需要，描述於上文中之反應所得之過渡及最後產物可利用該技術領域中具有通常知識者所熟知之常規方法各自純化及/或隔離。適當之純化過程係如萃取過程及色層分析法過程或製備級色層分析法。所有下述之過程步驟以及各自之純化及/或隔離之過渡或最後產物之過程，可在一部份或完全之惰性氣體環境下完成，較佳係於一氮氣環境下。

假如根據前面提及之通式(I)發明之取代化合物係於調製之後，以其立體異構物之混合物形式所取得，較佳以其消旋物之形式或其多種對映異構物及/或非對映異構物之其它混合物之形式，如需要，其可利用該技術領域中具有通常知識者所熟知之常規方法分離及隔離。範例包括管柱色層分析法分離程序，特別係在正常壓力或在提升壓力下之液相層析法程序，較佳係中效能液相層析法(MPLC)及高效能液相層析法(HPLC)程序，以及分段結晶程序。這些程序允許所得之獨立對映異構物，如非對映異構物之鹽類，以對掌固定相高效能液相層析法或利用對掌性酸類結晶化，如右旋光性酒石酸，左旋光性酒石酸或右旋光性-10-梓腦磺酸，得以各自分離。

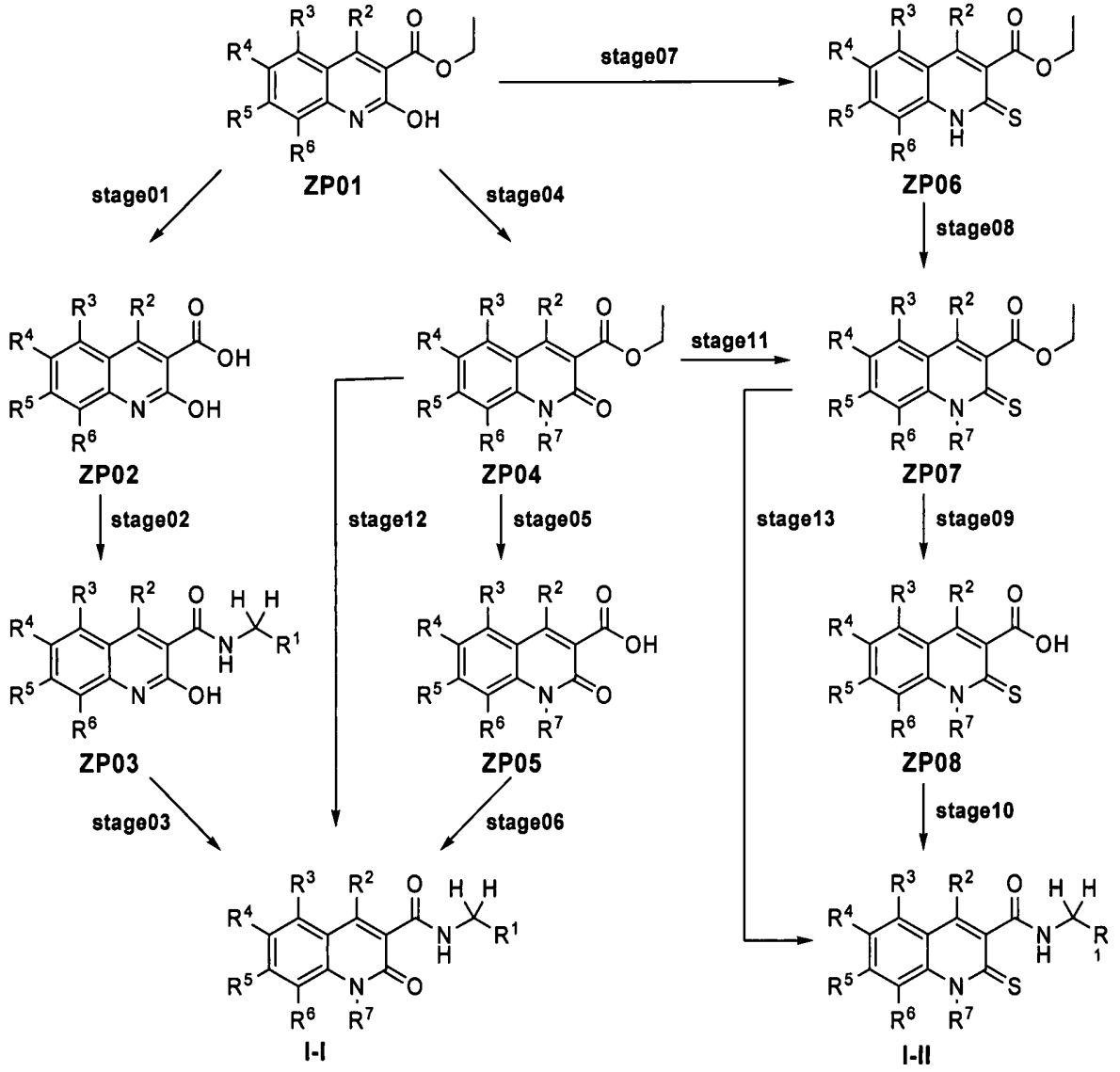
通則性之反應合成流程圖 I (先驅物 P1 及其互變異構形 P2 之合成):




**P1** **P2**

通式 P1 或其互變異構形 P2 之各自多重性合成及合成路徑及殘基 $R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、及 $R^6$ 之廣汎取代模式可從目前之專業文獻中得知。在殘基 $R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 上具有相似取代模式之通式 P1 或其互變異構形 P2，如下述所示且其合成未有更詳細之敘述，可根據這些已知方法或已知方法之結合被該技術領域中具有通常知識者製造調配。

通則性之反應合成流程圖 II：




在步驟 **stage01**，**stage05** 及 **stage09** 中，根據該技術領域中具有通常知識者所熟知之方法，通式 **ZP01**，**ZP04** 及 **ZP07** 之酯類可轉化成通式 **ZP02**，**ZP05** 及 **ZP08** 之酸類，例如利用一鹼類，如氫氧化鋰。

在步驟 **stage03**，**stage04** 及 **stage08** 中，根據該技術領域中具有通常知識者所熟知之方法，例如加入一鹼類，如碳酸鉀(Potassium carbonate)或氫化鈉(Sodium hydride)，通式 **ZP03** 及 **ZP01** 之喹諾酮，及通式 **ZP06** 之硫代喹諾酮可利用通式 $R^7$-$X^1$ 之化合物，各自轉化成通式(**I-I**)及 **ZP04** 之喹諾酮，及通式 **ZP07** 之

硫代喹諾酮，其中 $X^1$ 代表一離去基團，如氯、溴、碘等原子，甲烷磺酸鹽 (Methane sulphonate) 或對甲磺酸鹽 (p-Toluene sulphonate)。

在步驟 **stage02**，**stage06** 及 **stage10** 中，根據該技術領域中具有通常知識者所熟知之方法，例如利用一適合之偶合試劑，如 HATU(O-(-7-氮雜-苯並三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸鹽)，藉由通式 $R^1$-$CH_2$-$NH_2$ 之胺類，通式 **ZP02**，**ZP05** 及 **ZP08** 之酸類可各自轉化成通式 **ZP03**，**(I-I)**及**(I-II)**之醯胺。

在步驟 **stage07** 及 **stage11** 中，根據該技術領域中具有通常知識者所熟知之方法，例如利用一硫化試劑，如勞森試劑或五硫化二磷(Phosphorus pentasulfide)，通式 **ZP01** 及 **ZP04** 之喹諾酮可各自轉化成 **ZP06** 及 **ZP07** 之通式硫代喹諾酮。

在步驟 **stage12** 及 **stage 13** 中，藉由通式 $R^1$-$CH_2$-$NH_2$ 之胺類，根據該技術領域中具有通常知識者所熟知之方法，例如加入三甲基鋁(Trimethylaluminium)，通式 **ZP04** 或 **ZP07** 之酯類可各自轉化而產生通式 **I-I** 或 **I-II** 之醯胺。

因此藉由該技術領域中具有通常知識者所熟知之簡易衍生化反應，例如酯化，酯形成，醯胺形成，醚化，醚裂解，替代或交叉偶聯反應，通式**(I-I)**及**(I-II)**所得之化合物可進一步轉化以添加或交換一或多個替代基 $R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$ 及 $R^7$。

以下將藉由一些例子敘述該發明。該敘述僅係意指範例而不限於該發明之整體觀念。

**範例**

指示法係 “當量” (equivalents)( “eq” )意指莫耳濃度當量，“RT” 意指室溫(room temperature) (23 ± 7 度° C，“M” 係代表以莫耳/公升之濃度指示，“aq.” 意指水性，“sat.” 意指飽和，“sol.” 意指溶液，“conc.” 意指濃縮(的)。

另外之縮寫:

| | |
|---|---|
| AcOH | 乙酸 (acetic acid) |
| d | 天數(days) |
| brine | 飽和水性氯化鈉溶液(NaCl sol.) |
| CC | 矽膠管柱色層分析法(Column chromatography on silica gel) |
| dba | 雙亞苄基丙酮 (Dibenzylidene acetone) |
| DCM | 二氯甲烷 (Dichloromethane) |
| DIPEA | N,N-二異丙基乙胺 (N,N-diisopropylethylamine) |
| DMF | N,N-二甲基甲醯胺 (N,N-dimethylformamide) |
| DMSO | 二甲亞碸 (Dimethyl sulfoxide) |
| EtOAc | 乙酸乙酯(Ethyl acetate) |
| EtOH | 乙醇(Ethanol) |
| h | 小時 (hour(s)) |
| HATU | O-(-7-氮雜-苯並三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸鹽<br>O-(7-aza-benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluroniumhexafluorophosphate |
| m/z | 質量與電荷比(mass-to-charge ratio) |
| MeOH | 甲醇(Methanol) |

| | |
|---|---|
| MeCN | 乙睛(Acetonitrile) |
| min | 分鐘(minutes) |
| MS | 質量光譜測量 (Mass spectrometry) |
| MW | 微波(Microwave) |
| NEt3 | 三乙胺(Triethylamine) |
| RTG | 促效劑 Retigabine |
| RS | 反應溶液(Reaction solution) |
| THF | 四氫呋喃(Tetrahydrofuran) |
| TMEDA | N,N,N',N'-四甲基乙二胺 (N,N,N',N'-tetramethylethylendiamine) |
| v/v | 體積比 (volume to volume) |
| w/v | 每容量單位之重量 (weight per volume) |
| Xantphos | 4,5-雙二苯基膦-9,9-二甲基氧雜蒽 (4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene) |

調製之化合物之產量係未最佳化。

所有之溫度係未校正。

所有未清楚說明之起始材料係可在市面上取得 (供應商之資料如 Acros,Avocado,Aldrich,Bachem,Fluka,Lancaster,Maybridge，Merck,Sigma,TCI, Oakwood 等可各自由美國 Sam Ramon 之 MDL 公司之 Symyx®之可取得化學藥品之資料庫或美國華盛頓首府 ACS 之 SciFinder®資料庫中查詢)或其合成係已被正確地記載於專業文獻(實驗步驟可於荷蘭阿姆斯特丹之 Elsevier 之 Reaxys®資料庫或美國華盛頓首府 ACS 之 SciFinder®資料庫中取得)或可被該技術領域中具有通常知識者所熟知之常規方法所調製。

被使用作為管柱色層分析法之固定相為德國莫克公司(E.

Merck, Darmstadt) 之矽膠 60 (0.0-0 - 0.063 毫米)。

管柱色層分析法之溶劑或溶析液之混合比例係以體積比詳細指明。

所有過渡產物及範例化合物係利用 $^{1}$H-NMR 光譜測量法進行分析鑑定。此外還針對所有範例化合物及特別選定之過渡產物進行質量光譜測量試驗(MS, m/z for $[M+H]^{+}$)。

**範例化合物之合成**

**範例化合物 1 之合成:** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺

a) 乙基 4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽之合成

利用冰/水槽冷卻一由 40.6 克 (0.2 莫耳) 1-(2-氨基-4-(三氟甲基)苯基)乙酮及以溶於二氯甲烷 (130 毫升)之 41.6 克(0.3 莫耳)三乙胺所調製之溶液。將溶於二氯甲烷 (65 毫升)之 38 毫升 (0.3 毫莫耳)乙基 3-氯-3-氧基丙酮酸逐滴地以超過 30 分鐘時間，不超過 15° C 之溫度加入，之後在室溫下攪拌 2 小時。之後加入 1 體積莫耳濃度之水性碳酸氫鈉溶液(400 毫升)以抑制該反應溶液，分離出其有機相，在硫酸鎂下乾燥，並於真空中濃縮。將取得之殘餘物溶解於乙醇(350 毫升)，加入 82 毫升之乙醇鈉(0.2 莫耳, 21% 每容量單位之重量於乙醇)，之後於室溫下攪拌 72 小時。利用 5 體積莫耳濃度之乙酸使該反應溶液酸化且於真空下加以濃縮。將該取得之殘餘物懸浮於 250 毫升之水及 250 毫升之乙酸乙酯，將其沉澱物濾除。在真空下於 40° C 乾燥之後，取得 42.8 克(0.14 莫耳，72%)之乙基 4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽，其之後不經進一步純化而直接用於下一步驟。

b) 4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸之合成

將一 2 體積莫耳濃度之氫氧化鋰溶液(125 毫升)加入至溶於甲醇/四氫呋喃混合物 (各 175 毫升)之 15.0 克(50.1 毫莫耳)乙基 4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1 氫-喹啉-3-羧酸鹽調製而成之溶液，將該反應溶液於 60°C 加熱 16 小時。將該混合物於真空下加以濃縮。將其殘餘物以水調製並以 2 體積莫耳濃度之鹽酸將其酸鹼值調至 pH 2，之後以乙酸乙酯萃取。分離出其有機相並以飽和水性氯化鈉溶液洗滌，以硫酸鎂乾燥並於真空下加以濃縮。其取得之殘餘物係 12.0 克 (44.2 毫莫耳, 88%)之 4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸，其不經進一步純化而直接用於下一步驟。

c) N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺之合成

將 926 毫克 (7.4 毫莫耳) 3-氟苯甲胺，2.55 克 (6.7 莫耳) O-(-7-氮雜-苯並三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸鹽及 2.7 毫升 (19.5 毫莫耳) 三乙胺加至溶於四氫呋喃(50 毫升)之 1.82 克(6.7 毫莫耳)4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸溶液。在 50°C 下攪拌該反應溶液 16 小時，之後在室溫下以乙酸乙酯(50 毫升)稀釋。篩除其產生之沉澱物並於真空下乾燥取得 2.10 克 (5.6 毫莫耳, 83%)之 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺，其不經進一步純化而直接用於下一步驟。

d) N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺之合成

將 200 毫克(1.5 毫莫耳)之碳酸鉀加入溶於(16 毫升)二甲亞碸之 500 毫克(1.3 毫莫耳) 之 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺，之後於室溫攪拌 1 小時。將 90 微升(1.5 毫莫耳)之碘甲烷加至該反應溶液並於 50 °C 下攪拌 16 小

時。在冷卻至室溫後，以水(10 毫升)及(30 毫升)之乙酸乙酯稀釋該反應溶液。分離出其有機相並以飽和水性氯化鈉溶液洗滌，以硫酸鎂乾燥並於真空中濃縮。以酒精處理殘餘物而取得結晶之後，得到 327 毫克(0.8 毫莫耳，63%)之 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 (**範例化合物 1**)。其質量光譜 m/z 393.1 [M+H]+。

**範例化合物 2 之合成:** 1-丁基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺

a) 乙基 1-丁基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽之合成

將 461 毫克 (3.3 毫莫耳)碳酸鉀及 360 微升(3.3 毫莫耳)1-溴丁烷於室溫下加至溶於二甲亞碸(9 毫升)之 1.0 克(3.3 毫莫耳) 4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽 (其合成見範例化合物 1, 段落 a)，之後於 50°C 加熱 90 分鐘。在冷卻至室溫之後，以水(30 毫升)稀釋該反應溶液，且以乙酸乙酯 (3x50 毫升)萃取。以水及飽和水性氯化鈉溶液洗滌合併之有機相，以硫酸鈉去除該水份，並於真空下加以濃縮。於矽膠管柱色層分析法(乙酸乙酯/己烷 1:8)分離殘餘物之後，取得 480 毫克(1.4 毫莫耳，40%)乙基 1-丁基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽。

b) 1-丁基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸之合成

將一溶於水(10 毫升)之 160 毫克(4.0 毫莫耳)之溶液於室溫下加入至溶於乙醇(10 毫升)之 355 毫克(1.0 毫莫耳) 乙基 1-丁基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽溶液。於 80°C 下加熱該混合物 16 小時，之後大部份乙醇於真空下被移除。以水(20 毫升)稀釋其殘餘物，之後以 1 體積莫耳濃度之氫氯酸酸化。之後以乙

酸乙酯萃取該混合物(3 x 30 毫升)。以水及飽和水性氯化鈉溶液洗滌合併之有機相，以硫酸鈉去除水份，並於真空下加以濃縮。其產生之殘餘物係 250 毫克(0.8 毫莫耳，76%) 1-丁基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸，不經進一步純化而直接用於下一步驟。

c) 1-丁基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺之合成

於室溫下將 349 毫克(0.9 毫莫耳)O-(-7-氮雜-苯並三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸鹽，550 微升(3.1 毫莫耳)N,N-二異丙基乙胺及 90 微升(0.8 毫莫耳) 3-氟苯甲胺加至溶於 N,N-二甲基甲醯胺(3 毫升)之 250 毫克(0.8 毫莫耳)1-丁基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸，之後持續攪拌 3 小時。以水(20 毫升)稀釋該反應溶液，並以乙酸乙酯萃取該混合物 (3 x 30 毫升)。以水及飽和水性氯化鈉溶液洗滌合併之有機相，以硫酸鈉去除水份，並於真空下加以濃縮。於矽膠管柱色層分析法(乙酸乙酯/己烷 1:4)分離殘餘物之後，取得 180 毫克(0.4 毫莫耳，54%) 1-丁基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺(**範例化合物 2**)。其質量光譜 m/z435.2$[M+H]^+$。

**範例化合物 3 之合成:** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺之合成

a) 乙基 1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽之合成

乙基 4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽(其合成請見於範例化合物 1 之段落 a)及碘甲烷之轉化成乙基 1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽係根據範例化合物 2 之段

落 a 所敘述之方法所完成。

b) 乙基 1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽之合成

將 2.4g (5.9 毫莫耳)勞森試劑(Lawesson's reagent)於室溫下加至溶於甲苯(10 毫升)之 460 毫克(1.5 毫莫耳) 乙基 1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽溶液，之後於 120°C 加熱 16 小時。冷卻至室溫後，加入飽和水性碳酸鈉溶液(30 毫升)以抑制該反應溶液。之後以乙酸乙酯萃取該混合物 (3 x 30 毫升)。以飽和水性氯化鈉溶液洗滌合併之有機相，以硫酸鈉去除水份，並於真空下加以濃縮。於矽膠管柱色層分析法(乙酸乙酯/己烷 1:4)分離殘餘物之後，取得 400 毫克(1.2 毫莫耳，82%)乙基 1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽。

c) 1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸之合成

於室溫下將 40% w/v 水性氫溴酸(15 毫升)加至溶於乙酸(10 毫升)之 270 毫升(0.8 莫耳)1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸鹽，之後於 80°C 加熱 4 小時。加入另外之 40% w/v 水性氫溴酸 (15 毫升)，之後持續於 80°C 加熱 16 小時。之後大部份乙醇於真空下被移除，並以水(20 毫升)稀釋殘餘物。以乙酸乙酯萃取該混合物 (3 x 40 毫升)。以飽和水性氯化鈉溶液洗滌合併之有機相，以硫酸鈉去除水份，並於真空下加以濃縮。其產生之殘餘物係 210 毫克(0.7 毫莫耳，85%) 1, 4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸，不經進一步純化而直接用於下一步驟。

d) N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺之合成

利用根據範例化合物 2 之段落 a 所描述之方法使 220 毫克(0.73 毫莫耳)1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸與 3-氟苯

甲胺反應得出 125 毫克(0.3 毫莫耳，42%) N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 (**範例化合物 3**)。其質量光譜 m/z409.1 $[M+H]^+$。

**範例化合物 20 之合成:** 7-氰-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺

將 20 毫升(0.22 毫莫耳)N,N,N',N'-四甲基乙二胺，43 毫克(0.37 毫莫耳)氰化鋅，1 毫克(0.003 毫莫耳)三（二亞苄基丙酮）二鈀及 7 毫克(0.019 毫莫耳)4,5-雙二苯基膦-9,9-二甲基氧雜蒽加至溶於 N,N-二甲基甲醯胺(3 毫升)之 247 毫克(0.61 毫莫耳)7-溴-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 (範例化合物 16)。將該反應溶液除去氣體並以氮溶液沖洗三次，之後以微波於 160°C 加熱 4 分鐘。於冷卻至室溫後，將該混合物以矽藻土過濾，之後以二氯甲烷沖洗。將合併之濾出液在真空下加以濃縮。於矽膠管柱色層分析法(乙酸乙酯/己烷 1:2)分離殘餘物之後，取得 91 毫克(0.26 毫莫耳，43)7-氰-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1 氫-喹啉-3-羧酸醯胺(範例化合物 20)。其質量光譜 m/z 350.1$[M+H]^+$。

**範例化合物 28 之合成:** 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-乙酸

將甲醇(3 毫升)及 1 毫升(7.78 毫莫耳)7.78 體積莫耳濃度水性氫氧化鋰溶液於室溫下加入至溶於四氫呋喃(6 毫升)之 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-乙酸甲基酯溶液 (**範例化合物 26**)。將反應混合物於室溫攪拌 1.5 小時。將溶劑蒸發去除，以水(20 毫升)稀釋殘餘物並以二氯甲烷(10

毫升)清洗。以 2N (當量濃度)之氫氯酸酸化其水性部份，之後以二氯甲烷萃取該混合物 (3 x 30 毫升)。以硫酸鈉及蒸發之方式去除合併之有機相之水份。殘留物經丙酮-戊烷溶劑混合之結晶化後，得出 155 毫克(0.35 毫莫耳，46%) 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-乙酸 (**範例化合物 28**)。其質量光譜 m/z 437.1 $[M+H]^+$。

**範例化合物 38 之合成：** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-羥乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺

將 0.26 毫升(2.7 毫莫耳)三溴化硼於-78°C 加入至溶於二氯甲烷(30 毫升)之 800 毫克(1.83 毫莫耳) N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 (範例化合物 4) 溶液。於 0° C 攪拌該反應溶液 2 小時。之後冷卻該反應溶液至-78°C 及以飽和碳酸氫鈉溶液抑制該反應溶液之進行。以二氯甲烷(20 毫升)稀釋該反應溶液，且以飽和碳酸氫鈉溶液 (20 毫升)，飽和水性氯化鈉溶液(20 毫升)及水(20 毫升)洗滌，以硫酸鈉去除其水份，並於真空下加以濃縮。於矽膠管柱色層分析法(乙酸乙酯/己烷 1:4)分離殘餘物之後，取得 750 毫克(1.77 毫莫耳，97%) N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-羥乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 (**範例化合物 38**)。其質量光譜 m/z 423.1$[M+H]^+$。

**範例化合物 44 之合成：** N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-四氫哌啉-4-基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺

a) 1-(2-(四氫-2H-哌啉-4-基氨基)-4-(三氟甲基)苯基)乙酮之合成

將 250 微升(2.70 毫莫耳)二氫-2H-哌啉-4(3H)-酮於室溫下加至

溶於甲醇(18 毫升)之 500 毫克(2.46 毫莫耳)1-(2-氨基-4-(三氟甲基)苯基)乙酮溶液，之後加入 90 毫克(0.73 毫莫耳)癸硼烷。於室溫下攪拌該反應溶液 16 小時。於真空下蒸發該混合物並以乙酸乙酯(20 毫升)稀釋殘餘物。以水(20 毫升)、飽和水性氯化鈉溶液(20 毫升)洗滌有機相，以無水硫酸鈉去除其水份並於真空中加以濃縮。於矽膠管柱色層分析法(乙酸乙酯/己烷 1:24)取得殘餘物之後，取得 240 毫克(0.83 毫莫耳，34%) 1-(2-(四氫-2H-哌喃-4-基氨基)-4-(三氟甲基)苯基)乙酮。

b) 乙基 3-((2-乙醯基-5-(三氟甲基)苯基) 四氫-2H-哌喃-4-基)氨基)-3-丙酮酸之合成

將 360 微升(2.78 毫莫耳)乙基 3-氯-3-丙酮酸於 0°C 加至經攪拌，溶於甲苯(5 毫升)400 毫克(1.39 毫莫耳) 1-(2-(四氫-2H-哌喃-4-基氨基)-4-(三氟甲基)苯基)乙酮。於 80°C 下攪拌該反應混合物 4 小時。之後以乙酸乙酯(20 毫升)稀釋該混合物並以水(20 毫升)，飽和水性氯化鈉溶液(20 毫升)，及一飽和水性碳酸鈉溶液(2x30 毫升)洗滌，之後以無水硫酸鈉去除其水份並於真空下加以濃縮得到 550 毫克(1.37 毫莫耳，98%) 乙基 3-((2-乙醯基-5-(三氟甲基)苯基)(四氫-2H-4-哌喃基)氨基)-3-丙酮酸，不經進一步純化而直接用於下一步驟。

c) 乙基 4-甲基-2-氧基-1-(四氫-2H-哌喃-4-基)-7-(三氟甲基)-1,2-二氫喹啉-3-羧酸鹽之合成

將 60 毫克(1.51 毫莫耳，60% 懸浮於礦物油中)氫化鈉於 0°C 下加至經攪拌之溶於乙醇(5 毫升)之 550 毫克(1.37 毫莫耳) 乙基 3-((2-乙醯基-5-(三氟甲基)苯基)-( 四氫-2H-哌喃-4-基)氨基)-3-丙酮酸溶液中。於室溫下攪拌該反應混合物 30 分鐘。之後以乾燥方式將及蒸發，以水(10 毫升)稀釋殘餘並以 2N (當量濃度)之氫氯酸

將其酸化至 pH ~ 3。以乙酸乙酯(3x10 毫升)取得其水相萃取物。以水(10 毫升)，飽和水性氯化鈉溶液(10 毫升)洗滌其合併之有機相，並以無水硫酸鈉去除其水份，以蒸發方式取得未完成之產物，再一次以飽和碳酸鈉洗滌而得到 330 毫克(0.86 毫莫耳，62%)之乙基 4-甲基-2-氧基-1-(四氫-2H-哌喃-4-基)-7-(三氟甲基)-1,2-二氫喹啉-3-羧酸鹽，不經進一步純化而直接用於下一步驟。

d) 4-甲基-2-氧基-1-(四氫-2H-哌喃-4-基)-7-(三氟甲基)-1,2-二氫喹啉-3-羧酸之合成

將 140 毫克(3.45 毫莫耳)氫氧化鈉於室溫下加至溶於乙醇(6 毫升)及水(0.6 毫升)之 330 毫克(0.86 毫莫耳)乙基 4-甲基-2-氧基-1-(四氫-2H-哌喃-4-基)-7-(三氟甲基)-1,2-二氫喹啉-3-羧酸鹽。於 80°C 下攪拌該反應混合物 16 小時。之後以乾燥方式將混合物蒸發並以水(5 毫升)稀釋其殘餘物，之後以 2N (當量濃度)之氫氯酸將其酸化至 pH ~ 3。以乙酸乙酯(3 x 10 毫升)取得其水相萃取物。以水(10 毫升)，飽和水性氯化鈉溶液(10 毫升)洗滌其合併之有機相，並以無水硫酸鈉去除其水份，於真空下加以濃縮得到 280 毫克(0.79 毫莫耳，91%)之 4-甲基-2-氧基-1-(四氫-2H-4-哌喃基)-7-(三氟甲基)-1,2-二氫喹啉-3-羧酸，不經進一步純化而直接用於下一步驟。

e) N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-四氫-哌喃-4-基-7-(三氟甲基)-1 氫-喹啉-3-羧酸醯胺之合成

將 360 毫克(0.95 毫莫耳) O-(-7-氮雜-苯並三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸鹽及 54 微升(3.15 毫莫耳) N,N-二異丙基乙胺於 0°C 下加至經攪拌溶於二氯甲烷(5 毫升)之 280 毫克(0.79 毫莫耳) 4-甲基-2-氧基-1-(四氫-2H-哌喃-4-基)-7-(三氟甲基)-1,2-二氫喹啉-3-羧酸溶液。於 0°C 下攪拌該反應混合物 5 分鐘，之後加入 90 微

升(0.79 毫莫耳) 3-氟-苯甲胺。於室溫下攪拌該反應混合物 4 小時。之後以水(5 毫升)稀釋該混合物並以二氯甲烷萃取(3x10 毫升)。以水(10 毫升)，飽和水性氯化鈉溶液(10 毫升)洗滌其合併之有機相，並以無水硫酸鈉去除其水份，於真空下加以濃縮。於矽膠管柱色層分析法(丙酮/己烷 1:3)取得殘餘物之後，取得 210 毫克(0.45 毫莫耳，57%) N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-四氫-哌喃-4-基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 (範例化合物 44)。其質量光譜 m/z 463.2$[M+H]^+$。

**其它範例化合物之合成**

其他之範例化合物係依據前述之方法進行合成。表 1 列舉出化合物及其所依據之合成方法。該技術領域中具有通常知識者知曉每種方法中所使用之反應物及試劑。

表 1:

| 範例化合物 | 化學名稱 | 依據範例化合物之合成方法 | 質量光譜 m/z $[M+H]^+$ |
|---|---|---|---|
| 4 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 437.1 |
| 5 | 1-乙基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 407.1 |
| 6 | N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 393.1 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 7 | N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 437.1 |
| 8 | 1-乙基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 407.1 |
| 9 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 325.1 |
| 10 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 369.2 |
| 11 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-丙基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 421.1 |
| 12 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-1-(3-甲基-丁基)-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 449.2 |
| 13 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-1-(4-甲基-戊基)-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 463.2 |
| 14 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(3-甲氧基-丙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 451.2 |
| 15 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[2-(2-甲氧基-乙氧基)-乙基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 481.2 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 16 | 7-溴-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 403.0 |
| 17 | 7-溴-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 403.0 |
| 18 | 7-溴-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 447.1 |
| 19 | 7-溴-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 447.1 |
| 21 | 7-氰-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 20 | 350.1 |
| 22 | 7-氰-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 20 | 394.1 |
| 23 | 7-氰-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 20 | 394.1 |
| 24 | N-(4,4-二甲基-戊基)-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 427.2 |
| 25 | N-(4,4-二甲基-戊基)-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 1 | 383.2 |
| 26 | 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-1-基-喹啉]-乙酸甲基酯 | 1 | 451.1 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 27 | 3-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-丙酸甲基酯 | 1 | 465.1 |
| 29 | 3-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-1-基]-丙酸 | 28 | 451.1 |
| 30 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[1-(甲氧基甲基)-丙基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 465.2 |
| 31 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[2-甲氧基-1-(甲氧基甲基)-乙基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 481.2 |
| 32 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-丁基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 465.2 |
| 33 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲硫基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 409.1 |
| 34 | 7-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 343.1 |
| 35 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-1-甲基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 451.2 |
| 36 | N-[(4-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 3 | 409.1 |
| | | | |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 37 | 7-氯基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1,4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 359.1 |
| 39 | 1-(2-乙氧基-乙基)-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 451.2 |
| 40 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-異丙基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 421.1 |
| 41 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-戊基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 449.2 |
| 42 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-甲基-2-氧基-4-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 379.1 |
| 43 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-丙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 451.2 |
| 45 | N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲氧基-1-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺 | 2 | 409.1 |

**藥理學實驗**

**方法一:使用一對電壓敏感之染劑之螢光測量法**

將表現 KCNQ2/3 通道之中國倉鼠卵巢(CHO)-K1-細胞於 37°C 下，5%二氧化碳($CO_2$)及 95%空氣濕度下以貼生之方式培養於含有 10%胎小牛血清(FCS)(PAN Biotech，例如 3302-P270521)之 DMEM-高葡萄糖培養基(Sigma Aldrich D7777)或含 10%胎小牛血清(Invitrogen，12070-106，經加熱去除活性)及必要抗生素之 MEM Alpha 培養基(1 x，液體，Invitrogen，#22571)之細胞培養瓶(例如，Nunc 之 80 平方公分 TC 瓶)中。

收集細胞進行測量之前，先將細胞以一 1x 不含 $Ca^{+2}/Mg^{+2}$ 之 DPBS 緩衝液(例如，Invitrogen，#14190-094)洗滌，然後以 Accutase 水解酶(PAA Laboratories，#L11-007)將細胞從細胞培養瓶之平底分離(將細胞培養液與 Accutase 水解酶於 37° C 培養 15 分鐘)。將所得之細胞以一 CASYTM 細胞計數器(TCC 型，Schärfe 系統)進行細胞數之測定，以便於接下來依據個別細胞株於濃度上最適化之情況將 20,000 至 30,000 個細胞/孔/100 微升所述之營養培養基添加至 CorningTMCellBINDTM 型 (淺式透明底部黑色之聚苯乙烯微孔細胞培養盤，#3340) 96 孔測量盤中。接著於無氣體之供應下或於無空器濕度之調節下將細胞室溫下培養 1 小時，繼而將細胞於 37°C 下，5%二氧化碳($CO_2$)及 95%空氣濕度下培養 24 小時。

由膜電位試驗套組 RedTM Bulk format part R8123 for FLIPR, MDS Analytical TechnologiesTM)配製對電壓敏感之螢光染劑，其方法係將一膜電位試驗套組紅色組成份 A 瓶內之內容物溶解於 200 毫升之細胞外緩衝溶液(ES-緩衝溶液、120 毫體積莫耳濃度之氯化鈉、1 毫體積莫耳濃度之氯化鈉、10 毫體積莫耳濃度之 HEPES、2 毫體積莫耳濃度之氯化鈣、2 毫體積莫耳濃度之氯化鎂、

10 毫體積莫耳濃度之葡萄糖；pH 值 7.4 中)、於移除營養基後，將細胞以 200 微升之 ES-緩衝溶液洗滌，接著將 100 微升之前所配製染劑添加至細胞中，然後將細胞室溫及避光之下培養 45 分鐘。

螢光測量係以 BMG Labtech FLUOstarTM、BMG Labtech NOVOstarTM 或 BMG LabtechPOLARstarTM 儀器(激發波長 525 奈米，發射波長 560 奈米，底部讀值模式)進行之。經一染劑培養後，將 50 微升所需濃度之代測物質或 50 微升作為對照組之 ES 緩衝溶劑添加至該測量盤之個別小孔中，然後將其室溫及其避光之下培養 30 分鐘。接著測量染劑之螢光強度 5 分鐘，並於設定不變之時間點下測得每個小孔之螢光值 F1。緊接著於每個小孔中添加入 15 微升之氯化鉀溶液(末濃度為 92 毫體積莫耳濃度鉀離子)。然後持續測量螢光之變化，直到所有相關之測量值皆測得為止(測量時間主要為 5 至 30 分鐘)。於添加氯化鉀後之設定時間點測的螢光值 $F_2$，此係螢光波峰出現之時間點。

計算時，將螢光強度 $F_2$ 與螢光強度 $F_1$ 進行比較，並由比較之結果求得標的化合物對鉀離子通道之促效活性（$\Delta F/F$）。$F_1$ 與 $F_2$ 計算方法如下:

$$\left(\frac{F_2 - F_1}{F_1}\right) \times 100 = \frac{\Delta F}{F}(\%)$$

為求得一物質是否具促效活性，可例如將 $\frac{\Delta F}{F}$ 與對照組細胞之 $\left(\frac{\Delta F}{F}\right)_K$ 進行比較。$\left(\frac{\Delta F}{F}\right)_K$ 之測量方法係於反應混合物中，而非於待測物質中，僅僅添加入緩衝溶液，然後測定螢光強度值 $F_{1K}$，接著如前文所述添加入鉀離子，並測量螢光強度值 $F_{2K}$。然後如下所數計算 $F_{2K}$ 及 $F_{1K}$:

$$\left(\frac{F_{2K}-F_{1K}}{F_{1K}}\right)\times 100=\left(\frac{\Delta F}{F}\right)_K(\%)$$

一物質對鉀離子通道之促效活性，若 $\frac{\Delta F}{F}$ 大於 $\left(\frac{\Delta F}{F}\right)_K$ 時:

$$\frac{\Delta F}{F} \rangle \left(\frac{\Delta F}{F}\right)_K$$

除比較 $\frac{\Delta F}{F}$ 與 $\left(\frac{\Delta F}{F}\right)_K$ 之外，亦可被斷定為標的化合物之促效作用者及當標的化合物隨著劑量增加時，可觀察到 $\frac{\Delta F}{F}$ 數值亦隨之增加。

$EC_{50}$ 及 $IC_{50}$ 數值係藉 'Prism v4.0'軟體(GraphPadSoftwareTM)所計算。

**方法 II. 低強度之大鼠甩尾試驗**

於低強度之大鼠甩尾試驗中，根據本發明化合物之對於急性有害熱刺激之止痛效果之判斷係由迪阿莫及史密思(藥理學和實驗性治療期刊. 72, 74 79 (1941)) [*D'Amour and Smith (J. Pharm. Exp. Ther. 72, 74 79 (1941)*)中所描述之測量大鼠因聚焦灼熱之光線而移開尾巴之方法所完成。於此試驗中，實驗動物皆各自單獨被裝進一特別之試驗隔間之內，且其尾巴之基部被暴露於一鎮痛測量儀(2011 型，Rhema Labortechnik，Hofheim，德國)聚焦灼熱之光線(48°C)之下。灼熱光線之強度於本試驗中被選擇使得對照組之移開尾巴之潛伏時間達到約 7 秒，因而允許神經索調整經由脊椎之急性疼痛反射。切斷時間為 30 秒以避免組織傷害。 本試驗使用體重介於 200 至 250 公克之雄性 Sprague-Dawly 大鼠(動物飼養者: Janvier, Le Genest St. Isle，法國)。10 隻大鼠為一組，於施予根據

本發明之化合物之前，每隔 5 分鐘測量移開尾巴之潛伏時間二次，並將其平均值定義為對照組之潛伏時間。於口服施與化合物 20 分鐘、40 分鐘、及 60 分鐘後測定止痛效果之測量。止痛效果之有效性係以移開尾巴之潛伏時間變長為表徵所計算且表示為最大可能作用之百分以(MPE[%])。

$MPE = [(T_1-T_0)/(T_2-T_0)]^*100$

其中: $T_0$: 施予試驗物質前之對照組潛伏時間，$T_1$: 施予試驗物質後之對照組潛伏時間，$T_2$: 灼熱光線最長暴露時間(30 秒)，MPE: 最大可能作用。藉由變異數分析(重複測量 ANOVA)測試給予試驗物質之分組與不給予試驗物質之分組間於統計學上是否有顯著意義之差異性存在。顯著意義之水準設定≤ 0.05。為確定劑量依賴性，根據本發明之特定化合物以 3-5 之對數增加施與之劑量，包括一個閾劑量及一最大有效劑量，且以回歸分析之輔助測定其 $ED_{50}$ 值。 $ED_{50}$ 值之計算係於最大療效時執行（通常於施與化合物之後 20 分鐘）。

**藥理學數據**

根據本發明之化合物之藥理學效果測定係根據之前敘述之方法(**藥理學實驗**，方法 I 及 II)。

表 2 係對應之藥理學數據概述。

表 2：

| 範例號碼 | 螢光測量 % 療效 (RTG = 100%) | 螢光測量 $EC_{50}$ [nM] | 低強度鼠甩尾試驗口服,達百分之五十的有效劑量 ($ED_{50}$)or MPE (劑量) [毫克/公斤] |
|---|---|---|---|
| **1** | 177 | 245 | 2.3 |
| **2** | 90 | 235 | |
| **3** | 101 | 124 | 24 (10.00) |
| **4** | 195 | 850 | 2.8 |
| **5** | 173 | 381 | |
| **6** | 169 | 189 | 0.6 |
| **7** | 146 | 598 | 47 (3.16) |
| **8** | 175 | 401 | |
| **9** | 63 | 5687 | |
| **10** | 22 | | |
| **11** | 167 | 406 | |
| **12** | 33 | | |
| **13** | 3 | | |
| **14** | 61 | 992 | |
| **15** | 78 | 2017 | |
| **20** | 143 | 1273 | |

| | | |
|---|---|---|
| **21** | 136 | 837 |
| **22** | 102 | 3137 |
| **23** | 105 | 3891 |
| **24** | 231 | 167 |
| **25** | 258 | 68 |
| **26** | 108 | 1006 |
| **27** | 22 | |
| **28** | 16 | |
| **29** | 6 | |
| **30** | 133 | 193 |
| **31** | 46 | 80 |
| **32** | 26 | |
| **33** | 138 | 386 |
| **34** | 105 | 3144 |
| **35** | 118 | 114 |
| **36** | 99 | 126 |
| **37** | 139 | 729 |
| **38** | 160 | 1827 |
| **39** | 43 | |
| **40** | 145 | 75 |
| **41** | 18 | |
| **42** | 103 | 4992 |
| **43** | 100 | 1682 |
| **44** | 36 | |
| **45** | 190 | 215 |

201212917

Part 3 of 3

# 發明專利說明書

（本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫）

※ 申請案號：100130611

※ 申請日：100. 8. 26

※IPC 分類：A61K 31/47 (2006.01)
C07D 215/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

## 一、發明名稱：（中文/英文）

作為 KCNQ2/3 鉀離子通道調節劑之經取代之 2-氧基-及 2-硫基-二氫喹啉-3-羧醯胺

Substituted 2-oxo- and 2-thioxo-dihydroquinoline-3-carboxamides as KCNQ2/3 modulators

## 二、中文發明摘要：

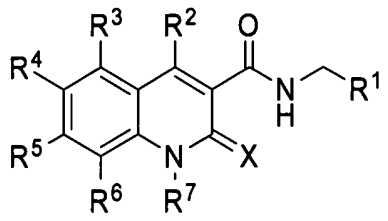
本發明係有關包含經取代 2-氧基-及 2-硫基-二氫喹啉-3-羧醯胺(2-oxo- and 2-thioxo-dihydroquinoline-3-carboxamides)之化合物成份之藥物且有關用於治療且或預防疼痛以及另外之疾病及/或失調。

## 三、英文發明摘要：

The invention relates to substituted 2-oxo- and 2-thioxo-dihydroquinoline-3-carboxamides to pharmaceutical compositions containing these compounds and also to these compounds for use in the treatment and/or prophylaxis of pain and further diseases and/or disorders.

## 七、申請專利範圍：

1. 一種根據通式(I)之經取代之化合物



(I)，

其中，

X　　代表氧或硫原子，

$R^1$　　代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且可各自隨意地經由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或經取代一或數次；芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且可各自隨意地經由一含 1 至 8 各碳原子之脂肪烴連接，其可為未經取代或經取代一或數次；

$R^2$　　代表氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；醛基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘

基可各自為未經取代或經取代一或數次；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基，其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且可各自隨意地經由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴連接，其可為未經取代或經取代一或數次；

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地代表氟、氯、溴、碘等原子；氰基；三氟甲基；醛基；羧基；醯胺基；三氟甲硫基；羥基磺醯基；硝基；三氟甲氧基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或經取代一或數次；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基，其

中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或經取代一或數次；一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基，或一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基，其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且其各自隨意地經由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或經取代一或數次；

$R^7$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員雜環族殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次且各自隨意地經由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或經取代一或數次，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基之情況時，該 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原

子連結，

其等各自之“脂肪烴官能基”及“脂肪烴殘基”可為直鏈或支鏈，飽和或未飽和，

其等各自之“環脂肪烴殘基”及“雜環脂肪烴殘基”可為飽和或未飽和，

對一“脂肪烴”及一“脂肪烴殘基”之“取代一或數次”，其對應殘基或官能基而言，“取代一或數次”係有關以選自至少一個由下列組成之群之取代基取代彼此各自無關之一或多個氫原子，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、羥基、三氟甲氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、羥基磺醯基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、醛基、羧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含3至6個碳原子之環脂肪烴、一3至6員之雜環脂肪烴殘基、醯胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基；

對一“環脂肪烴殘基”及一“雜環脂肪烴殘基”之“取代一或數次”，其對應殘基或官能基而言，“取代一或數次”係有關以選自至少一個由下列組成之群之取代基取代彼此各自無關之一或

多個氫原子，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、側氧基、羥基、三氟甲氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、羥基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、醛基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基、一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基、醯胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基；

對一“芳香族”及一“雜芳香族” 之“取代一或數次”，其對應殘基或官能基而言，“取代一或數次”係有關以選自至少一個由下列組成之群之取代基取代彼此各自無關之一或多個氫原子，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、、、、、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基、羥基、三氟甲氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子

之脂肪烴硫基、羥基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之磺醯胺基、氰基、三氟甲基、醛基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基、一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基、苯甲基、芳香基、雜芳香基、醯胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基及一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基；

下列化合物為例外:

1- 乙基-N-(4-甲氧基苄基)-4-甲基-2-氧基-1,2-二氫喹啉-3-羧醯胺，

其形式為游離化合物、消旋物、對映異構物、非對映異構物、任何比例混合對映異構物或非對映異構物之混合物、或獨立對映異構物或非對映異構物、或生理可接受之酸或鹼形成之鹽類之形式。

2. 根據專利申請範圍第 1 項之化合物，其特徵為，

$R^1$ 代表一含 1 至 10 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自

為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

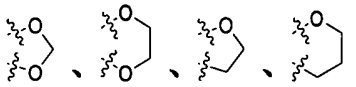
或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環族殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員之匙雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基、及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基

取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基可各自隨意地經由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，或代表一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘

基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、 乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基、一3至6員之雜環脂肪烴殘基、、苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基，

其中含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中各自之苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包括氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、羥基甲氧基、甲氧基甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，且

其中各自之含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中各自之芳香基及雜芳香基可隨意地經由一含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基及羧基，

X　代表氧或硫原子；

$R^2$　代表氟；氯；溴；碘等原子；氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，其中

含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或經取代一或數次；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，各自為未經取代或經取代一或數次且各自可隨意地經由一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基連接，其可為未經取代或經取代一或數次，

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此無關地代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；氰基；三氟甲基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；醛基；羧基；醯胺基；羥基磺醯基；硝基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之醯胺基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基取代之胺基及一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基取代之胺基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少

一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基及一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基或一3至6員之雜環脂肪烴殘基、其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且各自隨意地經由一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴官能基連接；

$R^7$ 代表一含1至10個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基及羧基，

其中含1至4個碳原子之脂肪烴殘基各自可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含3至10個碳原子之環脂肪烴殘基或一3至10員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基及一3至6員之雜環脂肪烴殘基，

其中各自之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基、及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基及3至6員之雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、

硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

且其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基可隨意地經由一未經取代之含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基之情況時，該 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

3. 根據專利申請範圍第 1 項或第 2 項之化合物，其特徵為，

$R^2$ 代表氟；氯；溴；碘等原子；氰基；三氟甲基；硝基；三氟甲氧基；三氟甲硫；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基

其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

且其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可各自隨意地藉由一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基。

4. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；氰基；三氟甲基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；醛基；羧基；醯胺基；羥基磺醯基；硝基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一

含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基磺醯基，其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、側氧基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且各自隨意地經由一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴官能基連接。

5. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，

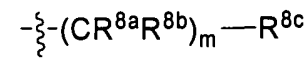
$R^3$、$R^4$、$R^5$及$R^6$ 彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；三氟甲氧基；三氟甲硫基；一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基羰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基，其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數

次，其包含氟、氯等原子及甲氧基。

6. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，至少 $R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 之一不等於氫原子。

7. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，

$R^1$ 代表局部結構 **(T1)**



**(T1)** ，

其中

m 代表 0、1、2、3 或 4，

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基或羧基，

$R^{8c}$ 代表一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基或羧基，

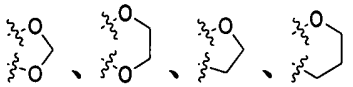
或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代

或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基及一3至6員之雜環脂肪烴殘基，

其中含1至4個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中各自之含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基及一3至6員之雜環脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含1至4個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含1

至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基，

或代表一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基、、苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基，

其中各自之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

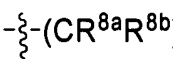
其中之苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基、呋喃基、噻唑基及噁唑基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪

烴殘基取代之胺基、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、羧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，且

其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、一被一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、一被二含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基取代之胺基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基及羧基。

8. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，

$R^1$ 代表局部結構 **(T1)**，



**(T1)** ，

其中

m 代表 0、1 或 2，

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子，一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至

4 個碳原子之脂肪烴殘基，

$R^{8c}$ 代表一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，其為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、三氟甲基、及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯等原子、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，

或代表一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次、其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧

基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基、一含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基或一3至6員之雜環脂肪烴殘基、苯甲基，苯基、噻吩基及吡啶基，

其中各自之苯甲基、苯基、噻吩基、吡啶基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，

且其等各自之含3至6個碳原子之環脂肪烴殘基或一3至6員之雜環脂肪烴殘基可為氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基及羧基。

9. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，

$R^7$ 代表一含1至10個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、羧基、三氟甲基、氰基、及一含1

至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或一 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、一含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及一 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且其中含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基及 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂

肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基、 及一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基，

且其中含3至10個碳原子之環脂肪烴殘基或3至10員之雜環脂肪烴殘基各自隨意地經由一含1至8個碳原子之脂肪烴官能基連接，其可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、硝基、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、氰基及一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基。

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基之情況時，該3至10員之雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

10. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，

$R^7$ 代表一含1至8個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基、羧基、一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含1至4個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基、及一含1至4個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、側氧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲基、及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

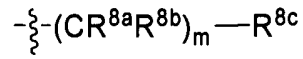
其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、三氟甲氧基、三氟甲基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基，且

其中含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基各自隨意地經由一未經取代之含 1 至 8 個碳原子之脂肪烴官能基連接，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 10 員雜環脂肪烴殘基之情況時，該 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

11. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，

$R^1$ 代表部份結構 (T1)，



(T1) ，

其中

m 為 0、1 或 2 且

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

$R^{8c}$ 代表一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基、及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；

或代表一含 3 至 10 個碳原子之環脂肪烴殘基或 3 至 10 員之雜環脂肪烴殘基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲基、及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

或

其中

m 為 0，

$R^{8a}$ 及 $R^{8b}$ 彼此各自無關地代表氫、氟等原子、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基或一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基；且

$R^{8c}$ 代表一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基及苯基，

其中苯基可為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、三氟甲氧基、三氟甲基、氰基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基及乙氧基羰基，

X 代表氧或硫原子；

$R^2$ 係選自由下列組成之群，其包括氟；氯；溴等原子；三氟甲基；甲基；乙基；異丙基；環丙基；及甲氧基；

$R^3$、$R^4$、$R^5$ 及 $R^6$ 彼此各自無關地選自由下列組成之群，其包括氫；氟；氯；溴等原子；三氟甲基；氰基；三氟甲氧基及硝基；

$R^7$ 代表一含 1 至 6 個碳原子之脂肪烴殘基，未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代

一或數次，其包含氟、氯、溴、碘等原子、羥基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基、羧基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基羰基、三氟甲氧基、硫氫基、三氟甲硫基、一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴硫基、三氟甲基及一含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基，

其中含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基可各自為未經取代或以至少一個選自由下列組成之群之取代基取代一或數次，其包含羥基及一未經取代之含 1 至 4 個碳原子之脂肪烴殘基氧基；

或代表一未經取代之含 3 至 6 個碳原子之環脂肪烴殘基或未經取代之 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基，

假如 $R^7$ 代表一 3 至 6 員雜環脂肪烴殘基之情況時，該 3 至 6 員之雜環脂肪烴殘基係藉由一碳原子連結。

12. 根據前述專利申請範圍任一項之化合物，其特徵為，該化合物係選自由下列組成之群，其包括:

1 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

2 1-丁基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

3 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

4 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

5 1-乙基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

6 N-[(4-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

7 N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

8 1-乙基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

9 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

10 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

11 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-丙基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

12 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-1-(3-甲基-丁基)-2-氧基-7- (三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

13 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-1-(4-甲基-戊基)-2-氧基-7- (三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

14 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(3-甲氧基-丙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

15 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[2-(2-甲氧基-乙氧基)-乙基]-4-甲基-2-氧基-7- (三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

16 7-溴-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

17 7-溴-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

18 7-溴-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

19 7-溴-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

20 7-氰-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

21 7-氰-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

22 7-氰-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

23 7-氰-N-[(4-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

24 N-(4，4-二甲基-戊基)-1-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

25 N-(4，4-二甲基-戊基)-1，4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

26 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)- 1H-喹啉-1-基]-乙基甲基酯；

27 3-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基) -1H-喹啉-1-基]-丙酸甲基酯；

28 2-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基) -1H-喹啉-1-基]-乙基；

29 3-[3-[(3-氟苯基)-甲基-胺甲醯基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基) -1H-喹啉-1-基]-丙酸；

30 N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[1-(甲氧基甲基)-丙基]-4-甲基-2-氧基-7- (三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**31** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-[2-甲氧基-1-(甲氧基甲基)-乙基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**32** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-丁基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**33** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-7-(三氟甲氧基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**34** 7-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**35** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-1-甲基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**36** N-[(4-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-硫基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**37** 7-氯-N-[(3-氟苯基)-甲基]-1，4-二甲基-2-氧基-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**38** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-羥基-乙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**39** 1-(2-乙氧基-乙基)-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**40** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-異丙基-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**41** N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-戊基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**42** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-甲基-2-氧基-4-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**43** N-[(3-氟苯基)-甲基]-1-(2-甲氧基-丙基)-4-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**44** N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-氧基-1-四氫-哌喃-4-基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

**45** N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲氧基-1-甲基-2-氧基-7-(三氟甲基)-1H-喹啉-3-羧酸醯胺；

各自之形式為游離化合物；消旋物；對映異構物，非對映異構物、對映異構物或以任何比例混合之非對映異構物或獨立對映異構物或非對映異構物之混合物；或以生理可接受之酸或鹼形成之鹽類之形式。

13. 一種包括至少一根據前述專利申請範圍任一項所述化合物之醫藥組成物，其形式為游離化合物；消旋物；對映異構物、非對映異構物、對映異構物或以任何比例混合之非對映異構物或獨立對映異構物或非對映異構物之混合物；或以生理可接受之酸或鹼形成之鹽類形式，

及任意至少一種藥理學上可接受之輔助劑及/或至少一種另外有效成份。

14. 根據申請專利範圍第 1 項至第 12 項之化合物用於治療及/或預防至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之失調及/或疾病，較佳用於治療及/或預防由選自由下列組成之群中之失調及/或疾病，其包括疼痛，較佳由下列組成之群之疼痛，其包括急性疼痛，慢性疼痛，神經性疼痛，肌肉性疼痛，內臟性疼痛及發炎性疼痛，癲癇，小便失禁，焦慮症，成癮症，躁鬱症，雙極性異常，偏頭痛，認知疾病及肌張力障礙相關之運動異常。

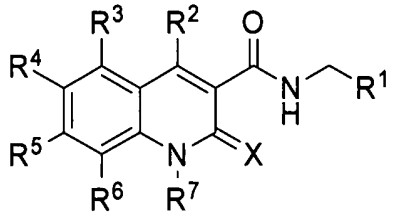
15. 一種用於治療及/或預防哺乳類至少部份因 KCNQ2/3 鉀離子通道造成之異常及/或疾病之方法，較佳用於治療及/或預防由選自由下列組成之群中之病症及/或疾病，其包括疼痛，較佳由下列組成之群之疼痛，其包括急性疼痛，慢性疼痛，神經性疼痛，

肌肉性疼痛，內臟性疼痛及發炎性疼痛，癲癇，小便失禁，焦慮症，成癮症，躁鬱症，雙極性異常，偏頭痛，認知疾病及肌張力障礙相關之運動異常，該方法包含施與之一有效劑量之至少一根據專利申請範圍第 1 項至第 12 項任一項之化合物於哺乳類。

四、指定代表圖：

本案無圖示

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：




(I)