



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I461197 B

(45)公告日：中華民國 103 (2014) 年 11 月 21 日

(21)申請案號：099105238

(22)申請日：中華民國 99 (2010) 年 02 月 24 日

(51)Int. Cl.：

*A61K31/47 (2006.01)**C07D215/36 (2006.01)**A61P29/00 (2006.01)**A61P25/08 (2006.01)**A61P25/22 (2006.01)**A61P25/06 (2006.01)*

(30)優先權：2009/03/12 歐洲專利局

09003597.3

(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

(56)參考文獻：

FR 2532939A1

審查人員：楊婷雅

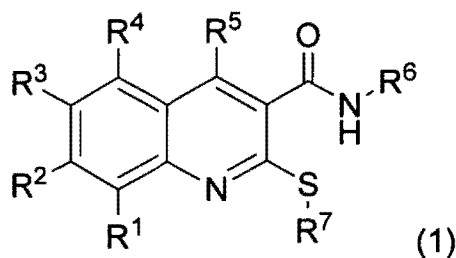
申請專利範圍項數：16 項 圖式數：0 共 164 頁

(54)名稱

作為 K C N Q 2 / 3 調節劑之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺

(57)摘要

本發明係關於被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺(2-Mercaptochinolin-3-carboxamid)、其等之製備方法、含該等化合物之藥品及該等化合物於製備藥品之使用。



公告本

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)

102.1.25 修正

※申請案號：99105238

C07D 215/36 (2006.01)

※申請日：99.2.24

※IPC 分類：

A61K 31/47 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

A61P 25/08 (2006.01)

A61P 25/22 (2006.01)

A61P 25/06 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

作為 KCNQ2/3 調節劑之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺

二、中文發明摘要：

本發明係關於被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺 (2-Mercaptochinolin-3-carboxamid)、其等之製備方法、含該等化合物之藥品及該等化合物於製備藥品之使用。

三、英文發明摘要：

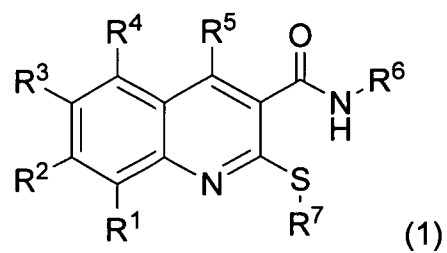
四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 () 圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

本案無圖式

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於被取代之 2-巯基喹啉-3-甲醯胺 (2-Mercaptochinolin-3-carboxamid)、其等之製備方法、含該等化合物之藥品及該等化合物於製備藥品之使用。

【先前技術】

治療疼痛，尤其係治療因神經病變所引起之疼痛，於醫學上具相當之重要性。世界各地普遍存在有效治療疼痛之需求。該種於針對病人及針對標的之慢性及非慢性疼痛狀態治療方面之迫切需求，其中，此處被理解為給予病人於疼痛上有效且滿意之治療，亦被大量記載於過去刊登於應用鎮痛藥或疼痛感覺基礎研究之領域方面之科學論文中。

慢性疼痛之病生理特徵係為神經細胞本體之應激性過高。神經細胞本體之應激性主要受鉀離子通道之活性所影響，該等通道左右著該細胞靜止時之膜電位，因而亦左右其應激之閾值。具分子亞型 KCNQ2/3 (Kv7.2/7.3)之異聚合體鉀離子通道係表現於中樞神經系統(海馬迴，腦杏仁核體)及周圍神經系統(背根神經節)不同區域之神經細胞中，並調控該等細胞之應激性。活化 KCNQ2/3 鉀離子通道造成細胞膜過度被極化，並因此進一步造成該等細胞本體電應激性之降低。背根神經節表現 KCNQ2/3 之神經細胞參與將疼痛感覺受體接受到之刺激從末梢神經傳遞至骨髓(Passmore et al., J Neurosci. 2003 ; 23(18) : 7227-36)。

故，KCNQ2/3 之促效劑 Retigabine，於臨床前期神經病理及發炎疼痛之模型中可被證明具止痛之效果(Blackburn-Munro 及 Jensen, Eur J Pharmacol. 2003 ; 460(2-3) : 109-16 ; Dost et al., Naunyn Schmiedeberg's Arch Pharmacol 2004 ; 369(4) : 382-390)。

KCNQ2/3 鉀離子通道因而為一適合之著力點用於治療疼痛；尤其係治療由慢性疼痛，神經病變所引起之疼痛，發炎所引起之疼痛及肌肉疼痛等構成之組群所選出之疼痛(Nielsen et al., Eur J Pharmacol. 2004；487(1-3)：93-103)；尤其係治療神經病變所引起之疼痛及發炎所引起之疼痛。

此外，KCNQ2/3 鉀離子通道亦為一適合之標的用於治療一些其他之病症，例如偏頭痛(美國專利案 US2002/0128277)、認知之病症(Gribkoff, Expert Opin Ther Targets 2003；7(6)：737-748)、焦慮狀態(Korsgaard et al., J Pharmacol Exp Ther. 2005, 14(1)：282-92)、癲癇(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)、尿失禁(Streng et al., J Urol 2004；172：2054-2058)、成癮症(Hansen et al., Eur J Pharmacol 2007, 570(1-3)：77-88)、躁鬱症/雙階段障礙症(Dencker et al., Epilepsy Behav 2008, 12(1)：49-53)、與肌張力不全症相關之自主運動(Richter et al., Br. J Pharmacol 2006, 149(6)：747-53)。

此外，不僅於對 KCNQ2/3 需具有親和性之外，而且尚需其他於性質諸如(強度，療效)上可比較或更佳之化合物。

故，改善代謝產物之安定性，其等於水性溶媒中之溶解度或該等化合物之滲透度可為有利。該等因素對於口服生物可利用率可產生有利之結果，抑或能改變 PK/PD(藥動學/藥效學)之量變曲線圖，其例如能產生更有利之作用時效。

同時，與參與藥品主成分之吸收及排泄之輸送分子產生微弱或不產生交互作用亦可被評估為生物可利用率得改善及藥物交互作用稀少之證據。此外，與參與藥品主成分之分解及排泄之酵素產生之交互作用應亦要儘可能地低微，因該等試驗之結果同樣亦

顯示出可預期存在稀微或毫無藥物之交互作用。

此外，當該等化合物顯示出對於 KCNQ 族群之其他受體具高度之選擇性(專一性)，例如針對 KCNQ1、KCNQ3/5 或 KCNQ4 等時，可為有利。高度之選擇性對於副作用之量變曲線圖可產生有利之結果。是故例如已知(亦)與 KCNQ1 結合之諸化合物會產生心臟副作用之高風險，因對 KCNQ1 高度之選擇性係可值得期待。然而，針對其他受體具高選擇性亦可為有利。與人類 ERG 離子通道或與左旋型鈣離子通道(苯基烷基胺基結合位、苯並硫氮環庚三烯結合位、二氫吡啶結合位)具稀少之親和性可為有利，因該等受體會造成心臟副作用之出現。總而言之，於關於與其他內生性蛋白質(即例如受體或酵素)結合之選擇性經改善後可使副作用之量變曲線圖得改善，並因此改善其相容性。

本發明之目的因此在於提供新穎之化合物，其等較目前技術水準下之化合物更具優勢。該等化合物應尤其適合作為藥品中，尤其於用於治療至少部分因 KCNQ2/3 鉀離子通道所促成之障礙症或病症之藥品中之藥理主成分物質。

此目的為申請專利範圍之標的所達成。

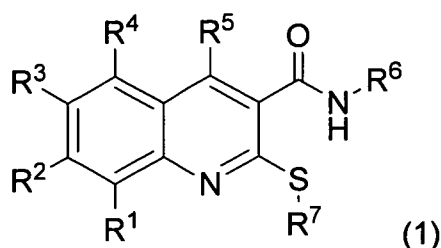
由目前之技術水準得知被取代之喹啉基化合物，其適合作為人類 YAK1-磷酸化酶(hYAK1-Kinase)及人類 YAK3-磷酸化酶(hYAK3-Kinase)之抑制劑(世界專利案 WO 02/081728 A2)。此外，4-羥基喹啉-3-羧酸衍生物亦已知為避光劑(歐洲專利案 EP 0 900 824 A1)。

意外被發現：具下文所示通式(1)之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺適合被使用於治療疼痛。此外，更意外發現：具下文所示通式(1)之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺對於 KCNQ2/3 鉀離子通道亦具極佳之親和性，因此適合被用以治療至少部分因 KCNQ2/3 鉀離子通道所促成之

障礙症或病症。被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺於此作用之方式為 KCNQ2/3 鉀離子通道之調節劑，亦即其促效劑或拮抗劑。

【發明內容】

本發明之標的為具下圖所示通式(1)之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺



其中

R^0 代表含 1 至 10 個碳原子之烷基(C_{1-10} -Alkyl)或含 2 至 10 個碳原子之雜烷基(C_{2-10} -Heteroalkyl)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或經取代一或數次；含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，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；經由含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基(C_{2-8} -Heteroalkyl)鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次，其中該烷基或雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉，飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次；或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基鍵結之芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或經取代一或數次，其中該烷基或雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉，飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次；

R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基；醛基； R^0 酮基($C(=O)R^0$)；羧基； R^0 羧酸酯基($C(=O)OR^0$)；醯胺基；被一 R^0 基取代之醯胺基($C(=O)NHR^0$)；被

二 R^0 基取代之醯胺基($C(=O)N(R^0)_2$)；羥基； R^0 基氧基(OR^0)； R^0 基羧基($O-C(=O)-R^0$)； R^0 基氧基羧基($O-C(=O)-O-R^0$)；被一 R^0 基取代之醯胺基氧基($O-(C=O)-NH-R^0$)；被二 R^0 基取代之醯胺基氧基($O-C(=O)-N(R^0)_2$)； R^0 基磺醯基氧基($O-S(=O)_2-R^0$)；羥基磺醯基氧基($O-S(=O)_2OH$)； R^0 基氧基磺醯基氧基($O-S(=O)_2OR^0$)；磺醯胺基氧基($O-S(=O)_2NH_2$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基氧基($O-S(=O)_2NHR^0$)；被二 R^0 基取代之磺醯胺基氧基($O-S(=O)_2N(R^0)_2$)；胺基；被一 R^0 基取代之胺基(NHR^0)；被二 R^0 基取代之胺基($N(R^0)_2$)；被一 R^0 酮基取代之胺基($NH-C(=O)-R^0$)；被一 R^0 羧酸酯基取代之胺基($NH-C(=O)-O-R^0$)；被一醯胺基取代之胺基($NH-C(=O)-NH_2$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基($NH-C(=O)-NH-R^0$)；被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基($NH-C(=O)-N(R^0)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基酮基取代之胺基($NR^0-C(=O)R^0$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基($NR^0-C(=O)-O-R^0$)；被一 R^0 基及一醯胺基取代之胺基($NR^0-C(=O)-NH_2$)；被一 R^0 基及一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基($NR^0-C(=O)-NH-R^0$)；被一 R^0 基及一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基($NR^0-C(=O)-N(R^0)_2$)；被一羥基磺醯基取代之胺基($NH-S(=O)_2OH$)；被一 R^0 基磺醯基取代之胺基($NH-S(=O)_2R^0$)；被一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基($NH-S(=O)_2OR^0$)；被一磺醯胺基取代之胺基($NH-S(=O)_2NH_2$)；被一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基($NH-S(=O)_2NHR^0$)；被一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基($NH-S(=O)_2N(R^0)_2$)；被一 R^0 基及一羥基磺醯基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2OH$)；被一 R^0 基及一 R^0 基磺醯基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2R^0$)；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2OR^0$)；被一 R^0 基及一磺醯胺基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2NH_2$)；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2NHR^0$)；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基

($\text{NR}^0\text{-S(=O)}_2\text{N(R}^0)_2$)；巯基； R^0 基硫基(SR^0)； R^0 基氧硫基(S(=O)R^0)； R^0 基磺基($\text{S(=O)}_2\text{R}^0$)；羧基磺基($\text{S(=O)}_2\text{OH}$)； R^0 基氧基磺基($\text{S(=O)}_2\text{OR}^0$)；磺基胺基($\text{S(=O)}_2\text{NH}_2$)；被一 R^0 基取代之磺基胺基($\text{S(=O)}_2\text{NHR}^0$)；被二 R^0 基取代之磺基胺基($\text{S(=O)}_2\text{N(R}^0)_2$)；

R^5 代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基；醛基； R^0 酮基；羧基； R^0 羧酸酯基；鹽胺基；被一 R^0 基取代之鹽胺基；被二 R^0 基取代之鹽胺基； R^0 基氧基； R^0 基羰氧基； R^0 基氧基羰氧基；被一 R^0 基取代之鹽胺基氧基；被二 R^0 基取代之鹽胺基氧基； R^0 基磺基氧基；羧基磺基氧基； R^0 基氧基磺基氧基；磺基胺基氧基；被一 R^0 基取代之磺基胺基氧基；被二 R^0 基取代之磺基胺基氧基；胺基；被一 R^0 基取代之胺基；被二 R^0 基取代之胺基；被一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基；被一鹽胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 酮基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 羧酸酯基取代之胺基；被一 R^0 基及一鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一羧基磺基取代之胺基；被一 R^0 基磺基取代之胺基；被一 R^0 基氧基磺基取代之胺基；被一磺基胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基磺基胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基磺基胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一羧基磺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基磺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺基取代之胺基；被一 R^0 基及一磺基胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺基胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺基胺基取代之胺基；巯基； R^0 基硫基； R^0 基氧硫基； R^0 基磺基；羧基磺基； R^0 基氧基磺基；磺基胺基；被一 R^0 基取代之磺基胺基；被二 R^0 基取代之磺基胺基；

R^6 代表 R^0 ；當 R^0 代表飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次之

雜環基，或代表未經取代或經取代一或數次之雜芳香基時，則該雜芳香基或雜環基之鍵結係經由該雜芳香基或雜環基上一碳原子達成；

R^7 代表 R^0 ；當 R^0 代表飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次之雜環基，或代表未經取代或經取代一或數次之雜芳香基時，則該雜芳香基或雜環基之鍵結係經由該雜芳香基或雜環基上一碳原子達成；

其中「烷基被取代」，「雜烷基被取代」，「雜環基被取代」及「環烷基被取代」係表示一或數個氫原子彼此各自無關地被氟；氯；溴；碘等原子；氰基；三氟甲基；橋氧基(=O)；亞胺基(=NH)；被二胺基取代之亞甲基(=C(NH₂)₂)；硝基； R^0 基；醛基； R^0 酮基；羧基； R^0 羧酸酯基；醯胺基；被一 R^0 基取代之醯胺基；被二 R^0 基取代之醯胺基；羥基； R^0 基氧基；氧基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(-O-(C₁₋₈-Alkyl)-O-)； R^0 基羰氧基； R^0 基氧基羰氧基；被一 R^0 基取代之醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之醯胺基氧基； R^0 基磺醯基氧基；羥基磺醯基氧基； R^0 基氧基磺醯基氧基；磺醯胺基氧基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；胺基；被一 R^0 基取代之胺基；被二 R^0 基取代之胺基；被一 R^0 酮基取代之胺基；被一 R^0 羧酸酯基取代之胺基；被一醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基；被一 R^0 基及一醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一磺醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺

醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；
 巯基； R^0 基硫基； R^0 基氧硫基； R^0 基磺醯基；氫代磺醯基($S(=O)_2H$)；
 羥基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基；磺醯胺基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基；
 被二 R^0 基取代之磺醯胺基；

其中「芳香基被取代」及「雜芳香基被取代」係表示一或數個氫原子
 彼此各自無關地被氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；
 R^0 基；醛基； R^0 酮基；羧基； R^0 羧酸酯基；醯胺基；被一 R^0 基取代
 之醯胺基；被二 R^0 基取代之醯胺基；羥基； R^0 基氧基；氧基含 1 至 8
 個碳原子之烷氧基($-O-(C_{1-8}-Alkyl)-O-$)； R^0 基羰氧基； R^0 基氧基羰氧
 基；被一 R^0 基取代之醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之醯胺基氧基； R^0
 基磺醯基氧基；羥基磺醯基氧基； R^0 基氧基磺醯基氧基；磺醯胺基氧
 基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；
 胺基；被一 R^0 基取代之胺基；被二 R^0 基取代之胺基；被一 R^0 酮基取
 代之胺基；被一 R^0 羧酸酯基取代之胺基；被一醯胺基取代之胺基；被
 一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；
 被一 R^0 基及一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基羧酸酯基取
 代之胺基；被一 R^0 基及一醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0
 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；
 被一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0
 基氧基磺醯基取代之胺基；被一磺醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基
 磺醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0
 基及一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基磺醯基取代之胺
 基；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一磺醯
 胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被
 一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；巯基； R^0 基硫基； R^0 基
 氧硫基； R^0 基磺醯基；羥基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基；磺醯胺基；被

一 R^0 基取代之磺醯胺基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基；

下列之化合物則為例外：

N-苯甲基-2-(3-氯-2-羥基丙基硫基)-4-(2,4-二氯苯基)喹啉-3-甲醯胺
(N-Benzyl-2-(3-chlor-2-hydroxypropylthio)-4-(2,4-dichlorophenyl)chinolin-3-carboxamid)；

其形式為自由之化合物或其與生理上可被接受之酸或鹼所形成之鹽類。

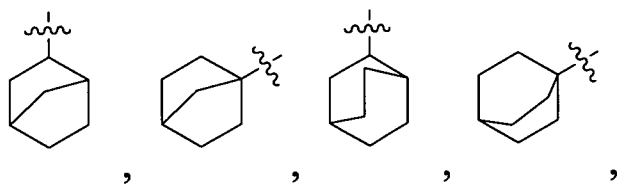
本發明中，「烷基」或「含 1 至 10 個碳原子之烷基」、「含 1 至 8 個碳原子之烷基」及「含 1 至 4 個碳原子之烷基」等名詞意指非環狀，飽和或不飽和之脂肪烴碳氫化合物殘基，其等可為分叉或未分叉，及未經取代或經一或數次取代，且含 1 至 10 個，或 1 至 8 個，或 1 至 4 個碳原子，亦即含 1 至 10 個碳原子之烷基(C_{1-10} -Alkanyle)、含 2 至 10 個碳原子之烯基(C_{2-10} -Alkenyle)及含 2 至 10 個碳原子之炔基(C_{2-10} -Alkinyle)或含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkanyle)、含 2 至 8 個碳原子之烯基(C_{2-8} -Alkenyle)及含 2 至 8 個碳原子之炔基(C_{2-8} -Alkinyle)或含 1 至 4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkanyle)、含 2 至 4 個碳原子之烯基(C_{2-4} -Alkenyle)及含 2 至 4 個碳原子之炔基(C_{2-4} -Alkinyle)。其中烯基至少含一碳-碳雙鍵，且炔基至少含一碳-碳三鍵。烷基較偏好由包含甲基、乙基、正丙基(n-Propyl)、2-丙基(2-Propyl)、正丁基(n-Butyl)、異丁基(iso-Butyl)、二級-丁基(sec.-Butyl)、三級-丁基(tert.-Butyl)、正戊基(n-Pentyl)、異戊基(iso-Pentyl)、新戊基(neo-Pentyl)、正己基(n-Hexyl)、正庚基(n-Heptyl)、正辛基(n-Octyl)、正壬基(n-Nonyl)、正癸基(n-Decyl)、乙烯基(Vinyl)、乙炔基、丙烯基 [丙-1-烯基($-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$)、丙-2-烯基($-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$)、異丙烯基($-\text{CH}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$)]、丙炔基(Propinyl)[丙-1-炔基($-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$)、丙-2-炔基($-\text{CHC}\equiv\text{CH}_2$)]、丁烯基、丁炔基、戊烯基、戊炔基、己烯基及己炔基、庚烯基、庚炔基、辛烯基、

辛炔基、壬烯基、壬炔基、癸烯基及癸炔基等殘基之組群所選出。

本發明中，「雜烷基」或「含 2 至 10 個碳原子之雜烷基」及「含 2 至 8 個碳原子之雜烷基」等名詞意指非環狀，脂肪烴飽和或不飽和之碳氫化合物殘基，其等含 2 至 10 個碳原子，亦即含 2 至 10 個碳原子之雜烷基 (C₂₋₁₀-Heteroalkanyl)、含 2 至 10 個碳原子之雜烯基 (C₂₋₁₀-Heteroalkenyl) 及含 2 至 10 個碳原子之雜炔基 (C₂₋₁₀-Heteroalkinyl)，或含 2 至 8 個碳原子，亦即含 2 至 8 個碳原子之雜烷基 (C₂₋₈-Heteroalkanyl)、含 2 至 8 個碳原子之雜烯基 (C₂₋₈-Heteroalkenyl) 及含 2 至 8 個碳原子之雜炔基 (C₂₋₈-Heteroalkinyl)，且其等可各自為分叉或未分叉，及未經取代或經一或數次取代，且其中至少有一，必要時亦可有二或三個碳原子被一雜原子或一雜原子團基，其等彼此各自無關地由氧原子、硫原子、氧硫基、磺基、氮原子、亞胺基及被含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之亞胺基(N(C₁₋₈-Alkyl))，尤其係甲基亞胺基(N(CH₃))等構成之組群所選出，所取代，其中一含 2 至 10 個碳原子之雜烷基(C₂₋₁₀-Heteroalkyl)或一含 2 至 8 個碳原子之雜烷基(C₂₋₈-Heteroalkyl)之起端固定不變之碳原子，經由該碳原子使該含 2 至 10 個碳原子之雜烷基或該含 2 至 8 個碳原子之雜烷基得以和每種主要之通式相鍵結，不會被一雜原子或一雜原子團基所取代，且彼此相鄰之碳原子亦不會同時被一雜原子或一雜原子團基所取代。必要時，該雜烷基之雜原子團基，亞胺基及被含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之亞胺基(N(C₁₋₈-Alkyl))，可被取代一或數次。含 2 至 10 個碳原子之雜烯基(C₂₋₁₀-Heteroalkenyl)或一含 2 至 8 個碳原子之雜烯基(C₂₋₈-Heteroalkenyl)至少具一碳-碳雙鍵及一碳-氮雙鍵，且含 2 至 10 個碳原子之雜炔基(C₂₋₁₀-Heteroalkinyl)或一含 2 至 8 個碳原子之雜炔基(C₂₋₈-Heteroalkinyl)至少具一碳-碳三鍵。雜烷基較偏好由包含甲氧基甲基(-CH₂-O-CH₃)、甲氧基乙基(-CH₂-CH₂-O-CH₃)、

乙氧基乙基 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、甲氧基乙氧基乙基
 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$)、甲氧基乙烯基 ($-\text{CH}=\text{CH}-\text{O}-\text{CH}_3$)、乙氧
 基乙烯基 ($-\text{CH}=\text{CH}-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、甲氧基亞甲基 ($=\text{CH}-\text{O}-\text{CH}_3$)、乙氧基
 亞甲基 ($=\text{CH}-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、乙氧基甲基亞甲基 ($=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、
 甲氧基甲基亞甲基 ($=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$)、甲胺基甲基 ($-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_3$)、甲
 胺基乙基 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_3$)、乙胺基乙基 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、
 甲胺基乙基胺基乙基 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_3$)、甲胺基乙烯基
 ($-\text{CH}=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_3$)、乙胺基乙烯基 ($-\text{CH}=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、(甲基)(乙
 基)胺基乙烯基 ($-\text{CH}=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、甲胺基亞甲基
 ($=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_3$)、乙胺基亞甲基 ($=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、乙胺基甲基亞甲
 基 ($=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、甲胺基甲基亞甲基 ($=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_3$)、
 二甲胺基甲基 ($-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$)、二甲胺基乙基
 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$)、(甲基)(乙基)胺基乙基
 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、二甲胺基(甲基)(乙基)胺基乙基
 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$)、甲氧基乙胺基乙基
 ($\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$)、甲胺基乙氧基乙基
 ($\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_3$)、甲氧基(甲基)(乙基)胺基乙基
 ($\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$)、甲氧基甲胺基甲基
 ($\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$)、甲胺基甲氧基甲基 ($-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_3$)、甲
 氧基二甲胺基甲基 ($-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$)、二甲胺基甲氧基甲基
 ($-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$)、二甲胺基乙烯基 ($-\text{CH}=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$)、
 二甲胺基亞甲基 ($=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$)、(甲基)(乙基)胺基亞甲基
 ($=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、(甲基)(乙基)胺基甲基亞甲基
 ($=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$)、二甲胺基甲基亞甲基
 ($=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$)、亞甲胺基乙基 ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2=\text{N}(\text{CH}_3)$)及亞甲胺
 基甲基 ($-\text{CH}_2=\text{N}(\text{CH}_3)$)等殘基之組群所選出。

就本發明之用途而言，「環烷基」或「含 3 至 10 個碳原子之環烷基」係指含 3、4、5、6、7、8、9 或 10 個碳原子之環狀脂肪烴碳氫化合物，其中該等碳氫化合物為飽和或不飽和(但非芳香烴)，未經取代或經取代一或數次。該環烷基與每種主要通式之鍵結可經由該環烷基殘基上每個任意及可能之環元達成。且該環烷基殘基亦可與其他之飽和，(部份)不飽和，(雜)環，芳香烴或雜芳香烴之環系統，亦即與環烷基、雜環烷基、芳香基或雜芳香基，其等又可為未經取代或經取代一或數次，縮合成一環系統。該等環烷基殘基又可被鍵結一或數次，例如範例金剛烷基、雙環 [2.2.1] 庚基 (Bicyclo[2.2.1]heptyl) 或雙環 [2.2.2] 辛基 (Bicyclo[2.2.2]octyl)。環烷基較偏好由包含環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、環壬基、環癸基、金剛烷基、



環戊烯基、環己烯基、環庚烯基及環辛烯基等殘基構成之組群所選出。

「雜環基」或「雜環烷基」該辭之概念係包含脂肪烴之飽和或不飽和(但非芳香烴)，含 3 至 10 個，亦即 3、4、5、6、7、8、9 或 10 個環元之環烷基，其中至少有一，必要時亦可二或三個碳原子被一雜原子或一雜原子團基，其等彼此各自無關地由氧、硫、氮等原子、亞胺基及被含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之亞胺基(N(C₁₋₈-Alkyl))，尤其係亞甲胺基等構成之組群所選出，所取代，其中該等環元可為未經取代或經取代一或數次。該雜環基與主要通式之鍵結可經由該雜環基殘基上每個任意及可能之環元達成。且該雜環基殘基亦可與其他之飽和，(部份)不飽和，(雜)環或芳香烴或雜芳香烴之環系統，亦即與環烷基、雜環基、芳香基或雜芳香基，其等又可為未經取代或經取代一或數次，縮合成一環系統。雜環基殘基較偏好由包含氮雜環丁基、氮丙

啖基、氮雜環庚基、氮雜環辛基、二氮雜環庚基、二硫雜環戊基、二氮喹啉基、二氮吡咯基、二氧環己基、二氧環戊基、二氮茛基、二氮吡啖基、二氮呋喃基、二氮異喹啉基、二氮吲哚基、二氮異吲哚基、咪唑烷基、異噁唑烷基、嗎啉基、環氧乙烷基、環氧丙烷、吡咯烷基、哌嗪基、哌啖基、吡唑烷基、吡喃基、四氮吡咯基、四氮吡喃基、四氮喹啉基、四氮異喹啉基、四氮吲哚基、四氮呋喃基、四氮吡啖基、四氮噻吩基、四氮吡啖吲哚基、四氮萘基、四氮吡啉基、四氮異噁唑吡啖基、噻唑烷基及硫代嗎啉基等殘基構成之組群所選出。

本發明中，「芳香基」該名詞意指含達到 14 個環元之芳香烴碳氫化合物，尤其係苯及萘類之化合物。每種芳香基殘基可未經取代或經取代一或數次之形式存在，其中該等芳香基取代基可相同或不同，且可出現於該芳香環每個任意且可能之位置上。該芳香環與主要通式之鍵結可經由該芳香基殘基上每個任意及可能之環元達成。且該芳香基殘基亦可與其他之飽和，(部份)不飽和，(雜)環，芳香烴或雜芳香烴之環系統，亦即與環烷基、雜環基、芳香基或雜芳香基，其等又可為未經取代或經取代一或數次，縮合成一環系統。經縮合後之芳香基殘基之範例有苯並二氧環戊基及苯並二氧環己基。芳香基較偏好由含苯基、1-萘基及 2-萘基等構成之組群所選出，其等可各自為未經取代或經取代一或數次。苯係其中一較受偏好之芳香基，其為未經取代或經取代一或數次。

「雜芳香基」該名詞之概念表示一含 5 或 6 個環元之環狀芳香烴殘基，其含至少一，必要時亦可含 2、3、4 或 5 個雜原子，其中該等雜原子彼此各自無關地由硫、氮及氧等原子構成之組群所選出，且該雜芳香基殘基可為未經取代或經取代一或數次。當該雜芳香基上進行取代時，取代基可相同或不同，且可出現於該雜芳香環每個任意且可能之位置上。而與主要通式之鍵結可經由該雜芳香基殘基上每個任意

及可能之環元達成。該雜芳香基亦可為一雙環或含達到 14 個環元之多環系統之其中部份，其中該環系統可與其他之飽和，(部份)不飽和，(雜)環，芳香烴或雜芳香烴之環系統，亦即與環烷基、雜環基、芳香基或雜芳香基，其等又可為未經取代或經取代一或數次，所形成。雜芳香基殘基較偏好由含苯並呋喃基、苯並咪唑基、苯並噻吩基、苯並噻二唑基、苯並噻唑基、苯並三唑基、苯並噁唑基、苯並噁二唑基、喹唑啉基、喹噁啉基、呋唑基、喹啉基、二苯並呋喃基、二苯並噻吩基、呋喃基(Furanyl)、咪唑基、咪唑並噻唑基、吲唑基、氮茛基、吲哚基、異喹啉基、異噁唑基、異噻唑基、吲哚基、茶啞基、噁唑基、噁二唑基、吩嗪基、吩噻嗪基、苯並噻嗪基、吡嗪基、吡啞基[2-吡啞基、3-吡啞基、4-吡啞基]、吡咯基、噻嗪基、嘧啞基、吡嗪基、嘌呤基、吩嗪基、噻吩基(Thiophenyl)、三唑基、四唑基、噻唑基、噻二唑基及三嗪基等殘基構成之組群所選出。特別偏好為呋喃基、吡啞基及噻吩基。

本發明中，關於「經由含 1 至 4 個碳原子之烷基或含 1 至 8 個碳原子之烷基所鍵結之芳香基、雜芳香基、雜環基或環烷基」等術語之概念意指含 1 至 4 個碳原子之烷基或含 1 至 8 個碳原子之烷基及芳香基、或雜芳香基、或雜環基、或環烷基皆具上文所定義之義涵，且該芳香基、或雜芳香基、或雜環基、或環烷基殘基係經由一含 1 至 4 個碳原子之烷基或含 1 至 8 個碳原子之烷基與每種主要之通式結構產生鍵結。該烷基鏈始終為飽和或不飽和、分叉或未分叉、未經取代或經取代一或數次。1 至 4 個碳原子之烷基或含 1 至 8 個碳原子之烷基主要係由包含亞甲基(-CH₂-)、1,2-亞乙基(-CH₂-CH₂-)、甲基亞甲基(-CH(CH₃)-)、1,3-亞丙基(-CH₂-CH₂-CH₂-)、甲基-1,2-亞乙基(-CH(CH₃)-CH₂-)、乙基亞甲基(-CH(CH₂CH₃)-)、1,4-亞丁基(-CH₂-(CH₂)₂-CH₂-)、1-甲基-1,3-亞丙基(-CH(CH₃)-CH₂-CH₂-)、2-甲基-1,3-亞丙基(-CH₂-CH(CH₃)-CH₂-)、1,2-二甲基-1,2-亞乙基

$(-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)-)$ 、乙基-1,2-亞乙基 $(-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、1,2-亞異丁基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-)$ 、丙基亞甲基 $(-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)-)$ 、1-甲基-1-乙基亞甲基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)-)$ 、1,5-亞戊基 $(-\text{CH}_2-(\text{CH}_2)_3-\text{CH}_2-)$ 、1-甲基-1,4-亞丁基 $(-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、2-甲基-1,4-亞丁基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、1,3-二甲基-1,3-亞丙基 $(-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-)$ 、1,2-二甲基-1,3-亞丙基 $(-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、1,3-亞異戊基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、2,2-二甲基-1,3-亞丙基 $(-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-)$ 、1-乙基-1,3-亞丙基 $(-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、2-乙基-1,3-亞丙基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、甲基亞異丁基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-)$ 、1-乙基-2-甲基-1,2-亞乙基 $(-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)-)$ 、1-甲基-1-乙基-1,2-亞乙基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、1-丙基-1,2-亞乙基 $(-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、1-丙基-1,2-亞乙基 $(-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、丁基亞甲基 $(-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)-)$ 、甲基丙基亞甲基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)-)$ 、二乙基亞甲基 $(-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2-)$ 、1,6-亞己基 $(-\text{CH}_2-(\text{CH}_2)_4-\text{CH}_2-)$ 、1,2-亞乙烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}-)$ 、1,3-亞丙烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-)$ 、1-甲基-1,2-亞乙烯基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2-)$ 、1,4-亞丁-1-烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、1,4-亞丁-2-烯基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-)$ 、1,4-亞丁-1,3-二烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-)$ 、1-甲基-1,3-亞丙烯基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_2-)$ 、2-甲基-1,3-亞丙烯基 $(-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、1,2-二甲基-1,2-亞乙烯基 $(-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)-)$ 、1-乙基-1,3-亞乙烯基 $(-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{CH}-)$ 、1,5-亞戊-1-烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、1,5-亞戊-2-烯基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、1,5-亞戊-1,2-二烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 及1,5-亞戊-1,4-二烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}_2-)$ 、1,2-亞乙炔基 $(-\text{C}\equiv\text{C}-)$ 、1,3-亞丙炔基 $(-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-)$ 、1,4-亞丁-1-炔基 $(-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、3-甲基-1,3-亞丙炔基 $(-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}(\text{CH}_3)-)$ 、1,4-亞丁-2-炔基 $(-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-)$ 、亞丁-1,3-二

炔基(-C≡C-C≡C-)、1,3-亞異戊炔基(-C≡C-C(CH₃)₂-)、1,5-亞戊-1-炔基(-C≡C-CH₂-CH₂-CH₂-)、1,5-亞戊-2-炔基(-CH₂-C≡C-CH₂-CH₂-)、1,5-亞戊-1,3-二炔基(-C≡C-C≡C-CH₂-)及1,5-亞戊-1,4-二炔基(-C≡C-CH₂-C≡C-)等構成之組群所選出。

本發明中，關於「經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基、雜芳香基、雜環基或環烷基」等術語之概念意指含 2 至 8 個碳原子之雜烷基及芳香基、或雜芳香基、或雜環基、或環烷基皆具上文中所定義之義涵，且該芳香基、或雜芳香基、或雜環基、或環烷基殘基係經由一含 2 至 8 個碳原子之雜烷基與每種主要之通式結構產生鍵結。該雜烷基鏈始終為飽和或不飽和、分叉或未分叉、未經取代或經取代一或數次。若該含 2 至 8 個碳原子之雜烷基其終端固定不變之碳原子被一被一雜原子或一雜原子團基取代時，一雜芳香基或一雜環基與該含 2 至 8 個碳原子之雜烷基之雜原子或雜原子團基之鍵結則總經由該雜芳香基或雜環基之一碳原子達成。而終端固定不變之碳原子係指該含 2 至 8 個碳原子之雜烷基內之該碳原子，其於該碳鏈之內與各通式主要之結構距離最遠。若該含 2 至 8 個碳原子之雜烷基其終端固定不變之碳原子被一亞甲胺基(N(CH₃)-)取代時，則該殘基於該含 2 至 8 個碳原子之雜烷基之內與該通式主要之結構距離最遠，並與芳香基、或雜芳香基、或雜環基、或環烷基殘基相連結。含 2 至 8 個碳原子之雜烷基主要係由包含亞胺基甲基(-CH₂-NH-)、亞甲胺基甲基(-CH₂-N(CH₃)-)、氧基甲基(-CH₂-O-)、亞胺基乙基(-CH₂-CH₂-NH-)、亞甲胺基乙基(-CH₂-CH₂-N(CH₃)-)、氧基乙基(-CH₂-CH₂-O-)、亞胺基丙基(-CH₂-CH₂-CH₂-NH-)、亞甲胺基丙基(-CH₂-CH₂-CH₂-N(CH₃)-)、氧基丙基(-CH₂-CH₂-CH₂-O-)、亞甲氧基甲基(-CH₂-O-CH₂-)、亞甲氧基乙基(-CH₂-CH₂-O-CH₂-)、亞乙氧基乙基(-CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-)、亞甲氧基亞乙基(-CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-O-CH₂-)、亞甲氧基亞乙烯基

$(-\text{CH}=\text{CH}-\text{O}-\text{CH}_2-)$ 、亞乙氧基乙烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、亞甲氧基
 亞甲基 $(=\text{CH}-\text{O}-\text{CH}_2-)$ 、亞乙氧基亞甲基 $(=\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、亞乙氧基
 甲基亞甲基 $(=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、亞甲氧基甲基亞甲基
 $(=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-)$ 、亞甲基胺基甲基 $(-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、亞甲基胺基乙
 基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、亞乙基胺基乙基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、
 亞甲基胺基乙胺基乙基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、亞甲基胺
 基乙烯基 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、亞乙基胺基乙烯基
 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、(亞乙基)(甲基)胺基乙烯基
 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、亞甲基胺基亞甲基 $(=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、亞
 乙基胺基甲基亞甲基 $(=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、亞乙基胺基亞甲基
 $(=\text{CH}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、亞甲基胺基甲基亞甲基 $(=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、(亞
 甲基)(甲基)胺基甲基 $(-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、(亞甲基)(甲基)胺基乙基
 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、(亞乙基)(甲基)胺基乙基
 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、(亞甲基)(甲基)胺基(乙基)(甲基)胺基乙
 基 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、亞甲氧基乙胺基乙基
 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-)$ 、亞甲基胺基亞乙氧基乙基
 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、亞甲氧基(乙基)(甲基)胺基乙基
 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-)$ 、(亞甲基)(甲基)胺基乙氧基乙基
 $(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、亞甲氧基甲胺基甲基
 $(-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-)$ 、亞甲基胺基甲氧基甲基
 $(-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-)$ 、亞甲氧基二甲胺基甲基
 $(-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-)$ 、(亞甲基)(甲基)胺基甲氧基甲基
 $(-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、(亞甲基)(甲基)胺基乙烯基
 $(-\text{CH}=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、(亞甲基)(甲基)胺基亞甲基
 $(=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-)$ 、(亞乙基)(甲基)胺基亞甲基
 $(=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-)$ 、(亞乙基)(甲基)胺基甲基亞甲基

(=CH-CH₂-N(CH₃)-CH₂-CH₂-)、(亞甲基)(甲基)胺基甲基亞甲基(=CH-CH₂-N(CH₃)-CH₂-)、硫基甲基(-CH₂-S-)、硫基乙基(-CH₂-CH₂-S-)、硫基丙基(-CH₂-CH₂-CH₂-S-)、硫基丁基(-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-S-)、磺醯基甲基(-CH₂-S(=O)₂-)、磺醯基乙基(-CH₂-CH₂-S(=O)₂-)、磺醯基丙基(-CH₂-CH₂-CH₂-S(=O)₂-)及磺醯基丁基(-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-S(=O)₂-)等構成之組群所選出。

本發明中，關於「烷基」、「雜烷基」、「雜環基」及「環烷基」之「被取代一或數次」該辭之概念意指一或數個氫原子彼此各自無關地被由氟；氯；溴；碘等原子；氰基；三氟甲基；橋氧基；亞胺基；二胺基亞甲基；硝基；R⁰基；醛基；R⁰酮基；羧基；R⁰羧酸酯基；醯胺基；被一R⁰基取代之醯胺基；被二R⁰基取代之醯胺基；羰基；R⁰基氧基；氧基含1至8個碳原子之烷氧基(-O-(C₁₋₈-Alkyl)-O-)；R⁰基羰氧基；R⁰基氧基羰氧基；被一R⁰基取代之醯胺基氧基；被二R⁰基取代之醯胺基氧基；R⁰基磺醯基氧基；羰基磺醯基氧基；R⁰基氧基磺醯基氧基；磺醯胺基氧基；被一R⁰基取代之磺醯胺基氧基；被二R⁰基取代之磺醯胺基氧基；胺基；被一R⁰基取代之胺基；被二R⁰基取代之胺基；被一R⁰酮基取代之胺基；被一R⁰羧酸酯基取代之胺基；被一醯胺基取代之胺基；被一含一R⁰基醯胺基取代之胺基；被一含二R⁰基醯胺基取代之胺基；被一R⁰基及一R⁰基酮基取代之胺基；被一R⁰基及一R⁰基羧酸酯基取代之胺基；被一R⁰基及一醯胺基取代之胺基；被一R⁰基及一含一R⁰基醯胺基取代之胺基；被一R⁰基及一含二R⁰基醯胺基取代之胺基；被一羰基磺醯基取代之胺基；被一R⁰基磺醯基取代之胺基；被一R⁰基氧基磺醯基取代之胺基；被一磺醯胺基取代之胺基；被一含一R⁰基磺醯胺基取代之胺基；被一含二R⁰基磺醯胺基取代之胺基；被一R⁰基及一羰基磺醯基取代之胺基；被一R⁰基及一R⁰基磺醯基取代之胺基；被一R⁰基及一R⁰基氧基磺醯基取代之胺

基；被一 R^0 基及一磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；巯基； R^0 基硫基； R^0 基氧硫基； R^0 基磺醯基；羥基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基；磺醯胺基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基等構成之組群所選出之取代基取代一或數次，例如二、三或四次，其中經數次取代之殘基係指該等殘基，其等於不同或相同之原子上被取代數次，例如二、三或四次，例如於相同之碳原子上取代三次，範例如三氟甲基或 2,2,2-三氟乙基(CH_2CF_3)或於不同之位置上，如範例 1-羥基-4,4-二氯-丁-2-烯基($CH(OH)-CH=CH-CHCl_2$)。任一取代基必要時又可被取代一或數次。該種數次之取代可由相同或由不同之取代基完成。

較受偏好之「烷基」、「雜烷基」、「雜環基」及「環烷基」取代基係由氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；橋氧基；亞胺基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($C(=O)(R^0 \text{ 或 } H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基($C(=O)O(R^0 \text{ 或 } H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($C(=O)N(R^0 \text{ 或 } H)_2$)；羥基； R^0 基氧基； R^0 基羰氧基；羥基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-OH$)；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)；三氟甲氧基；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($N(R^0 \text{ 或 } H)_2$)；被一 R^0 基酮基取代之 R^0 基胺基或被一 R^0 基酮基取代之胺基($N(R^0 \text{ 或 } H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($N(R^0 \text{ 或 } H)-C(=O)-N(R^0 \text{ 或 } H)_2$)；巯基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2-O(R^0 \text{ 或 } H)$)及被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之

磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0 \text{ 或 } H)_2$)等構成之組群所選出。

尤其受偏好之「烷基」、「雜烷基」、「雜環基」及「環烷基」取代基係由氟、氯、溴、碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；橋氧基；含 1 至 8 個碳原子之烷基；含 2 至 8 個碳原子之雜烷基 (C_{2-8} -Heteroalkyl)；芳香基；雜芳香基；含 3 至 10 個碳原子之環烷基 (C_{3-10} -Cycloalkyl)；雜環基；經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基、雜芳香基、含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基；醛基；含 1 至 8 個碳原子之烷基羰基 ($C(=O)C_{1-8}$ -Alkyl)；芳香基羰基；雜芳香基羰基；羧基；含 1 至 8 個碳原子之烷基羧酸酯基 ($C(=O)O-C_{1-8}$ -Alkyl)；芳香基羧酸酯基；雜芳香基羧酸酯基；醯胺基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基 ($C(=O)NH-C_{1-8}$ -Alkyl)；被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基 ($C(=O)N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)；被一芳香基取代之醯胺基；被二芳香基取代之醯胺基；被一雜芳香基取代之醯胺基；被二雜芳香基取代之醯胺基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一芳香基取代之醯胺基 ($C(=O)N(C_{1-8}-Alkyl)(Aryl)$)；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一雜芳香基取代之醯胺基 ($C(=O)N(C_{1-8}-Alkyl)(Heteroaryl)$)；被一雜芳香基及一芳香基取代之醯胺基；羥基；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($O-C_{1-8}$ -Alkyl)；三氟甲氧基；羥基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($O-(C_{1-8}-Alkyl)-OH$)；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($-O-(C_{1-8}-Alkyl)-O-C_{1-8}-Alkyl$)；苯甲基氧基；芳香基氧基；雜芳香基氧基；含 1 至 8 個碳原子之烷基羰氧基 ($O-C(=O)C_{1-8}-Alkyl$)；芳香基羰氧基；雜芳香基羰氧基；胺基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($NH-C_{1-8}-Alkyl$)；被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)；被一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基 ($NH-C(=O)C_{1-8}-Alkyl$)；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個

碳原子之烷羰基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})\text{-C(=O)}\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)；被二含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基($\text{N}(\text{C(=O)}\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)；被一芳香基羰基取代之胺基(NH-C(=O)-Aryl)；被一雜芳香基羰基取代之胺基($\text{NH-C(=O)-Heteroaryl}$)；巯基；含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)；三氟甲硫基；苯甲基硫基；芳香基硫基；雜芳香基硫基；含 1 至 8 個碳原子之烷基磺醯基($\text{S(=O)}_2\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)；芳香基磺醯基；雜芳香基磺醯基；羥基磺醯基；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基磺醯基($\text{S(=O)}_2\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)；芳香基氧基磺醯基；雜芳香基氧基磺醯基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之磺醯胺基($\text{S(=O)}_2\text{-NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)；被一芳香基取代之磺醯胺基及被一含 1 至 8 個碳原子之雜芳香基取代之磺醯胺基($\text{S(=O)}_2\text{-NH-C}_{1-8}\text{-Heteroaryl}$)等殘基構成之組群所選出。

本發明中，關於「芳香基」及「雜芳香基」之「被取代一或數次」該辭之概念意指該環系統於一或必要時不同之原子上之一或數個氫原子彼此各自無關地被由氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基；醛基； R^0 基酮基；羧基； R^0 羧酸酯基；醯胺基；被一 R^0 基取代之醯胺基；被二 R^0 基取代之醯胺基；羥基； R^0 基氧基； R^0 基羰氧基； R^0 基氧基羰氧基；被一 R^0 基取代之醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之醯胺基氧基； R^0 基磺醯基氧基；羥基磺醯基氧基； R^0 基氧基磺醯基氧基；磺醯胺基氧基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；胺基；被一 R^0 基取代之胺基；被二 R^0 基取代之胺基；被一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 羧酸酯基取代之胺基；被一醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基；被一 R^0 基及一醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基磺醯

基取代之胺基；被一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一磺醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；巯基； R^0 基硫基； R^0 基氧硫基； R^0 基磺醯基；羥基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基；磺醯胺基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基等構成之組群所選出之取代基取代一或數次，例如二、三或四次，其中任一取代基必要時又可被取代一或數次。該種數次之取代可由相同或由不同之取代基完成。

較受偏好之「芳香基」及「雜芳香基」取代基係由氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($C(=O)(R^0$ 或 $H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基 ($C(=O)O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($C(=O)N(R^0$ 或 $H)_2$)；羥基； R^0 基氧基； R^0 基羰氧基；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($-O-(C_{1-8}-Alkyl)-O-C_{1-8}-Alkyl$)；三氟甲氧基；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基酮基取代之 R^0 基胺基或被一 R^0 基酮基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-N(R^0$ 或 $H)_2$)；巯基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2-O(R^0$ 或 $H)$)及被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0$ 或 $H)_2$)等構成之組群所選出。

尤其受偏好之「芳香基」及「雜芳香基」取代基係由氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)；或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基(C₂₋₈-Heteroalkyl)；芳香基；雜芳香基；含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C₃₋₁₀-Cycloalkyl)；雜環基；經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基、雜芳香基、含 3 至 10 個碳原子之環烷基、雜環基；醛基；含 1 至 8 個碳原子之烷基羰基(C(=O)C₁₋₈-Alkyl)；芳香基羰基；雜芳香基羰基；羧基；含 1 至 8 個碳原子之烷基羧酸酯基(C(=O)O-C₁₋₈-Alkyl)；芳香基羧酸酯基；雜芳香基羧酸酯基；醯胺基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基(C(=O)NH-C₁₋₈-Alkyl)；被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基(C(=O)N(C₁₋₈-Alkyl)₂)；被一芳香基取代之醯胺基；被二芳香基取代之醯胺基；被一雜芳香基取代之醯胺基；被二雜芳香基取代之醯胺基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一芳香基取代之醯胺基(C(=O)N(C₁₋₈-Alkyl)(Aryl))；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一雜芳香基取代之醯胺基(C(=O)N(C₁₋₈-Alkyl)(Heteroaryl))；被一雜芳香基及一芳香基取代之醯胺基；羥基；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)；三氟甲氧基；羥基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-(C₁₋₈-Alkyl)-OH)；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(-O-(C₁₋₈-Alkyl)-O-C₁₋₈-Alkyl)；苯甲基氧基；芳香基氧基；雜芳香基氧基；含 1 至 8 個碳原子之烷基羰氧基(O-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)；芳香基羰氧；雜芳香基羰氧基；胺基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₈-Alkyl)；被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)；被一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(NH-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)；被二含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(N(C(=O)C₁₋₈-Alkyl)₂)；被一芳香基

羰基取代之胺基；被一雜芳香基羰基取代之胺基；巯基；含 1 至 8 個碳原子之烷基硫基($S-C_{1-8}-Alkyl$)；三氟甲硫基；苯甲基硫基；芳香基硫基；雜芳香基硫基；含 1 至 8 個碳原子之烷基磺醯基($S(=O)_2C_{1-8}-Alkyl$)；芳香基磺醯基；雜芳香基磺醯基；羥基磺醯基；含 1 至 8 個碳原子之烷基氧基磺醯基($S(=O)_2O-C_{1-8}-Alkyl$)；芳香基氧基磺醯基；雜芳香基氧基磺醯基；被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之磺醯胺基($S(=O)_2-NH-C_{1-8}-Alkyl$)；被一芳香基取代之磺醯胺基及被一含 1 至 8 個碳原子之雜芳香基取代之磺醯胺基($S(=O)_2-NH-C_{1-8}-Heteroaryl$)等殘基構成之組群所選出。

根據本發明之諸化合物係由取代基，例如由 R^1 、 R^2 及 R^3 (第一代取代基)所定義，其等本身必要時被取代(第二代取代基)。該等取代基之取代基本身可依據定義再度被取代(第三代取代基)。例如若 $R^3 = R^0$ 基，其中 R^0 = 芳香基(第一代取代基)時，則芳香基本身可被取代，例如被含 1 個 R^0 基之胺基所取代，其中 R^0 = 含 1 至 10 個碳原子之烷基(第二代取代基)。故由此產生含 1 至 10 個碳原子之烷基-胺基-芳香基($Aryl-NHC_{1-10}-Alkyl$)官能基。該含 1 至 10 個碳原子之烷基本身然後又可再度被取代，例如被氯原子(第三代取代基)所取代。最後共由此產生氯-含 1 至 10 個碳原子之烷基-胺基-芳香基($Aryl-NHC_{1-10}-Alkyl-Cl$)官能基。

一較受偏好之實施例中，第三代之取代基無法再度被取代，亦即於其後無第四代取代基。

另一較受偏好之實施例中，第二代之取代基無法再度被取代，亦即於其後已無第三代取代基。易言之，於此實施例中例如通式(1)，官能基 R^0 至 R^7 可各自必要時被取代，而該等個別之取代基本身則無法再度被取代。

若某一殘基於一分子內出現數次時，例如殘基 R^0 基，則該殘基可

代表各種取代基，其等各自具不同之義涵：例如若 $R^1 = R^0$ 且 $R^2 = R^0$ 時，則 R^0 可代表 R^1 =芳香基，且 R^0 可代表 R^2 = 含 1 至 10 個碳原子之烷基。

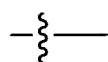
某些情形中，根據本發明之化合物係由取代基所定義，該等取代基代表或攜帶一芳香基殘基或雜芳香基殘基，其等各自為未經取代或經取代一或數次，或該等取代基及與該等取代基鍵結之環元碳原子或雜原子形成一環結構，例如一芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或經取代一或數次。此等芳香基殘基或雜芳香基殘基以及該等由是方式所形成芳香烴環系統必要時可與含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，亦即與一含 3 至 10 個碳原子之環烷基，例如環戊基或與一雜環基，例如嗎啉基，縮合成一環系統，其中由是縮合而成之 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基本身各自可為未經取代或經取代一或數次。

某些情形中，根據本發明之化合物係由取代基所定義，該等取代基代表或攜帶一含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等各自為未經取代或經取代一或數次，或該等取代基及與該等取代基鍵結之環元碳原子或雜原子形成一環結構，例如一含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等各自為未經取代或經取代一或數次。此等含 3 至 10 個碳原子之環烷基殘基或雜環基殘基以及該等生成之芳香烴環系統必要時可與芳香基或雜芳香基，亦即與一芳香基，例如苯基或與一雜芳香基，例如吡啶基，縮合成一環系統，其中由是縮合而成之芳香基殘基或雜芳香基殘基本身各自可為未經取代或經取代一或數次。

某些情形中，根據本發明之化合物係由殘基所定義，於該等殘基之中以通則性之表述語(「取代基 1」或「取代基 2」或「取代基 3」) 列舉二取代基。該表述語表示於一如此類殘基內之「取代基 1」及「取代基 2」及「取代基 3」能以任何可能之組合出現。因此，例如該表述

語於一殘基內之「(R⁰ 或 H)」表示於此殘基內之 R⁰ 及 H 能以任何可能之組合出現。因此，例如殘基「N(R⁰ 或 H)₂」可代表「胺基」、「被一 R⁰ 基取代之胺基」及「被二 R⁰ 基取代之胺基」。若如範例「(N(R⁰)₂)」中之 R⁰ 基於一殘基內出現數次時，則該 R⁰ 基可各自具相同或不同之義涵：於本範例「(N(R⁰)₂)」中，R⁰ 基例如可二者皆代表芳香基，如此便產生「被二芳香基取代之胺基」之官能基，或 R⁰ 基可一代表芳香基，而另一代表含 1 至 10 個碳原子之烷基，於是產生「被一芳香基及一含 1 至 10 個碳原子之烷基取代之胺基(N(Aryl)(C₁₋₁₀-Alkyl))」之官能基。

本發明中，使用於通式中之符號



係表示一相應之殘基被連結至個別主要之通式上。

本發明中，「由生理學上可接受之酸所生成之鹽類」該術語之概念被理解為每種活性主成份與生理學上，尤其係被使用於人類及/或哺乳動物上可被接受之無機酸或有機酸所形成之鹽類。尤其受偏好者為氫氯酸鹽。於生理上可被接受之酸類其範例為氫氯酸(鹽酸)、氫溴酸、硫酸、甲烷磺酸、甲酸、醋酸、草酸、丁二酸、酒石酸、杏仁酸、反丁烯二酸、順丁烯二酸、乳酸、檸檬酸、麩氨酸、葡萄糖二酸、單甲基癸二酸、5-氧-脯氨酸、己烷-1-磺酸、菸鹼酸、2-,3-或 4-胺基苯甲酸、2,4,6-三甲基苯甲酸、α-硫辛酸、乙醯甘氨酸、馬尿酸、磷酸及/或天冬氨酸。其中又以檸檬酸及氫氯酸特別受到偏好。

生理上可被接受含陽離子或鹼之鹽類為每種化合物，其以陰離子之形式與至少一，主要為無機，生理學上，尤其係被使用於人類及/或哺乳動物上可被接受之陽離子所形成之鹽類。其中較受偏好者為鹼金屬及鹼土族金屬之鹽類，但亦包含銨鹽，尤其係(單)或(二)鈉鹽、(單)或(二)鉀、鎂或鈣等鹽類。

根據本發明諸化合物一較受偏好之實施例中，R¹、R²、R³ 及 R⁴

等取代基彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($C(=O)(R^0$ 或 $H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基($C(=O)O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($C(=O)N(R^0$ 或 $H)_2$)；羥基； R^0 基氧基；羥基-含1至8個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-OH$)；含1至8個碳原子之烷氧基-含1至8個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)；三氟甲氧基； R^0 基羰氧基；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羰基取代之胺基、或被一 R^0 基羰基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-N(R^0$ 或 $H)_2$)；巰基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2O(R^0$ 或 $H)$)；及被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0$ 或 $H)_2$)等構成之組群所選出。

較偏好者為 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 等取代基彼此各自無關地由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；醛基；羧基；醯胺基；含1至8個碳原子之烷基($C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含1至8個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含1至8個碳原子之烷基羰基($C(=O)C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含1至8個碳原子之烷氧基羰基($C(=O)O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含1至8個碳原子之烷基羰氧基($O-C(=O)-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含1至8個碳原子之烷基取代之醯胺基($C(=O)NH-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含1至8個碳原子之烷基取代之醯胺基($C(=O)N(C_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、被一含1至8個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含1至8個碳原子之烷基取代之胺基

($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基 ($\text{NH-C(=O)C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基 ($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})\text{-C(=O)C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 ($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷基磺醯基 ($\text{S(=O)}_2\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基磺醯基 ($\text{S(=O)}_2\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、甲氧基及羥基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；羥基；三氟甲氧基；巰基；三氟甲硫基；羥基磺醯基；胺基；含 3 至 10 個碳原子之環烷基 ($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$) 或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代；苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基，其等各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、氰基、含 1 至 8 個碳原子之烷基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基、三氟甲基、羥基、三氟甲氧基、羧基、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

尤其偏好者為 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 等取代基彼此各自無關地由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；2,2,2-三氟乙基 (CH_2CF_3)；羧基；醯胺基；巰基；三氟甲硫基；羥基磺醯基；胺基；三氟甲氧基；羥基；含 1 至 8 個碳原子之烷基 ($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)，其等各自為飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由甲氧基及羥基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次；含 1 至 8 個碳原子之烷基羰基 ($\text{C(=O)C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基羰基 ($\text{C(=O)O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羰氧基

(O-C(=O)-C₁₋₈-Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之鹽胺基(C(=O)NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之鹽胺基(C(=O)N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(NH-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(N(C(=O)C₁₋₈-Alkyl)₂)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基磺鹽基(S(=O)₂O-C₁₋₈-Alkyl)，其等各自為飽和，分叉或未分叉，未經取代；飽和，未經取代之含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C₃₋₁₀-Cycloalkyl)；吡咯烷基、哌啶基、4-甲基哌嗪基、哌嗪基或嗎啉基，其等各自為未經取代；苯甲基、苯基或吡啶基，其等各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、氰基、含 1 至 8 個碳原子之烷基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基、三氟甲基、羥基、三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

十分特別受偏好者為 R¹、R²、R³ 及 R⁴ 等取代基彼此各自無關地由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；正丙基；異丙基；環丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；2,2,2-三氟乙基(CH₂CF₃)；乙鹽基；丙鹽基；羧基；甲酯基；乙酯基；鹽胺基；被二甲基取代之鹽胺基；被二乙基取代之鹽胺基；被一甲基取代之鹽胺基；被一乙基取代之鹽胺基；被一甲基及一乙基取代鹽胺基；羥基；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基(O-(CH₂)₂-O-CH₃)；羥基乙氧基(O-(CH₂)₂-OH)；三氟甲氧基；甲基羰氧基；乙基羰氧基；NR^aR^b，其中 R^a 及 R^b 彼此各自無關地由氫原子、甲基、乙基、甲氧基乙基((CH₂)₂-O-CH₃)及羥基乙基((CH₂)₂-OH)等殘基構成之組群所選出，或 R^a 及 R^b 及其等鍵結之氮原子形成一吡咯烷基、哌啶基、4-甲基哌嗪基或嗎啉基；被一甲基羰基取代之胺基；被一乙

基羰基取代之胺基；巯基；三氟甲硫基；甲硫基；乙硫基；羥基磺醯基；甲氧基磺醯基；苯甲基、苯基、吡啶基，其等各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、羥基、甲氧基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

尤其係 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 等取代基彼此各自無關地由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；乙醯基；甲氧基；甲氧基乙氧基($O-(CH_2)_2-O-CH_3$)；三氟甲氧基；甲基羰氧基；被一甲基羰基取代之胺基；被二甲基取代之胺基；嗎啉基；甲硫基；三氟甲硫基；苯甲基及苯基，其等各自為未經取代。

本發明一非常特別受偏好之實施例中， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 等取代基彼此各自無關地由氫、氟、氯等原子；三氟甲基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出。

根據本發明諸化合物另一較偏好之實施例中，取代基 R^5 係由氫、氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($C(=O)(R^0$ 或 $H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基($C(=O)O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($C(=O)N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羰基取代之胺基、或被一 R^0 基羰基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-N(R^0$ 或 $H)_2$)；巯基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0$ 或 $H)_2$)等構成之組群所選

出。

根據本發明諸化合物另一較偏好之實施例中，取代基 R^5 係由氫、氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($C(=O)(R^0$ 或 $H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基($C(=O)O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($C(=O)N(R^0$ 或 $H)_2$)； R^0 基氧基；羥基-含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-OH$)；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基-含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)；三氟甲氧基； R^0 基羰氧基；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羰基取代之胺基、或被一 R^0 基羰基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-N(R^0$ 或 $H)_2$)；巰基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2-O-(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0$ 或 $H)_2$)等構成之組群所選出。

取代基 R^5 主要係由該組群所選出，其包含氫、氟、氯、溴、碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；醛基；羧基；醯胺基；含 1 至 8 個碳原子之烷基($C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羰基($C(=O)C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基羰基($C(=O)O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羰氧基($O-C(=O)-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基($C(=O)NH-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基($C(=O)N(C_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基

($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基 ($\text{NH-C(=O)C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基 ($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})\text{-C(=O)C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 ($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷基磺醯基 ($\text{S(=O)}_2\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基磺醯基 ($\text{S(=O)}_2\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、甲氧基及羥基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；三氟甲氧基；巰基；三氟甲硫基；羥基磺醯基；胺基；含 3 至 10 個碳原子之環烷基 ($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$) 或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代；苯甲基、苯基、吡啶基或噻吩基，其等各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、胺基、氰基、含 1 至 8 個碳原子之烷基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基、三氟甲基、羥基、三氟甲氧基、羧基、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

尤其偏好者為取代基 R^5 主要係由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；2,2,2-三氟乙基 (CH_2CF_3)；羧基；醯胺基；巰基；三氟甲硫基；羥基磺醯基；胺基；三氟甲氧基；含 1 至 8 個碳原子之烷基 ($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)，其等各自為飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由甲氧基及羥基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次；含 1 至 8 個碳原子之烷基羰基 ($\text{C(=O)C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基羰基 ($\text{C(=O)O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羧基 ($\text{O-C(=O)-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基

取代之醯胺基($\text{C}(=\text{O})\text{NH}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基($\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基($\text{NH}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基($\text{N}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基磺醯基($\text{S}(=\text{O})_2\text{O}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)，其等各自為飽和，分叉或未分叉，未經取代；飽和，未經取代之含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)；吡咯烷基、哌啶基、4-甲基哌嗪基、哌嗪基或嗎啉基，其等各自為未經取代；苯甲基、苯基或吡啶基，其等各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、氰基、含 1 至 8 個碳原子之烷基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基、三氟甲基、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

十分特別受偏好者為取代基 R^5 係由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；正丙基；異丙基；環丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；2,2,2-三氟乙基(CH_2CF_3)；乙醯基；丙醯基；羧基；甲酯基；乙酯基；醯胺基；被二甲基取代之醯胺基；被二乙基取代之醯胺基；被一甲基取代之醯胺基；被一乙基取代之醯胺基；被一甲基及一乙基取代之醯胺基；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)；羥基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{-OH}$)；三氟甲氧基；甲基羰氧基；乙基羰氧基； NR^aR^b ，其中 R^a 及 R^b 彼此各自無關地由氫原子、甲基、乙基、甲氧基乙基($(\text{CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)、羥基乙基($(\text{CH}_2)_2\text{-OH}$)、乙醯基及丙醯基等殘基構成之組群所選出，或 R^a 及 R^b 及其等鍵結之氮原子形成一吡咯烷基、哌啶基、4-甲基哌嗪基或嗎啉基；巰基；三氟甲硫基；甲硫基；乙硫基；羥基磺醯基；甲氧基磺醯基；苯甲基，其為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、

氟、溴、碘等原子、氟基、甲基、乙基、三氟甲基、羥基、甲氧基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

尤其係取代基 R^5 係由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氟基；甲基；乙基；甲氧基甲基 ($-\text{CH}_2\text{-O-Methyl}$)；乙醯基；甲氧基；甲氧基乙氧基 ($\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)；三氟甲氧基；甲基羧氧基；被一甲基羧基取代之胺基；被二甲基取代之胺基；嗎啉基；甲硫基；三氟甲硫基；未經取代之苯甲基。

本發明一非常特別受偏好之實施例中，取代基 R^5 為甲基、甲氧基或甲氧基甲基 ($-\text{CH}_2\text{-O-Methyl}$)。

另一較偏好之實施例中，取代基 R^6 代表含 1 至 10 個碳原子之烷基 ($\text{C}_{1-10}\text{-Alkyl}$) 或含 2 至 10 個碳原子之雜烷基 ($\text{C}_{2-10}\text{-Heteroalkyl}$)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氟基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 ($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 ($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基 ($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$) 或雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基 ($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、

羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、或雜環基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、

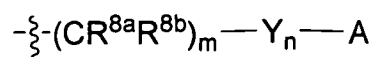
含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、及雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

芳香基或雜芳香基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個

碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羧基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羧基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羧基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、及雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

另一較偏好之實施例中，取代基 R^6 代表下圖所示之部分結構(T1)



(T1)

其中

R^{8a} 及 R^{8b} 等殘基彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；羥基；三氟甲氧基；胺基；含 1 至 4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkyl)、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-4}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}$ -Alkyl) $_2$)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-4}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-4}$ -Alkyl) $_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

m 代表 0、1、2、3 或 4；

Y 代表氧原子或 NR^9 基，

其中 R^9 代表氫原子；含 1 至 4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkyl)，其為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkyl)、羥基、

含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表含 3 至 10 個碳原子之環烷基，其為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

n 代表 0 或 1，

當 m 代表 0 時，則 n 不代表 1；

A 代表含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)，

其為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子

之烷硫基(S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

R^{8a} 及 R^{8b} 等殘基彼此各自無關地代表氫、氟、氯、溴、碘等原子；

硝基；三氟甲基；2,2,2-三氟乙基(CH_2CF_3)；氰基；羧基；三氟甲氧基；
 胺基；含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 4 個碳原子之烷
 氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、羧基-含 1 至 4 個碳原子之烷氧基
 ($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl-OH}$)、甲氧基-含 1 至 4 個碳原子之烷氧基
 ($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl-OCH}_3$)、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基
 ($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基
 ($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未經取代；含 3 至
 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)，其為飽和或不飽和，未經取代
 或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 4 個
 碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、羧基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基
 ($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

m 代表 0、1、2、3 或 4；

Y 代表氧原子或 NR^9 基，

其中 R^9 代表氫原子；含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)，其為飽和
 或不飽和，未經取代；或代表含 3 至 10 個碳原子之環烷基，其為飽和
 或不飽和，未經取代；

n 代表 0 或 1，

當 m 代表 0 時，則 n 不代表 1；

A 代表含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)，

其為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自
 無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羧基、含 1 至 4 個碳
 原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、三氟甲基、胺基、被一含 1
 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 4 個碳
 原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)、三氟甲硫基等殘基構成之組群
 所選出之取代基取代一或數次；或代表含 3 至 10 個碳原子之環烷基
 ($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代或被

一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)、三氟甲硫基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-4}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

R^{8a} 及 R^{8b} 等殘基尤其偏好彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；正丙基；異丙基；環丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；2,2,2-三氟乙基(CH_2CF_3)；羥基；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基($\text{O-(CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)；羥基乙氧基；三氟甲氧基；胺基；被一甲基取代之胺基；被二甲基取代之胺基；被

一乙基取代之胺基；被二乙基取代之胺基；或代表被一甲基及一乙基取代之胺基；

m 代表 1、2 或 3；

n 代表 0；及

A 代表含 1 至 4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkyl)，

其為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲氧基及三氟甲基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表飽和且未經取代之含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)；或代表苯基、萘基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯基、萘基、吡啶基、噻吩基等殘基，其等各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($NH(C_{1-4}$ -Alkyl))、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-4}$ -Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

R^{8a} 及 R^{8b} 等殘基十分特別偏好彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘等原子；甲基；乙基；正丙基；異丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；羥基；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基($O-(CH_2)_2-O-CH_3$)或羥基乙氧基($O-(CH_2)_2-OH$)；

m 代表 1、2 或 3；

n 代表 0；及

A 代表甲基；乙基；正丙基；異丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁

基；環丙基；環丁基；環戊基；環己基；環庚基；金剛烷基；雙環[2.2.1]庚基(Bicyclo[2.2.1]heptyl)；雙環[2.2.2]辛基(Bicyclo[2.2.1]octyl)；苯基、吡啶基、噻吩基，

其等各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₄-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基(C₁₋₄-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₄-Alkyl)、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₄-Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₄-Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

一尤其受偏好之實施例中，R^{8a}及 R^{8b}等殘基彼此各自無關地代表氮原子，

m 代表 1，

n 代表 0 及

A 代表苯基、吡啶基、噻吩基，

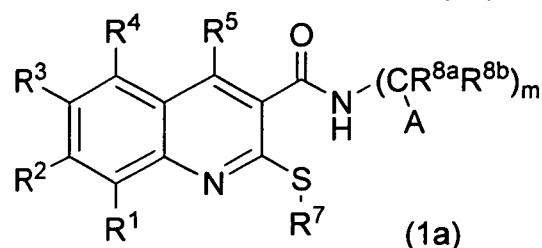
其等各自被一由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基(C₁₋₄-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₄-Alkyl)、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₄-Alkyl)₂)、巰基(SH)、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₄-Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代零、一、二或三次。

當 n=0 時，由代表 R⁶之部分結構(T-1)得部分結構(T1-1)：



(T1-1)

尤其受偏好者為根據本發明具通式(1a)之化合物：



另一較偏好之實施例中，取代基 R^7 代表

含 1 至 10 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-10}\text{-Alkyl}$)或含 2 至 10 個碳原子之雜烷基($\text{C}_{2-10}\text{-Heteroalkyl}$)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)或雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、

羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、或雜環基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、

含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)及雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

芳香基或雜芳香基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巯基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原

子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巯基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺鹽基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺鹽基、巯基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、及雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

取代基 R^7 較偏好代表

含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基(C_{2-8} -Heteroalkyl)，其等各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巯基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、含 3 至 8 個碳原子之環烷基(C_{3-8} -Cycloalkyl)或雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

含 3 至 8 個碳原子之環烷基(C_{3-8} -Cycloalkyl)、或雜環基、或經由含 1 至 6 個碳原子之烷基或經由含 2 至 6 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 8 個碳原子之環烷基或雜環基，其等各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧

基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、含 3 至 8 個碳原子之環烷基(C_{3-8} -Cycloalkyl)及雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環

基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

芳香基或雜芳香基、或經由含 1 至 6 個碳原子之烷基或經由含 2 至 6 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其等各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基等殘基可各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH(C_{1-8}-Alkyl)$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘等原子、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯

基、巯基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)、及雜環基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、羥基及三氟甲氧基等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其等可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘等原子、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

取代基 R^7 尤其較偏好由該組群所選出，其包含甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、二級-丁基、三級-丁基、正戊基、異戊基、新戊基、正己基、環丙基、環丁基、環戊基、環己基、甲基-環丙基、甲基-環丁基、甲基-環戊基、甲基-環己基、乙基-環丙基、乙基-環丁基、乙基-環戊基、乙基-環己基，其等各自為未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘等原子、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基及含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(OC_{1-8} -Alkyl)等殘基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或苯基、苯甲基、苯乙基，其等各自為未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘等原子、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(OC_{1-8} -Alkyl)及氰基等殘基構成之組群所選

出之取代基取代一或數次。

取代基 R⁷ 十分特別較偏好甲基、乙基、異丙基、三級-丁基及環戊基。

尤其受偏好之諸化合物係由下列之組群所選出，其包含：

- 1 2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉-甲醯胺；
- 2 3-[[3-[氧基-(2-噻吩基甲胺基)甲基]-喹啉基]硫基]丙酸甲酯；
- 3 2-(3-環己基丙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 4 2-(3-苯基丙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 5 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基-甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 6 2-[3-(4-氟苯基)丙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 7 2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 8 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 9 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-7-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 10 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-5-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 11 2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 12 2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 13 N-(2-噻吩基甲基)-2-[2-[3-(三氟甲基)-苯基]磺醯基乙基硫基]-3-喹啉甲醯胺；
- 14 2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-7-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 15 2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-7-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 16 2-[2-(4-氟苯基)磺醯基乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 17 2-[2-(對-甲苯基磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；

- 18 2-[2-(對-甲苯基硫基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 19 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(環己基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 20 2-[3-(對-甲苯基)丙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 21 2-[2-(苯基硫基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 22 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-環己基乙基)-3-喹啉甲醯胺；
- 23 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(3,3-二甲基丁基)-3-喹啉甲醯胺；
- 24 2-[2-[(4-氟苯基)硫基]乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 25 N-(3,3-二甲基丁基)-2-(乙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 26 3-(3-(噻吩-2-基甲基胺基甲醯基)-6-(三氟甲基)喹啉-2-基硫基)丙酸甲酯；
- 27 3-(3-(噻吩-2-基甲基胺基甲醯基)-7-(三氟甲基)喹啉-2-基硫基)丙酸甲酯；
- 28 N-(2,2-二甲基丙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 29 N-(環庚基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 31 N-[(3,4-二氟苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 32 N-[(2,4-二氟苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 33 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[(3,4,5-三氟苯基)甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 34 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[(2,4,5-三氟苯基)甲基]-喹

- 啉-3-甲醯胺；
- 35 2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-4-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 36 N-[(4-三級-丁基-苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 37 2-乙基硫基-4-甲基-N-(3-甲基-丁基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 38 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[3-[(三氟甲基)苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 39 2-乙基硫基-4-甲基-N-苄乙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 40 2-乙基硫基-4-甲基-N-(3-苯基-丙基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 41 2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 42 2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-3-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 43 2-乙基硫基-4-甲基-N-(萘-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 44 2-乙基硫基-4-甲基-N-(噻唑-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 45 2-乙基硫基-4-甲基-N-([1,3,4]噁二唑-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 47 N-[(3-氟苯基)甲基]-2-(異丙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 48 2-(環戊基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 49 2-(丁基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 50 N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(戊基硫基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 51 N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(1-甲基-丙基硫基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 52 2-(環己基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 53 N-(2-環戊基-乙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 54 N-(3-環戊基-丙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 55 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 56 N-[(3-三級-丁基-苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 57 2-乙基硫基-4-甲基-N-(4-甲基戊基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 58 2-苯甲基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 59 2-乙基硫基-N-[(3-氟-2-甲氧基-苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 60 2-乙基硫基-N-[(5-氟-2-甲氧基-苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 61 N-[(3,4-二甲基苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 62 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[[4-(三氟甲基硫基)苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 63 N-(環己基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 64 2-乙基硫基-4-甲基-N-(四氫吡喃-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 65 2-乙基硫基-4-甲基-N-丙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 66 N-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 67 2-乙基硫基-N-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 68 2-乙基硫基-4-甲基-N-戊基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 69 2-乙基硫基-4-甲基-N-[(5-甲基-噻吩-2-基)甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 70 2-乙基硫基-4-甲基-N-[(4-甲基-噻吩-2-基)甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 71 N-[(5-氯-噻吩-2-基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 72 2-乙基硫基-4-甲基-N-(2-噻吩-2-基-乙基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 73 N-(5-雙環[2.2.1]庚基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 74 N-苯甲基-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 75 2-乙基硫基-N-[(2-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 76 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 77 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 78 N-[(2-氟苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 79 N-[(3-氟苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 80 N-[(4-氟苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 81 2-乙基硫基-4-甲基-N-(鄰-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 82 2-乙基硫基-4-甲基-N-(間-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 83 2-乙基硫基-4-甲基-N-(對-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 84 2-乙基硫基-N-[(2-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 85 2-乙基硫基-N-[(3-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 86 2-乙基硫基-N-[(4-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 87 N-[(3,5-二氟-苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 88 4-甲基-2-甲基硫基-N-(噻吩-2-基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 89 2-(三級-丁基硫基)-4-甲基-N-(噻吩-2-基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 90 N-(2,2-二甲基-丙基)-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 91 2-乙基硫基-4-甲基-N-(噻吩-2-基-甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 92 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 93 2-(三級-丁基硫基)-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 94 2-(三級-丁基硫基)-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 95 7-三級-丁基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 96 7-三級-丁基-2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 97 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 98 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-7-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 99 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4,6-二甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 100 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4,6-二甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 101 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-6-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 102 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-6-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 103 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-6-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 104 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-6-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 105 2-乙基硫基-7-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；

- 106 2-乙基硫基-7-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 107 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4,7-二甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 108 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4,7-二甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 109 2-乙基硫基-6,7-二氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 110 2-乙基硫基-N-(呋喃-2-基-甲基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 111 2-乙基硫基-4-甲基-N-[(5-甲基-呋喃-2-基)-甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 113 2-乙基硫基-N-[(3-羟基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 114 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 115 N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 116 2-乙基硫基-6-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 117 2-乙基硫基-6-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 118 2-乙基硫基-6,7-二氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 119 2-乙基硫基-N-[(4-羟基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 120 2-乙基硫基-8-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 121 2-乙基硫基-8-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 123 2-乙基硫基-5-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 124 2-乙基硫基-5-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 125 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-5-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺

胺；

126 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-5-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

127 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-5-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

128 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-6-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

129 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

133 7-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

134 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-嗎啉-4-基-喹啉-3-甲酯胺；

135 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-嗎啉-4-基-喹啉-3-甲酯胺；

136 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-8-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酯胺；

137 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-8-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酯胺；

138 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-8-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

139 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-8-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

140 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-8-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酯胺；

141 7-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲

醯胺；

- 142 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基氧基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 143 4-乙基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 144 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-異丙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

或其等生理上可被接受之鹽類。

根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺 (2-Mercaptochinolin-3-carboxamide) 及其等個別相應之酸、鹼、鹽類及水合物等皆適合做為藥品中之主成分。

本發明之另一標的因此為一藥品，其含至少一根據本發明具通式(1)之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，其中由 R^1 至 R^7 等殘基皆具上文所述之義涵，及必要時尚含一或數種製藥上可被接受之輔助劑。

根據本發明之藥品，除含至少一種根據本發明之化合物以外，尚可選擇性地含適用之添加劑及/或輔助性物質，亦即載體物質、填充劑、溶劑、稀釋劑、色素、及/或黏合劑，且能以液體藥品劑型給藥，其等之形式有注射液、滴劑或汁液，或以半固體藥品劑型給藥，其等之形式有顆粒、錠劑、藥丸、貼布、膠囊、藥膠布/噴塗藥膠布或氣膠。輔助性物質之選擇及其等被使用之用量須視該藥品給藥之方式是否為口服、經口、非經腸道、靜脈內、腹腔內、皮內、肌肉內、鼻腔用、口腔用、直腸用或局部外用，例如用於皮膚、黏膜或眼睛，而定。錠劑、糖衣錠、膠囊、顆粒、滴劑、汁液及糖漿等劑型之處方皆適用於口服給藥，且溶液、懸浮液、可容易再調製之乾燥處方及噴劑則皆適用於非經腸道、外用及吸入等方式之給藥。於貯積劑型、溶解劑型或可選擇性加入促進穿透皮膚藥劑之藥膠布劑型中之根據本發明之諸化合物

皆為經皮給藥適用之處方。可用於口服或經皮方式之處方劑型可延緩之方式釋出根據本發明之諸化合物。根據本發明之諸化合物亦可被使用於非經腸道長期之貯積劑型，例如植體或植入之幫浦。原則上尚具其他為習知技藝人士所知之主成分亦可被添加入根據本發明之藥品中。

該等根據本發明之藥品適合用於影響 KCNQ2/3 通道，並產生促效或拮抗之作用，尤其係促效之作用。

根據本發明之藥品較偏好適用於治療至少部份因 KCNQ2/3 通道所造成之障礙症或病症。

根據本發明之藥品較偏好適用於治療一或數種由疼痛，尤其係由急性疼痛、慢性疼痛、神經病變所引起之疼痛、肌肉疼痛及發炎所引起之疼痛等構成之組群所選出之疼痛；癲癇；尿失禁；焦慮狀態；成癮症；躁鬱症；雙階段障礙症；偏頭痛；認知之病症；及/或尿失禁。

根據本發明之藥品較偏好適用於治療疼痛，十分特別偏好適用於治療慢性疼痛、神經病變所引起之疼痛、發炎所引起之疼痛及肌肉疼痛等。

根據本發明之藥品又適用於治療癲癇症。

本發明之另一標的為使用至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，及必要時使用一或數種製藥上可被接受之輔助劑於製造一藥品用於治療至少部份因 KCNQ2/3 通道所造成之障礙症或病症。

較偏好者為使用至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，及必要時使用一或數種製藥上可被接受之輔助劑於製造一藥品用於治療疼痛，尤其係由急性疼痛、慢性疼痛、神經病變所引起之疼痛、肌肉疼痛及發炎所引起之疼痛等構成之組群所選出之疼痛；癲癇；尿失禁；焦慮狀態；成癮症；躁鬱症；雙階段障礙症；偏頭痛；認知之病症；與肌張力不全症相關之不自主運動及/或尿失禁。

尤其偏好者為使用至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯

胺，及必要時使用一或數種製藥上可被接受之輔助劑於製造一藥品用於治療疼痛，十分特別偏好適用於治療慢性疼痛、神經病變所引起之疼痛、發炎所引起之疼痛及肌肉疼痛等。

又更偏好者為使用至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，及必要時使用一或數種製藥上可被接受之輔助劑於製造一用於治療癲癇症之藥品。

本發明之另一標的為至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，及必要時一或數種製藥上可被接受之輔助劑用於治療至少部份因 KCNQ2/3 通道所造成之障礙症或病症。

本發明之另一標的為至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，及必要時一或數種製藥上可被接受之輔助劑用於治療疼痛，尤其係由急性疼痛、慢性疼痛、神經病變所引起之疼痛、肌肉疼痛及發炎所引起之疼痛等構成之組群所選出之疼痛；癲癇；尿失禁；焦慮狀態；成癮症；躁鬱症；雙階段障礙症；偏頭痛；認知之病症；與肌張力不全症相關之不自主運動及/或尿失禁。

尤其偏好者為至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，及必要時一或數種製藥上可被接受之輔助劑用於治療疼痛，十分特別偏好適用於治療慢性疼痛、神經病變所引起之疼痛、發炎所引起之疼痛及肌肉疼痛等。

尤其偏好者亦為至少一根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，及必要時使用一或數種製藥上可被接受之輔助劑用於治療癲癇症。

抗疼痛之效果例如可顯現於 Bennett 之模型或 Chung 之模型中 (Bennett, G.J. 及 Xie, Y.K., 產生如於人類觀察到之痛覺障礙症之大鼠之單一神經病變, Pain 1988, 33(1), 87-107; Kim, S.H. 及 Chung, J.M., 將大鼠部份之脊髓神經結紮後所產生之末梢神經病變之實驗模型, Pain 1992, 50(3), 355-363)。抗癲癇症之效果例如可於 DAB/2 小鼠模型中被證明

(De Sarro et al., Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol. 2001, 363, 330-336)。

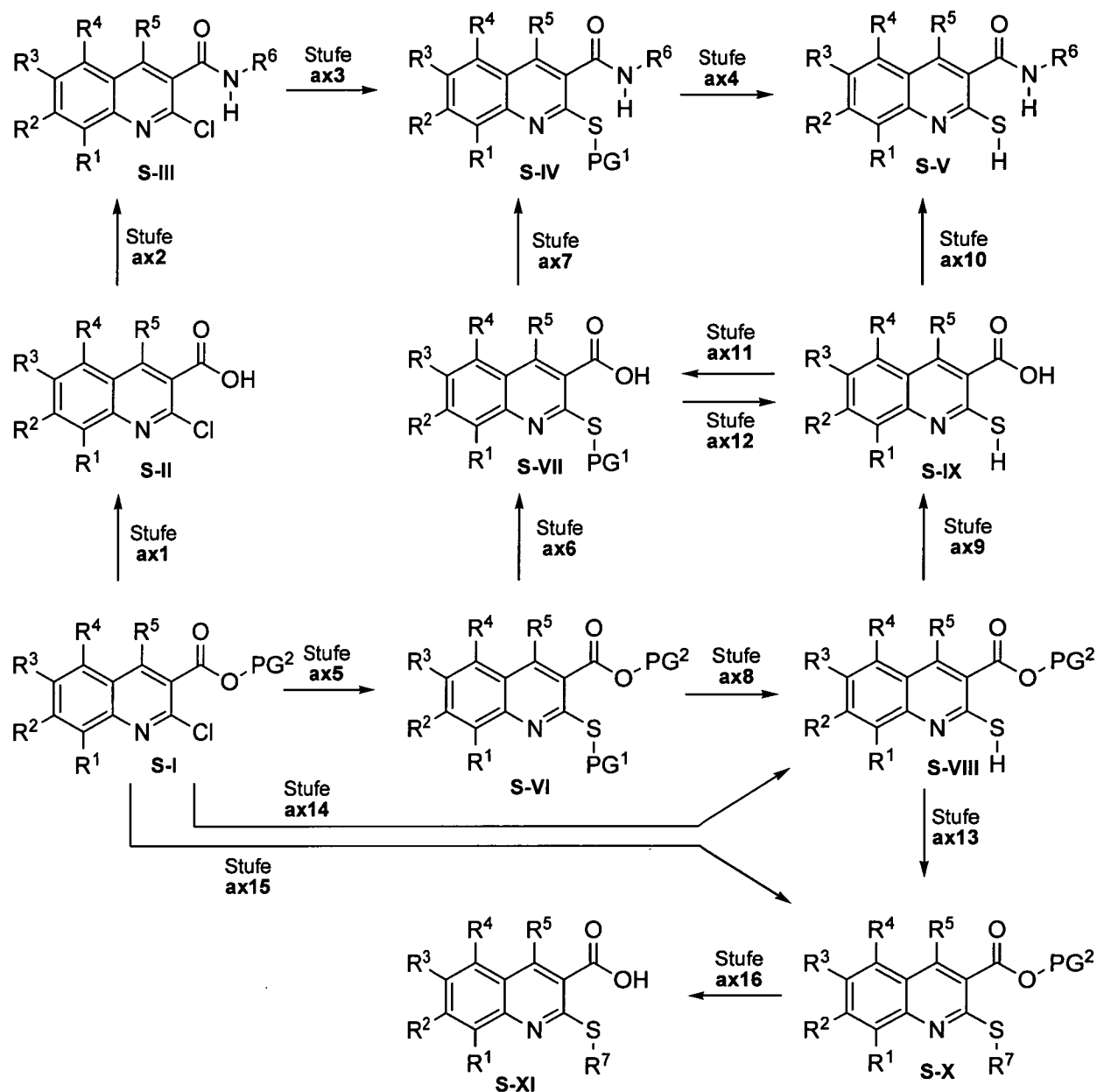
較偏好者為根據本發明之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺所具之 EC_{50} 值最多不超過 $10\mu M$ 或不超過為 $5\mu M$ ，更偏好最多不超過 $3\mu M$ 或不超過為 $2\mu M$ ，又更偏好最多不超過 $1.5\mu M$ 或不超過為 $1\mu M$ ，最偏好最多不超過 $0.8\mu M$ 或不超過為 $0.5\mu M$ 及尤其最多不超過 $0.4\mu M$ 或不超過為 $0.2\mu M$ 。測定 EC_{50} 值之方法皆為習知技藝人士所熟知。 EC_{50} 值較偏好者以螢光測量法測量之，尤其偏好以「藥理學實驗」中所述之方法測量之。

本發明之另一標的為製備根據本發明被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺之方法。

下文所述及之反應中所使用之化學藥品及反應物皆係由購買所得或可個別依據常見且為習知技藝人士所熟悉之方法製備之。

通則性之反應流程圖

圖 1：



ax1、**ax5**、**ax9** 及 **ax16** 之步驟中，受保護基保護之酯化合物 **S-I**、或 **S-VI**、或 **S-VIII**、或 **S-X**，其例如代表一三級-丁基或一苯甲基，其之保護基 PG^2 利用習知技藝人士所熟悉酯化合物分解之方法於使用一種酸或一種鹼之下被移除，酯化合物 **S-I**、或 **S-VI**、或 **S-VIII**、或 **S-X** 於是被轉變成羧酸 **S-II**、或 **S-VII**、或 **S-IX**、或 **S-XI**。

ax2、**ax7** 及 **ax10** 之步驟中，羧酸 **S-II**、或 **S-VII**、或 **S-IX** 可依據習

知技藝人士所熟悉之方法，被轉變成相應之醯胺化合物 **S-III**、或 **S-IV**、或 **S-V**。於此反應中，羧酸 **S-II**、或 **S-VII**、或 **S-IX** 可例如先與一適當之氯化劑，例如亞硫醯氯(Thionylchlorid)反應並被轉變成羧酸醯氯(Säurechlorid)，其緊接著，必要時於使用一種鹼之下，與一級胺 R^6-NH_2 反應，並被轉變成醯胺化合物 **S-III**、或 **S-IV**、或 **S-V**。此外，羧酸 **S-II**、或 **S-VII**、或 **S-IX** 尚可於使用一適當之接合劑，例如 N,N,N',N' -四甲基-O-(7-氮雜苯並三氮唑-1-基)脒六氟磷酸酯(HATU)或羰基二咪唑(CDI)之下，及必要時加入一種鹼之下，與一級胺 R^6-NH_2 反應，並被轉變成醯胺化合物。

ax3 及 **ax5** 之步驟中，可依據習知技藝人士所熟悉之方法以 2-氯-喹啉(2-Chlor-chinolin)**S-III** 及 **S-I** 為起始化合物合成受保護基 PG^1 所保護之硫醚化合物 **S-IV** 及 **S-VI**，其例如於一 *ipso*-之取代反應中，必要時使用一種酸或一種鹼之下，分別經由與相應之硫醇化合物 PG^1-SH 進行烷化反應而被轉變成一硫醚化合物 **S-IV** 及 **S-VI**。

ax4、**ax8** 及 **ax12** 之步驟中，該例如以硫醚之形式受保護之硫醚化合物 **S-IV** 或 **S-VI** 或 **S-VII** 於必要時使用一種酸或一種鹼之下經移除保護基 PG^1 後可形成硫醇化合物 **S-V** 或 **S-VIII** 或 **S-IX**。

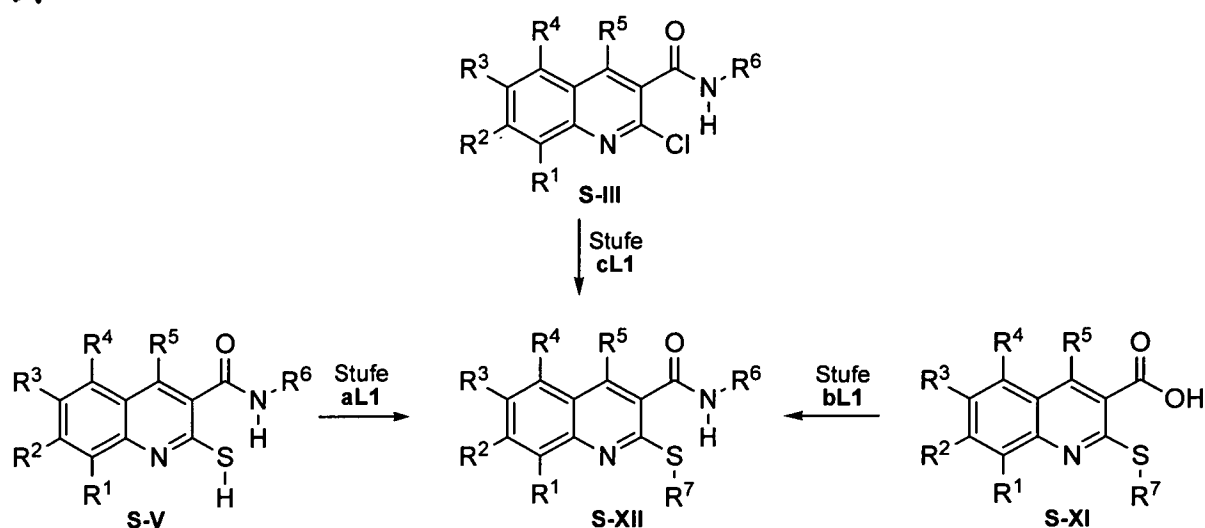
ax11 之步驟中，硫醇化合物 **S-IX** 可依據習知技藝人士所熟悉之方法被轉變成 **S-VII**，其具一被保護基 PG^1 所保護之硫氫基。於此，該硫醇化合物 **S-IX**，於必要時使用一種鹼之下，例如可添加入一種烷基鹵化物(Alkylhalogenid)， PG^1-Hal ，被加以烷化。

ax13 之步驟中，硫醇化合物 **S-VIII** 可依據習知技藝人士所熟悉之方法被轉變成其相應之硫醚化合物 **S-X**。於此，該硫醇化合物 **S-VIII**，於必要時使用一種鹼之下，例如可添加入一種烷基鹵化物， R^7-Hal ，被加以烷化。

ax14 之步驟中，2-氯-喹啉 **S-I** 可依據習知技藝人士所熟悉之方法，例

如以一硫醇化合物，例如 3-巯基丙酸乙酯(3-Mercaptopropansäure ethylester)進行取代而先將其轉變成其相應之硫醚化合物，其緊接著，必要時於使用一種酸或一種鹼之下，可被分解成硫醇化合物 **S-VIII**。
ax15 之步驟中，可依據習知技藝人士所熟悉之方法以 2-氯-喹啉(2-Chlor-chinolin)**S-I** 為起始化合物合成硫醚化合物 **S-X**，其例如於一 *ipso*-之取代反應中，必要時使用一種酸或一種鹼之下，分別經由與相應之硫醇化合物 R^7-SH 進行烷化反應而被轉變成一硫醚化合物。

圖 2：



aL1 之步驟中，硫醇化合物 **S-V** 可依據習知技藝人士所熟悉之方法被轉變成其相應之硫醚化合物 **S-XII**。於此，該硫醇化合物 **S-V**，於必要時使用一種鹼之下，例如可添加入一種烷基鹵化物， R^7-Hal ，被加以烷化。

bL1 之步驟中，羧酸 **S-XI** 可依據習知技藝人士所熟悉之方法，被轉變成其相應之醯胺化合物 **S-XII**。於此反應中，羧酸 **S-XI** 可例如先與一適當之氯化劑，例如亞硫醯氯反應並被轉變成羧酸醯氯，其緊接著，必要時於使用一種鹼之下，與一級胺 R^6-NH_2 反應，並被轉變成醯胺化合物 **S-XII**。此外，羧酸 **S-XI** 尚可於使用一適當之接合劑，例如 *N,N,N',N'*-四甲基-*O*-(7-氮雜苯並三氮唑-1-基)脲六氟磷酸酯或羰基二咪唑之下，及必要時加入一種鹼之下，與一級胺 R^6-NH_2 反應，並被轉

變成鹽胺化合物。

cL1 之步驟中，可依據習知技藝人士所熟悉之方法以 2-氯-喹啉 (2-Chlor-chinolin)**S-III** 為起始化合物合成硫醚化合物 **S-XII**，其例如於一 *ipso*-之取代反應中，必要時使用一種鹼之下，分別經由與相應之硫醇化合物 R^7-SH 進行烷化反應而被轉變成一硫醚化合物。

習知技藝人士所熟悉進行反應步驟 **ax1** 至 **ax16** 及步驟 **aL1**、**bL1** 和 **cL1** 之方法可取自於有機化學之標準工具書，例如 J. March, Advanced Organic Chemistry, Wiley & Sons, 6th edition, 2007; F. A. Carey, R. J. Sundberg, Advanced Organic Chemistry, Parts A and B, Springer, 5th edition, 2007; 作者群，有機化學方法概要，Wiley & Sons。此外，尚具目前資料庫之其他方法及文獻參考，例如荷蘭阿姆斯特丹 Elsevier 之 Reaxys[®] 資料庫，或美國華盛頓美國化學學會之 SciFinder[®] 資料庫。

【實施方式】

合成反應說明

縮寫

AcOH	乙酸(醋酸，Essigsäure)
aq.	水溶液
Brine	飽和之氯化鈉溶液
BuLi	正丁基鋰(Butyllithium)
d	天
DCM	二氯甲烷(Dichlormethan)
DIPEA	N,N'-二異丙基乙胺(N,N'-Diisopropyl-ethylamin)
EE	乙酸乙酯(Ethylacetat)
EtOH	乙醇(Ethanol)

ges.	飽和
h	小時
HATU	O-(7-氮雜-苯並三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸酯 (O-(7-Aza-Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluroniumhexa-fluorophosphat)
Lsg.	溶液
m/z	質量與電荷比
M	體積莫耳濃度(molar)
MeCN	乙腈(Acetonitril)
MeOH	甲醇(Methanol)
min	分鐘
MS	質量光譜測量
N/A	無法取得
NEt ₃	三乙胺(Triethylamin)
RG	促效劑 Retigabine
RT	室溫 23 ± 7°C
SC	矽膠管柱色層分析法
THF	四氫呋喃(Tetrahydrofuran)
vv	體積比

所有未清楚說明之起始化合物係經由購買所取得(供應商可例如於美國, San Ramon 之 MDL 公司之 Symyx[®]之可取得化學藥品之資料庫中查詢, 或其等之合成已確切地敘述於專業之文獻中(實驗方法例如可於荷蘭阿姆斯特丹 Elsevier 公司之 Reaxys[®]資料庫中查詢), 或其等可依據習知技藝人士所熟悉之方法被加以合成。

被使用作為管柱色層分析法之固定相為矽膠 60 (0.040-0.063 毫米)。

所有中間產物及範例化合物係利用 $^1\text{H-NMR}$ 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中間產物進行質量光譜測量試驗(MS, 數據 m/z 代表 $[\text{M}+\text{H}]^+$)。

中間產物之合成

**中間產物 VVV01 之合成：2-氯-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺
(2-Chlor-N-(thiophen-2-ylmethyl)chinolin-3-carboxamid)**

將一由 2.1 公克 (10.0 毫莫耳) 之 2-氯喹啉-3-羧酸 (2-Chlorchinolin-3-carbonsäure) 溶於亞硫醯氯 (60 毫升) 所組成之溶液於 85°C 下加熱 2 小時。接著將過量之亞硫醯氯於真空下加以移除。將所得之殘留物溶解於二氯甲烷(DCM)(60 毫升)中，並將該溶液冷卻至 0°C ，然後於此溶液中添加入 4 毫升 (30.0 毫莫耳) 之三乙胺及 1.03 毫升 (10.0 毫莫耳) 之噻吩-2-甲基胺 (Thiophen-2-methylamin)。經室溫下攪拌 90 分鐘後，將混合物以乙酸乙酯稀釋，並以飽和之氯化銨水溶液洗滌之。水相部份接著以乙酸乙酯萃取。合併後之有機相則以飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法 (己烷/乙酸乙酯 4:1) 純化後，結果得 1.44 公克 (4.8 毫莫耳, 48%) 之 2-氯-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺。

**中間產物 VVV02 之合成：2-巰基-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺
(2-Mercapto-N-(thiophen-2-ylmethyl)chinolin-3-carboxamid)**

將 600 毫克 (26.1 毫莫耳) 之鈉緩緩添加至甲醇 (500 毫升) 中。接著室溫下將一由 1.16 公克 (3.0 毫莫耳) 之 3-[[3-[氧基-(2-噻吩基甲胺基)甲基]-2-噻啉]-硫基]丙酸甲酯 (3-[[3-[oxo-(2-thienylmethylamino)methyl]-2-chinolinyl]-thio]propansäuremethylester) (範例 2) 溶於甲醇 (60 毫升) 所組成之溶

液添加至前述之溶液中。將此反應溶液然後於 70°C 下加熱 1 小時。經冷卻至室溫後，將溶液於真空下濃縮。接著將所得之殘留物溶解於水中，並以乙酸乙酯洗滌該溶液。然後以濃氫氯酸將溶液酸化至 pH 值 3。將所生成之沉澱物過濾收集，並加以乾燥。結果得 805 毫克(2.7 毫莫耳，90%)之 2-巰基-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺。

**中間產物 VVV03 之合成：2-氯-6-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸
(2-Chloro-6-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure)**

將一由 1.54 毫升(11.0 毫莫耳)之二異丙基胺(Diisopropylamin)溶於四氫呋喃(THF)(38 毫升)所組成之溶液冷卻至 0°C。於此溫度下將 6.9 毫升(1.6M 之己烷溶液，11.0 毫莫耳)之正丁基鋰(n-BuLi)以滴流之方式添加至前述之溶液中，接著於-78°C 下攪拌 30 分鐘。然後將一由 2.31 公克(10.0 毫莫耳)之 2-氯-6-(三氟甲基)喹啉(2-Chloro-6-(trifluormethyl)chinolin)溶於四氫呋喃(12 毫升)所組成之溶液於-78°C 下以滴流之方式添加至前述之溶液中，接著再於-78°C 下繼續攪拌 30 分鐘。將反應溶液倒入均勻分散之乾冰中。經回溫至室溫後，將溶液於真空下濃縮，並將殘留物溶解於水中。以 1N 之氫氧化鈉水溶液將該溶液調整成鹼性，然後以乙醚洗滌之。接著以 10%之氫氯酸水溶液該溶液調整成酸性，並以乙酸乙酯萃取之。有機相接著以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 198 毫克(0.7 毫莫耳，72%)之殘留物，2-氯-6-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸。

中間產物 VVV04 之合成：2-(2-(苯磺醯基)乙基硫基)-6-(三氟甲基)喹啉

-3-羧酸**(2-(2-(Phenylsulfonyl)ethylthio)-6-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure)**

將 206 毫克(1.5 毫莫耳)之碳酸鉀及 303 毫克(1.5 毫莫耳)之 2-(苯磺醯基)乙硫醇(2-(Phenylsulfonyl)ethanthiol)添加至一由 827 毫克(1.0 毫莫耳)之 2-氯-6-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸(2-Chloro-6-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure)(中間產物 VVV03)溶於丙酮(3 毫升)所組成之溶液中，接著於 70°C 下加熱 5 小時。然後將溶液過濾，並將濾液於真空下濃縮。將殘留物溶解於水中，並以 1N 氫氯酸水溶液將該溶液酸化。然後以乙酸乙酯萃取該溶液。有機相部份則以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。所得之殘留物經結晶法(二氯甲烷/己烷)純化後，結果得 316 毫克(0.7 毫莫耳，72%)之 2-(2-(苯磺醯基)乙基硫基)-6-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸。

中間產物 VVV05 之合成:2-羥基-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯
(2-Hydroxy-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure ethylester)

將一由 1.7 公克(5.36 毫莫耳)之 3-(2-乙醯基-5-(三氟甲基)苯胺基)-3-氧基丙酸乙酯(3-(2-Acetyl-5-(trifluormethyl)phenylamino)-3-oxopropansäure ethylester)溶於乙醇(EtOH)(16 毫升)所組成之溶液與 235 毫克(60%之礦物油溶液，5.89 毫莫耳)之氫化鈉一同於回流下加熱 3 小時，然後室溫下繼續攪拌 16 小時。接著於混合物中添加 1.34 毫升(6.70 毫莫耳)之乙酸(AcOH)，然後以乙酸乙酯(30 毫升)及飽和之氯化鈉水溶液(10 毫升)將其稀釋。將二相分離；有機相部份以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。所得之殘留物經結晶法(乙酸乙酯)純化後，結果得 920 毫克(3.07 毫莫耳，57%)之 2-羥基-4-甲基-7-(三氟

甲基)喹啉-3-羧酸乙酯。

中間產物 VVV06 之合成：2-氯-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯

(2-Chlor-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure ethylester)

將 4.3 公克(14.4 毫莫耳)之 2-羥基-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯
(2-Hydroxy-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure
ethylester)(中間產物 VVV05)與 13.3 毫升(144.1 毫莫耳)之三氯氧磷
(POCl₃)一同於 100°C 下加熱 2 小時。經冷卻至室溫後，將溶液濃縮，
結果得 4.5 公克(14.2 毫莫耳，98%)之殘留物，2-氯-4-甲基-7-(三氟甲
基)喹啉-3-羧酸乙酯。

**中間產物 VVV07 之合成：2-(3-乙氧基-3-氧基丙基硫基)-4-甲基-7-(三
氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯**

**(2-(3-Ethoxy-3-oxopropylthio)-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-c
arbonsäure ethylester)**

於 0°C 下，將 336 毫克(3.0 毫莫耳)之三級-丁酸鉀(Kalium-tert.-Butylat)
添加至一由 360 毫克(3.0 毫莫耳)之 3-巯基-丙酸甲酯
(3-Mercapto-propionsäuremethylester)溶於二甲基甲醯胺(DMF)(8 毫升)
所組成之溶液中，並於 0°C 下攪拌 30 分鐘。接著將 953 毫克(3.0 毫莫
耳)之 2-氯-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯
(2-Chlor-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbon-säure ethylester)添
加至前述之溶液中，然後將該反應溶液緩緩加熱至 50°C，並於此溫度
下攪該混合物 16 小時。經冷卻至室溫後，以水稀釋該混合物，並以乙
酸乙酯萃取之。有機相部份則以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，
並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯
9：1)純化後，結果得 625 毫克(1.5 毫莫耳，50%)之 2-(3-乙氧基-3-氧

基丙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯。

中間產物 VVV08 之合成：2-(乙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸(2-(Ethylthio)-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure)

將 400 毫克(17.4 毫莫耳)之鈉緩緩添加至甲醇(50 毫升)中，並將此溶液室溫下攪拌 5 分鐘。接著室溫下將一由 800 毫克(2.0 毫莫耳)之 2-(3-乙氧基-3-氧基丙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯(2-(3-Ethoxy-3-oxopropylthio)-4-methyl-7-(trifluormethyl)-chinolin-3-carbonsäure ethylester)(中間產物 VVV07)溶於甲醇(10 毫升)所組成之溶液添加至前述之溶液中。將此反應溶液然後於 70°C 下加熱 30 分鐘。經冷卻至室溫後，於溶液中添加入 488 微升(6.0 毫莫耳)之 1-碘乙烷(1-Iodethan)，並室溫下攪拌 2 小時。然後將溶液於真空下濃縮，並將所得之殘留物溶解於乙酸乙酯中。接著以水洗滌該溶液，水相部份則以乙酸乙酯萃取之。合併後之有機相則以飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 391 毫克(1.2 毫莫耳，62%)之殘留物，2-(乙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸，其於無進一步之純化下繼續被反應。

中間產物 VVV17 之合成：2-氯-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺

(2-Chlor-N-[(3-fluorophenyl)-methyl]-4-methyl-7-(trifluormethyl)-chinolin-3-carboxamid)

a) 2-氯-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯氯(2-Chlor-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonylchlorid)之合成
將 50 公克(55.3 毫莫耳)之 2-羥基-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯(2-Hydroxy-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure

ethylester)(中間產物 VVV05)與 51 毫升(553.1 毫莫耳)之三氯氧磷一同於 100°C 下加熱 2 小時。接著於該反應混合物中添加入甲苯(Toluol)(10 毫升)，並將該混合物於 60°C 下攪拌 10 分鐘，然後將其於真空下濃縮。以水溶解所得之殘留物，並以乙酸乙酯萃取之。有機相部份則以 1M 之碳酸氫鈉水溶液、水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌之，再以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 12.6 公克(40.9 毫莫耳，74%)之殘留物，2-氯-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯氯，其於無進一步之純化下繼續被反應。

b) 2-氯-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺
(2-Chlor-N-[(3-fluorophenyl)-methyl]-4-methyl-7-(trifluormethyl)-chinolin-3-carboxamid)之合成

室溫下，將一由 2.9 公克(23.4 毫莫耳)之 3-氟-苯甲基胺(3-Fluor-benzylamin)以滴流之方式添加至一由 6.0 公克(19.5 毫莫耳)之 2-氯-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯氯(2-Chlor-4-methyl-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonylchlorid)溶於二氧環己烷(Dioxan)(35 毫升)所組成之溶液中。接著將溶液室溫下攪拌 60 分鐘，然後加入水以終止反應之進行。將反應溶液以乙酸乙酯萃取，有機相部份則以 1M 之碳酸氫鈉水溶液及飽和之氯化鈉水溶液洗滌之，再以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。所得之殘留物經結晶法(乙酸乙酯)純化後，結果得 6.4 公克(16.1 毫莫耳，83%)之 2-氯-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺。

中間產物 VVV22 之合成:7-三級-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸

(7-tert.-Butyl-2-ethylsulfanyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure)

a) 3-(2-乙醯基-5-三級-丁基苯胺基)-3-氧基丙酸乙酯
(3-(2-Acetyl-5-tert.-butylphenylamino)-3-oxopropansäure ethylester)之合成

將 160 微升(1.15 毫莫耳)之三乙胺(NEt_3)添加至一由 200 毫克(1.0 毫莫耳)之 1-(2-胺基-4-三級-丁基苯基)乙酮
(1-(2-Amino-4-tert.-butylphenyl)ethanon)溶於二氯甲烷(DCM)(20 毫升)所組成之溶液中，然後將溶液冷卻至 0°C 。於此溫度下將 170 微升(1.4 毫莫耳)之 3-氯-3-氧基丙酸乙酯(3-Chlor-3-oxopropansäure ethylester)添加至前述之溶液中，接著室溫下攪拌 2 小時。然後以水稀釋該溶液，並以二氯甲烷萃取之。有機相部份則以飽和之氯化鈉水溶液洗滌之，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 19:1)純化後，結果得 190 毫克(0.62 毫莫耳，60%)之 3-(2-乙醯基-5-三級-丁基苯基胺基)-3-氧基丙酸乙酯。

b) 7-三級-丁基-2-羥基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯
(7-tert.-Butyl-2-hydroxy-4-methyl-chinolin-3-carbon-säure ethylester)之合成

將 30 毫克(0.68 毫莫耳，60%之礦物油溶液)之氫化鈉添加至一由 190 毫克(0.62 毫莫耳)之 3-(2-乙醯基-5-三級-丁基苯胺基)-3-氧基丙酸乙酯
(3-(2-Acetyl-5-tert.-butylphenylamino)-3-oxopropansäure ethylester)溶於乙醇(EtOH)(2 毫升)所組成之溶液中，並於 80°C 下加熱 2 小時。然後以水稀釋該溶液，並以 5N 之乙酸將溶液酸化。接著以乙酸乙酯萃取該溶液。有機相部份則以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 150 毫克(0.52 毫莫耳，84%)之殘留物，7-三級-丁基-2-羥基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯，

其於無進一步之純化下繼續被反應。

c) 7-三級-丁基-2-氯-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯 (7-tert.-Butyl-2-chlor-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)之合成
將一由 150 毫克(0.52 毫莫耳)之 7-三級-丁基-2-羥基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯 (7-tert.-Butyl-2-hydroxy-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)及三氯氧磷(1 毫升)所組成之混合物於 150°C 下加熱 2 小時。然後將該反應溶液倒入冰水(15 毫升)中，並以飽和之碳酸氫鈉水溶液將其 pH 值調整成鹼性。接著以乙酸乙酯萃取該溶液，有機相部份則以飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 140 毫克(0.46 毫莫耳，88%)之殘留物，7-三級-丁基-2-氯-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯，其於無進一步之純化下繼續被反應。

d) 7-三級-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯 (7-tert.-Butyl-2-ethylsulfanyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)之合成

將 190 毫克(1.38 毫莫耳)之碳酸鉀及 100 微升(1.38 毫莫耳)之乙硫醇添加至一由 140 毫克(0.46 毫莫耳)之 7-三級-丁基-2-氯-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯 (7-tert.-Butyl-2-chlor-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)溶於二甲基甲醯胺 (3 毫升)所組成之溶液中，並於 60°C 下攪拌 16 小時。接著以水稀釋該溶液，並以乙酸乙酯萃取該溶液。有機相部份則以飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 19:1)純化後，結果得 100 毫克(0.30 毫莫耳，65%)之 7-三級-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯。

e) 7-三級-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸 (7-tert.-Butyl-2-ethylsulfanyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure)之合成

將一由 600 毫克 (14.36 毫莫耳) 之氫氧化鋰單水合物 (Lithiumhydroxidmonohydrat) 溶於水 (30 毫升) 所組成之溶液添加至一由 1.7 公克 (5.1 毫莫耳) 之 7-三級-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯 (7-tert.-Butyl-2-ethylsulfanyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester) 溶於四氫呋喃/甲醇之混合液 (2:1 vv, 30 毫升) 所組成之溶液中，然後將此反應溶液於 60°C 下攪拌 16 小時。將溶液於真空下濃縮，並將殘留物溶解於水中，然後以乙酸乙酯洗滌之。水相部份則以 1M 之氫氯酸水溶液將溶液之 pH 值調整至 2，然後以乙酸乙酯萃取之。有機相部份則以飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 420 毫克 (1.38 毫莫耳, 27%) 之殘留物，7-三級-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸，其於無進一步之純化下繼續被反應。

中間產物 VVV30 之合成：2-乙基硫基-6,7-二氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸 (2-Ethylsulfanyl-6,7-difluor-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure)

a) 6,7-二氟-2-羥基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯 (6,7-difluor-2-hydroxyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester) 之合成

依據中間產物 VVV22 之步驟 a) 及 b) 所述之方法，由 1-(2-氨基-4,5-二氟苯基) 乙酮 (1-(2-Amino-4,5-difluor-phenyl) ethanon) 合成得 6,7-二氟-2-羥基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯。

b) 2-乙基硫基-6,7-二氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯 (2-Ethylsulfanyl-6,7-difluor-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester) 之合成

室溫下，將 3.4 公克 (8.2 毫莫耳) 之 Lawesson 試劑添加至一由 550 毫克 (2.1 毫莫耳) 之 6,7-二氟-2-羥基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯

(6,7-difluor-2-hydroxyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester) 溶於吡啶/甲苯之混合液(1:10 vv, 6 毫升)所組成之溶液中，然後將此反應溶液於 80°C 下加熱 3 小時。接著於此溶液中添加入飽和之碳酸氫鈉水溶液(20 毫升)以終止反應之進行，並以乙酸乙酯(3 x 60 毫升)萃取之。合併後之有機相則以水洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。將所得之殘留物(450 毫克)溶解於二甲基甲醯胺(DMF)(6 毫升)中，然後於該溶液中添加入 660 毫克(4.8 毫莫耳)之碳酸鉀及 740 毫克(4.8 毫莫耳)之碘乙烷。將此反應溶液於 50°C 下加熱 30 分鐘。然後加水(60 毫升)稀釋該溶液，接著以乙酸乙酯(3 x 80 毫升)萃取之。合併後之有機相以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 19:1)純化後，結果得 300 毫克(0.96 毫莫耳，47%)之 2-乙基硫基-6,7-二氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯。

c) 2-乙基硫基-6,7-二氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸(2-Ethylsulfanyl-6,7-difluor-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure)之合成

依據中間產物 VVV22 之步驟 e)所述之方法，由 400 毫克(1.3 毫莫耳)之 2-乙基硫基-6,7-二氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯(2-Ethylsulfanyl-6,7-difluor-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)合成得 220 毫克(0.78 毫莫耳，60%)之 2-乙基硫基-6,7-二氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸。

中間產物 VVV39 之合成：7-二甲胺基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯

(7-Dimethylamino-2-ethylsulfanyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)

a) 2-乙基硫基-7-氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯(2-ethylsulfanyl-7-fluor-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)之合

成依據中間產物 VVV30 之步驟 a)及 b)所述之方法，由 1-(2-胺基-4-氟苯基)乙酮(1-(2-Amino-4-fluorphenyl)ethanon)合成得 2-乙基硫基-7-氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯。

b) 7-二甲胺基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯
(7-Dimethylamino-2-ethylsulfanyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)之合成

將 2.8 公克(20.5 毫莫耳)之碳酸鉀及 40%之二乙胺水溶液(20.5 毫升)添加至一由 2.0 公克(6.8 毫莫耳)之 2-乙基硫基-7-氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯

(6,7-Difluor-2-hydroxyl-4-methyl-chinolin-3-carbonsäure ethylester)溶於乙醇(20 毫升)所組成之溶液中，然後於 90°C 下於一密閉容器中加熱 16 小時。接著將反應溶液於真空下濃縮，並將殘留物溶解於水中。然後以乙酸乙酯萃取該溶液。有機相則以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 25:1)純化後，結果得 810 毫克(2.55 毫莫耳，38%)之 7-二甲胺基-2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯。

中間產物 VVV41 之合成：2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-羧基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺

(2-Ethyl-sulfanyl-N-[(3-fluorphenyl)-methyl]-4-hydroxy-7-(trifluormethyl)-chinolin-3-carboxamid)

a) N-(1-乙基硫基-2-(1-氧基丁基)-亞己-3-酮]-3-(三氟甲基)苯胺
(N-(1-Ethylthio)-2-(1-oxybutyl)-hexan-3-onyliden)-3-(trifluormethyl)-anilin)之合成

將一由 7.2 公克(45.0 毫莫耳)之丙二酸二乙酯(Diethylmalonat)溶於二甲

基甲醯胺 (10 毫升)所組成之溶液添加至一由 2.0 公克(41.2 毫莫耳)之氯化鈉溶於二甲基甲醯胺(120 毫升)所組成之溶液中，並室溫下攪拌 30 分鐘。接著於該溶液中添加入一由 10.0 公克(37.5 毫莫耳)之 N-(1-氯-1-乙基硫基-亞甲基)-3-(三氟甲基)苯胺(N-(1-Chlor-1-ethylthio-methylene)-3-(trifluormethyl)-aniline)溶於二甲基甲醯胺(10 毫升)所組成之溶液，並將該反應溶液於 100°C 下加熱 30 分鐘。然後加水稀釋該溶液，並以乙醚萃取之。有機相部份以水洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 4.5 公克(11.5 毫莫耳，31%)之殘留物，N-(1-乙基硫基-2-(1-氧基丁基)-亞己-3-酮]-3-(三氟甲基)苯胺，其於無進一步之純化下繼續被反應。

b) 2-(乙基硫基)-4-羥基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯
(2-(ethylthio)-4-hydroxy-7-(trifluormethyl)quinoline-3-carbonsäure ethylester)之合成

將 4.0 公克(10.2 毫莫耳)之 N-(1-乙基硫基-2-(1-氧基丁基)-亞己-3-酮]-3-(三氟甲基)苯胺

(N-(1-Ethylthio)-2-(1-oxybutyl)-hexan-3-onyliden)-3-(trifluormethyl)-anilin)於真空下於 180°C 下加熱 1 小時。經冷卻至室溫，及殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 249:1)純化後，結果得 1.0 公克(2.9 毫莫耳，28%)之 2-(乙基硫基)-4-羥基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯。

c) 2-(乙基硫基)-N-(3-氟苯基)-4-羥基-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺
(2-(Ethylthio)-N-(3-fluorphenyl)-4-hydroxy-7-(trifluormethyl)quinoline-3-carboxamid)之合成

依序將 5.8 毫升(11.6 毫莫耳，2M 之甲苯溶液)之三甲基鋁及 1.5 公克(11.6 毫莫耳)之 3-氟-苯甲胺(3-Fluor-benzylamin)添加至一由 1.0 公克(2.9 毫莫耳)之 2-(乙基硫基)-4-羥基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯
(2-(Ethylthio)-4-hydroxy-7-(trifluor-methyl)quinoline-3-carbonsäure

ethylester)溶於甲苯 (18 毫升)所組成之溶液中，然後將溶液於 80℃下加熱 2 小時。接著加水稀釋該溶液，並以乙酸乙酯萃取之。有機相繼而以 1M 之氫氯酸水溶液、水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 17：3)純化後，結果得 0.9 公克(2.1 毫莫耳，73%)之 2-(乙基硫基)-N-(3-氟苯基)-4-羥基-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺。

其他中間產物之合成

其他之中間產物係依據前述之方法進行合成。表 1 中列舉出化合物及其所依據之合成方法。習知技藝人士知曉每種方法中所使用之反應物及試劑。

表 1：

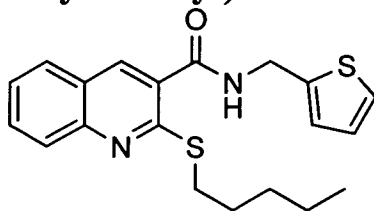
中間產物	化學名稱	依據中間產物之合成方法
VVV09	2-氯-N-(環己基甲基)喹啉-3-甲醯胺	VVV01
VVV10	2-氯-N-(2-環己基乙基)喹啉-3-甲醯胺	VVV01
VVV11	2-氯-N-(3,3-二甲基丁基)喹啉-3-甲醯胺	VVV01
VVV12	2-氯-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV03
VVV13	2-氯-N-(噻吩-2-基甲基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV01
VVV14	2-(3-甲氧基-3-氧基丙基硫基)-6-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV04
VVV15	2-氯-5-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV03
VVV16	2-氯-N-(噻吩-2-基甲基)-5-(三氟甲基)喹	VVV01

	啉-3-羧酸	
VVV18	4-甲基-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV08
VVV19	2-(三級-丁基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV21	2-乙基硫基-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV23	2-乙基硫基-7-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV24	2-乙基硫基-4,6-二甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV25	2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基氧基)喹啉-3-羧酸乙酯	VVV22 無步驟 e)
VVV26	4-乙基-2-乙基硫基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV08
VVV27	2-乙基硫基-4-異丙基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸	VVV08
VVV28	2-乙基硫基-8-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-羧酸乙酯	VVV22 無步驟 e)
VVV29	2-乙基硫基-4-甲基-8-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸乙酯	VVV22 無步驟 e)
VVV31	2-乙基硫基-5-氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV30
VVV32	2-乙基硫基-8-氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV30
VVV33	2-乙基硫基-7-氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV34	2-乙基硫基-6-氟-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV35	2-乙基硫基-4,7-二甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV36	2-乙基硫基-5-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV37	2-乙基硫基-6-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22
VVV38	2-乙基硫基-4-甲氧基-6-三氟甲基-喹啉-3-羧酸	VVV22

VVV40	2-乙基硫基-4-甲基-7-嗎啉-4-基-喹啉-3-羧酸	VVV39+ VVV22 步 驟 e)
-------	------------------------------	---------------------------

範例化合物之合成

範例化合物 1 之合成：2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺
(2-(Pentylthio)-N-(2-thienyl-methyl)-3-chinolin-carboxamid)

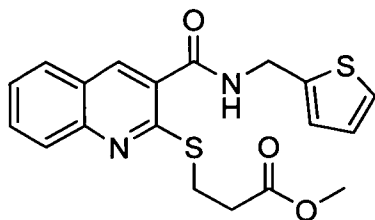


室溫下，將 151 毫克(1.1 毫莫耳)之碳酸鉀添加至一由 300 毫克(1.0 毫莫耳)之 2-巯基-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺(2-Mercapto-N-(thiophen-2-ylmethyl)chinolin-3-carboxamid)(中間產物 VVV02)溶於二甲基甲醯胺(2.3 毫升)所組成之溶液中，並攪拌該溶液 30 分鐘。接著將 131 微升(1.0 毫莫耳)之 1-碘戊烷(1-Iodpentan)添加至前述之溶液中，並室溫下繼續攪拌該溶液 3 小時。接著於真空下將溶液濃縮，並以乙酸乙酯溶解所得之殘留物，然後以水洗滌之。水相部份然後以乙酸乙酯萃取，合併後之有機相則以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由乙酸乙酯之結晶純化後，結果得 146 毫克(0.4 毫莫耳，39%)之 2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺。質量光譜： m/z 371.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 2 之合成：3-[[3-[氧基-(2-噻吩基甲胺基)甲基]-2-噻啉基]

硫基}丙酸甲酯

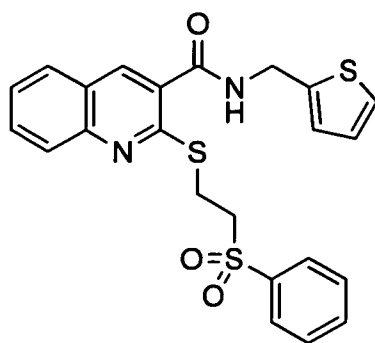
(3-{[3-[Oxo-(2-thienylmethylamino)methyl]-2-chinoly]thio}propansäuremethylester)



將一由 361 毫克 (3.0 毫莫耳) 之 3- 巯基丙酸甲酯 (3-Mercaptopropansäuremethylester) 溶於二甲基甲醯胺 (18 毫升) 所組成之溶液冷卻至 0°C，然後於溶液中添加入 336.6 毫克 (3.0 毫莫耳) 之三級-丁酸鉀，然後於此溫度下攪拌 10 分鐘。接著再於溶液中添加入 908 毫克 (3.0 毫莫耳) 之 2-氯-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺 (2-Chlor-N-(thiophen-2-yl-methyl)chinolin-3-carboxamid) (中間產物 VVV01)，然後緩緩將溶液加熱至 50°C，並於此溫度下攪拌 16 小時。將溶液以乙酸乙酯稀釋，並以飽和之氯化銨水溶液洗滌之。水相接著以乙酸乙酯萃取之。合併後之有機相則以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由管柱色層分析法 (己烷/乙酸乙酯 4:1) 純化後，結果得 614 毫克 (1.6 毫莫耳, 53%) 之 3-{[3-[氧基-(2-噻吩基甲胺基)甲基]-2-喹啉基]硫基}丙酸甲酯。質量光譜：m/z 387.1 [M+H]⁺。

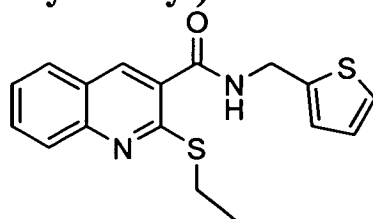
範例化合物 5 之合成：2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺

(2-[2-(Phenylsulfonyl)ethylthio]-N-(2-thienyl-methyl)-3-chinolincarboxamid)



於 0°C 下，將 112 毫克(1.0 毫莫耳)之三級-丁酸鉀添加至一由 202 毫克(1.0 毫莫耳)之 2-(苯磺酰基)乙硫醇(2-(Phenylsulfonyl)ethanthiol)溶於二甲基甲醯胺 (6 毫升)所組成之溶液中，並於 0°C 下攪拌該溶液 10 分鐘。然後於 0°C 下將 303 毫克(1.0 毫莫耳)之 2-氯-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺(2-Chlor-N-(thiophen-2-ylmethyl)chinolin-3-carboxamid)(中間產物 VVV01)添加至前述之溶液中，並緩緩將溶液加熱至 50°C，接著於此溫度下攪拌溶液 16 小時。於經冷卻至室溫後，加入乙酸乙酯稀釋該溶液，並以飽和之氯化銨水溶液洗滌之。水相接著以乙酸乙酯萃取之。合併後之有機相則以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 4:1)純化後，結果得 326 毫克(0.7 毫莫耳，70%)之 2-[2-(苯磺酰基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺。質量光譜： m/z 469.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 7 之合成：2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺
(2-(Ethylthio)-N-(2-thienylmethyl)-3-chinolinocarboxamid)

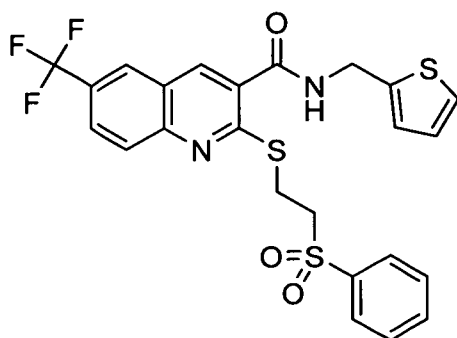


將 92 毫克(1.1 毫莫耳)之乙硫醇鈉(Natriumthioethanolat)添加至一由 303 毫克(1.0 毫莫耳)之 2-氯-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺

(2-Chlor-N-(thiophen-2-ylmethyl)chinolin-3-carboxamid)(中 間 產 物 VVV01)溶於乙醇(10 毫升)所組成之溶液中，並於回流下加熱 90 分鐘。接著將溶液倒入水中，並以乙酸乙酯萃取該溶液數次。合併後之有機相則以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由(乙酸乙酯/己烷)之結晶純化後，結果得 103 毫克(0.3 毫莫耳，31%)之 2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺。質量光譜： m/z 329.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 8 之合成：2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺

(2-[2-(Phenylsulfonyl)ethylthio]-N-(2-thienylmethyl)-6-(trifluormethyl)-3-chinolincarboxamid)

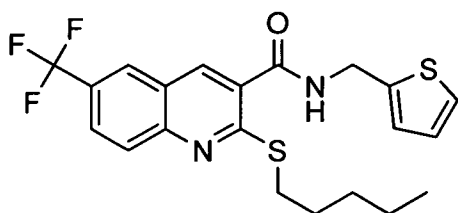


將 456 毫克(1.2 毫莫耳)之 N,N,N',N'-四甲基-O-(7-氮雜苯並三氮唑-1-基)脲六氟磷酸酯及 680 微升(4.0 毫莫耳)之 N,N'-二異丙基乙胺(DIPEA)添加至一由 441 毫克(1.0 毫莫耳)之 2-(2-(苯磺醯基)乙基硫基)-6-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸(2-(2-(Phenylsulfonyl)ethylthio)-6-(trifluormethyl)chinolin-3-carbonsäure)(中間產物 VVV04)溶於二甲基甲醯胺 (5 毫升)所組成之溶液中，並室溫下攪拌該溶液 15 小時。然後加入乙酸乙酯稀釋該溶液，並隨之以飽和之氯化銨水溶液、飽和之碳酸氫鈉水溶液及飽和之氯化鈉水溶液洗滌之。有機相則繼而以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由管柱色層分析法(己烷/

乙酸乙酯 7:3)純化後，結果得 107 毫克(0.2 毫莫耳，20%)之 2-[2-(苯磺基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺。質量光譜： m/z 537.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 11 之合成：2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺

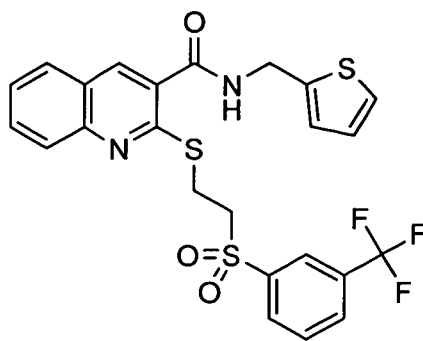
(2-(Pentylthio)-N-(2-thienylmethyl)-6-(trifluormethyl)-3-chinolin-carboxamid)



將 198 毫克(8.6 毫莫耳)之鈉緩緩添加至甲醇(86 毫升)中，並將此溶液室溫下攪拌 5 分鐘。接著室溫下將一由 455 毫克(1.0 毫莫耳)之 3-(3-(噻吩-2-基甲基胺基甲醯基)-6-(三氟甲基)喹啉-2-基硫基]丙酸甲酯(3-(3-(Thiophen-2-ylmethylcarbamoyl)-6-(trifluormethyl)chinolin-2-ylthio)propansäuremethylester)(範例 26)溶於甲醇(10 毫升)所組成之溶液添加至前述之溶液中。將此反應溶液接著於 70°C 下加熱 30 分鐘。然後室溫下將 396 微升(3.0 毫莫耳)之 1-碘戊烷(1-Iodpentan)添加至溶液中，並隨之室溫下攪拌 1 小時。將溶液於真空下濃縮，接著以乙酸乙酯溶解所得之殘留物。將所生成之溶液以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，有機相部份則繼而以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。結果得 167 毫克(0.4 毫莫耳，38%)之殘留物，2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺。質量光譜： m/z 439.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 13 之合成：N-(2-噻吩基甲基)-2-[2-[3-(三氟甲基)苯基]磺醯基乙基硫基]-3-喹啉甲醯胺

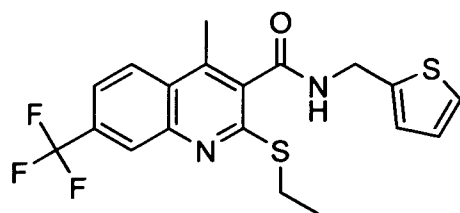
(N-(2-Thienylmethyl)-2-[2-[3-(trifluormethyl)-phenyl]sulfonylthio]-3-chinolincarboxamid)



室溫下，將 151 毫克(1.1 毫莫耳)之碳酸鉀及 300 毫克(1.1 毫莫耳)之 1-(2-氯乙基磺醯基)-3-(三氟甲基)苯(1-(2-Chlorethylsulfonyl)-3-(trifluormethyl)benzol)添加至一由 300 毫克(1.0 毫莫耳)之 2-巰基-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺(2-Mercapto-N-(thiophen-2-ylmethyl)chinolin-3-carboxamid)(中間產物 VVV02)溶於丙酮(10 毫升)所組成之溶液中，並將該溶液於 70°C 下加熱 3 小時。然後將溶液過濾，並將濾液於真空下濃縮。將殘留物溶解於乙酸乙酯中，並以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由管柱色層分析法(二氯甲烷/乙酸乙酯 20：1)純化後，結果得 163 毫克(0.3 毫莫耳，30%)之 N-(2-噻吩基甲基)-2-[2-[3-(三氟甲基)苯基]磺醯基乙基硫基]-3-喹啉甲醯胺。質量光譜：m/z 537.1 [M+H]⁺。

範例化合物 30 之合成：2-乙基硫基-4-甲基-N-(噻吩-2-基甲基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺

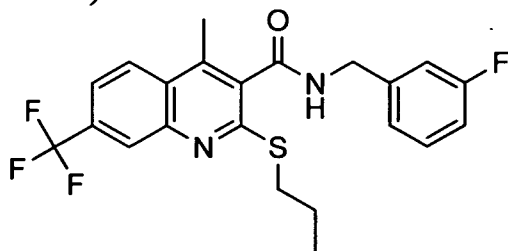
(2-Ethylsulfanyl-4-methyl-N-(thiophen-2-ylmethyl)-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carboxamid)



依序將 134 微升(1.3 毫莫耳)之噻吩甲胺(Thiophenmethanamin)、438 毫克(1.1 毫莫耳)之 N,N,N',N'-四甲基-O-(7-氮雜苯並三氮唑-1-基)脲六氟磷酸酯及 420 微升(3.0 毫莫耳)之三乙胺添加至一由 330 毫克(1.05 毫莫耳)之 2-(乙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-羧酸(2-(Ethylthio)-4-methyl-7-(trifluor-methyl)quinolin-3-carbonsäure)(中間產物 VVV08)溶於四氫呋喃(8 毫升)所組成之溶液中，然後將溶液於 50°C 下加熱 24 小時。接著加入乙酸乙酯稀釋該溶液，並以 4M 之氯化銨水溶液、1M 之碳酸鈉水溶液及飽和之氯化鈉水溶液洗滌之。有機相繼而以硫酸鎂乾燥去除水分，並接著將其通過一矽膠層過濾。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 7:3)純化後，結果得 277 毫克(0.67 毫莫耳，65%)之 2-乙基硫基-4-甲基-N-(噻吩-2-基甲基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺。質量光譜： m/z 411.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 46 之合成：N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(丙基硫基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺

(N-[(3-Fluorophenyl)methyl]-4-methyl-2-(propylsulfanyl)-7-(trifluoromethyl)-chinolin-3-carboxamid)

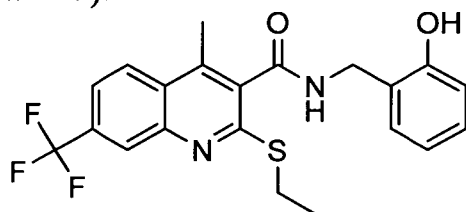


將 209 毫克(1.5 毫莫耳)之碳酸鉀及 137 微升(1.5 毫莫耳)之丙硫醇添加至一由 200 毫克(0.5 毫莫耳)之 2-氯-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺(2-Chlor-N-[(3-fluor-phenyl)methyl]-4-methyl-7-(trifl

uormethyl)chinolin-3-carboxamid)(中間產物 VVV17)溶於二甲基甲醯胺(DMF)(4 毫升)所組成之溶液中，並將該溶液於 40°C 下於一密閉之容器中加熱 72 小時。經冷卻至室溫後，加水稀釋該溶液，並以乙酸乙酯萃取之。有機相繼而以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鎂乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 3:1)純化後，結果得 146 毫克(0.33 毫莫耳，67%)之 N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(丙基硫基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺。質量光譜： m/z 437.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 112 之合成：2-乙基硫基-N-[(2-羥基苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺

(2-Ethylsulfanyl-N-[(2-hydroxyphenyl)methyl]-4-methyl-7-(trifluoromethyl)-chinolin-3-carboxamid).

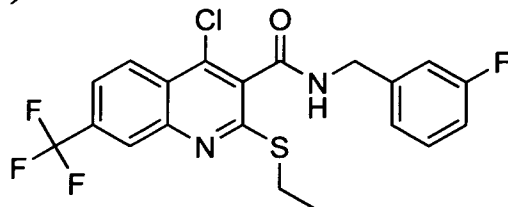


將一由 350 毫克(0.8 毫莫耳)之 2-乙基硫基-N-[(2-甲氧基苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺(2-Ethylsulfanyl-N-[(2-methoxyphenyl)methyl]-4-methyl-7-(trifluoromethyl)-chinolin-3-carboxamid)(範例 84)溶於二氯甲烷 (10 毫升)所組成之溶液冷卻至 0°C。於此溫度下將 500 微升(4.9 毫莫耳)之三溴化硼(Bortribromid)以滴流之方式添加至前述之溶液中。接著室溫下攪拌 90 分鐘。然後以水稀釋該溶液，並以二氯甲烷萃取之。有機相部份則以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌之，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 4:1)純化後，結果得 240 毫克(0.57 毫莫耳，70%)之 2-乙基硫基-N-[(2-羥基苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲

基)-喹啉-3-甲醯胺。質量光譜： m/z 421.1 $[M+H]^+$ 。

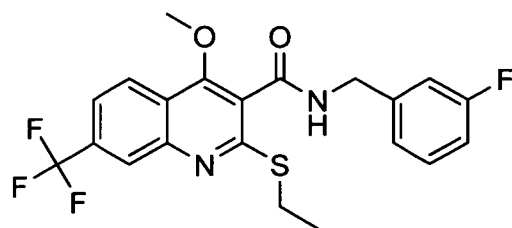
範例化合物 122 之合成：4-氯-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺

(4-Chlor-2-ethylsulfanyl-N-[(3-fluorophenyl)methyl]-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carboxamid)



將一由 1.0 公克(2.36 毫莫耳)之 2-(乙基硫基)-N-(3-氟苯基)-4-羥基-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺 (2-(Ethylthiol)-N-(3-fluorbenzyl)-4-hydroxy-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carboxamid)及三氯氧磷(POCl_3)(10 毫升)所組成之混合物於 130°C 下加熱 2 小時。經冷卻至室溫後，加入飽和之碳酸氫鈉水溶液將溶液之 pH 值調整至大約 8 左右，並接著以乙酸乙酯萃取之。有機相部份繼而以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 22:3)純化後，結果得 0.5 公克(1.1 毫莫耳，48%)之 4-氯-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺。質量光譜： m/z 443.1 $[M+H]^+$ 。

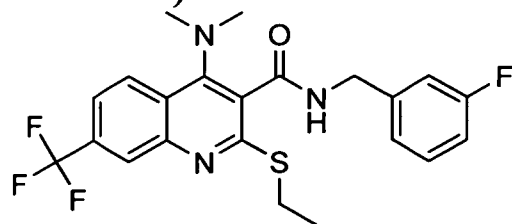
範例化合物 130 之合成：2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲氧基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺
(2-Ethylsulfanyl-N-[(3-fluorophenyl)methyl]-4-methoxy-7-(trifluormethyl)-chinolin-3-carboxamid)



室溫下，將 20 毫克(0.95 毫莫耳)之鈉添加至甲醇(6 毫升)中。當鈉完全溶解後，將一由 210 毫克(0.47 毫莫耳)之 4-氯-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺(4-Chlor-2-ethylsulfanyl-N-[(3-fluorophenyl)methyl]-7-(trifluormethyl)-chinolin-3-carboxamid)(範例 122)溶於甲醇(2 毫升)所組成之溶液室溫下添加至前述之溶液中。接著將反應溶液於 60 下加熱 30 分鐘。然後將溶液於真空下濃縮，並以水溶解所得之殘留物，然後以乙酸乙酯萃取之。有機相部份繼而以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 9:1)純化後，結果得 80 毫克(0.18 毫莫耳，38%)之 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲氧基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺。質量光譜： m/z 439.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 131 之合成：4-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺

(4-Dimethylamino-2-ethylsulfanyl-N-[(3-fluorophenyl)methyl]-7-(trifluoromethyl)-chinolin-3-carboxamid)

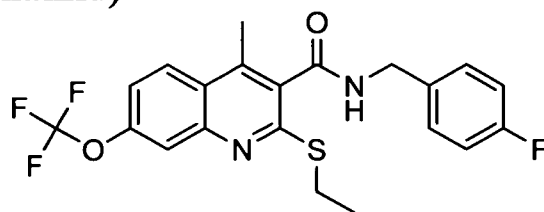


室溫下，將 60 毫克(0.45 毫莫耳)之碳酸鉀及 0.7 毫升(1.36 毫莫耳，2M 之四氫呋喃溶液)之二甲基胺添加至一由 200 毫克(0.45 毫莫耳)之 4-氯-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺

(4-Chlor-2-ethylsulfanyl-N-[(3-fluorphenyl)-methyl]-7-(trifluormethyl)chinolin-3-carboxamid)(範例 122)溶於二甲基甲醯胺(DMF)(3 毫升)所組成之溶液中，並將該溶液於 80°C 下於一密閉之容器中加熱 150 分鐘。加水稀釋該溶液，並以乙酸乙酯萃取之。有機相繼而以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。殘留物於經由管柱色層分析法(己烷/乙酸乙酯 17:3)純化後，結果得 120 毫克(0.27 毫莫耳，60%)之 4-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺。質量光譜： m/z 452.1 $[M+H]^+$ 。

範例化合物 132 之合成：2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基氧基)-喹啉-3-甲醯胺

(2-Ethylsulfanyl-N-[(4-fluorphenyl)-methyl]-4-methyl-7-(trifluoromethoxy)-chinolin-3-carboxamid)



依序將 1.12 毫升(2.24 毫莫耳，2M 之甲苯溶液)之三甲基鋁及 260 微升(2.24 毫莫耳)之 4-氟-苄胺(4-Fluor-benzylamin)添加至一由 200 毫克(0.56 毫莫耳)之 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基氧基)喹啉-3-羧酸乙酯(2-Ethylsulfanyl-4-methyl-7-(trifluoromethoxy)-chinolin-3-carbonsäure ethylester)(VVV25)溶於甲苯(7 毫升)所組成之溶液中，然後將溶液於 90°C 下加熱 3 小時。接著加入 0.5M 之氫氯酸水溶液稀釋該溶液，並以乙酸乙酯萃取之。有機相繼而以水及飽和之氯化鈉水溶液洗滌，再以

硫酸鈉乾燥去除水分，然後將其過濾，並於真空下加以濃縮。於殘留物經由管柱色層分析法(己烷/二氯甲烷 3：2)純化後，結果得 150 毫克(0.34 毫莫耳，61%)之 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基氧基)-喹啉-3-甲醯胺。質量光譜： m/z 439.1 $[M+H]^+$ 。

其他範例化合物之合成

其他之範例化合物係依據前述之方法進行合成。表 2 中列舉出化合物及其所依據之合成方法。習知技藝人士知曉每種方法中所使用之反應物及試劑。

表 2：

範例 化合物	化學名稱	依據中 間產物 之合成 方法	質量光 譜 m/z $[M+H]^+$
3	2-(3-環己基-丙基硫基)-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	1	425.2
4	2-(3-苯基-丙基硫基)-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	1	419.1
6	2-[3-(4-氟苯基)丙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	13	437.1
9	2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺	5	537.1
10	2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)-5-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺	5	537.1

12	2-乙基硫基-N-(噻吩-2-基甲基)-6-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺	11	397.1
14	2-乙基硫基-N-(噻吩-2-基甲基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺	11	397.1
15	2-(戊基硫基)-N-(噻吩-2-基甲基)-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺	11	439.1
16	2-[2-[(4-氟苯基)磺基]乙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	13	487.1
17	2-[2-(對-甲苯基磺基)乙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	13	483.1
18	2-[2-(對-甲苯基硫基)乙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	13	451.1
19	2-[2-(苯磺基)乙基硫基]-N-(環己基甲基)喹啉-3-甲醯胺	5	469.2
20	2-[3-(對甲苯基)丙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	13	433.1
21	2-(2-苯基硫基-乙基硫基)-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	13	437.1
22	2-[2-(苯磺基)乙基硫基]-N-(2-環己基乙基)喹啉-3-甲醯胺	5	483.2
23	2-[2-(苯磺基)乙基硫基]-N-(3,3-二甲基丁基)喹啉-3-甲醯胺	5	457.2
24	2-[2-[(4-氟苯基)硫基]乙基硫基]-N-(噻吩-2-基甲基)喹啉-3-甲醯胺	13	455.1

25	N-(3,3-二甲基丁基)-2-(乙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)喹啉-3-甲醯胺	8	399.2
26	3-[[3-(噻吩-2-基甲基胺基甲醯基)-6-(三氟甲基)喹啉-2-基]硫基]丙酸甲酯	8	455.1
27	3-[[3-(噻吩-2-基甲基胺基甲醯基)-7-(三氟甲基)喹啉-2-基]硫基]丙酸甲酯	2	455.1
28	N-(2,2-二甲基丙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	385.1
29	N-(環庚基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	425.2
31	N-[(3,4-二氟苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	441.1
32	N-[(2,4-二氟苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	441.1
33	2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[(3,4,5-三氟苯基)甲基]-喹啉-3-甲醯胺	30	459.1
34	2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[(2,4,5-三氟苯基)甲基]-喹啉-3-甲醯胺	30	459.1
35	2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-4-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	406.1

36	N-[(4-三級-丁基-苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	461.2
37	2-乙基硫基-4-甲基-N-(3-甲基-丁基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	385.1
38	2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[(三氟甲基)苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺	30	473.1
39	2-乙基硫基-4-甲基-N-苄基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	419.1
40	2-乙基硫基-4-甲基-N-(3-苄基-丙基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	433.1
41	2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	406.1
42	2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-3-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	406.1
43	2-乙基硫基-4-甲基-N-(萘-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	455.1
44	2-乙基硫基-4-甲基-N-(噻唑-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	412.1
45	2-乙基硫基-4-甲基-N-([1, 3,4]噁二唑-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	397.1
47	N-[(3-氟苯基)甲基]-2-(異丙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	46	437.1
48	2-(環戊基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	46	463.1

49	2-(丁基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	46	451.1
50	N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(戊基硫基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	46	465.2
51	N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(1-甲基-丙基硫基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	46	451.1
52	2-(環己基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	46	477.2
53	N-(2-環戊基-乙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	411.2
54	N-(3-環戊基-丙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	425.2
55	2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺	30	473.1
56	N-[(3-三級-丁基-苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	461.2
57	2-乙基硫基-4-甲基-N-(4-甲基戊基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	399.2
58	2-苯甲基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	46	485.1
59	2-乙基硫基-N-[(3-氟-2-甲氧基-苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	453.1

60	2-乙基硫基-N-[(5-氟-2-甲氧基-苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	453.1
61	N-[(3,4-二甲基苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	433.1
62	2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[[4-(三氟甲基硫基)苯基]甲基]-喹啉-3-甲酰胺	30	505.1
63	N-(環己基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	411.2
64	2-乙基硫基-4-甲基-N-(四氫吡喃-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	413.1
65	2-乙基硫基-4-甲基-N-丙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	357.1
66	N-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	371.1
67	2-乙基硫基-N-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	373.1
68	2-乙基硫基-4-甲基-N-戊基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	385.1
69	2-乙基硫基-4-甲基-N-[(5-甲基-噻吩-2-基)甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	425.1
70	2-乙基硫基-4-甲基-N-[(4-甲基-噻吩-2-基)甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	425.1
71	N-[(5-氟-噻吩-2-基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	445

72	2-乙基硫基-4-甲基-N-(2-噻吩-2-基-乙基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	425.1
73	N-(5-雙環[2.2.1]庚基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	423.2
74	N-苯甲基-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	405.1
75	2-乙基硫基-N-[(2-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	423.1
76	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	423.1
77	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	423.1
78	N-[(2-氯苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	439.1
79	N-[(3-氯苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	439.1
80	N-[(4-氯苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	439.1
81	2-乙基硫基-4-甲基-N-(鄰-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	419.1
82	2-乙基硫基-4-甲基-N-(間-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	419.1

83	2-乙基硫基-4-甲基-N-(對-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	419.1
84	2-乙基硫基-N-[(2-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	435.1
85	2-乙基硫基-N-[(3-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	435.1
86	2-乙基硫基-N-[(4-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	435.1
87	N-[(3,5-二氟-苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	441.1
88	4-甲基-2-甲基硫基-N-(噻吩-2-基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	397.1
89	2-(三級-丁基硫基)-4-甲基-N-(噻吩-2-基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	439.1
90	N-(2,2-二甲基-丙基)-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	371.1
91	2-乙基硫基-4-甲基-N-(噻吩-2-基-甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	343.1
92	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	355.1
93	2-(三級-丁基硫基)-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	451.1

94	2-(三級-丁基硫基)-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	451.1
95	7-三級-丁基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	411.2
96	7-三級-丁基-2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	411.2
97	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	385.1
98	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-7-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	385.1
99	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4,6-二甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	369.1
100	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4,6-二甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	369.1
101	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-6-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	385.1
102	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-6-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	385.1
103	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-6-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	423.1
104	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-6-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺	30	423.1
105	2-乙基硫基-7-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	373.1
106	2-乙基硫基-7-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺	30	373.1

107	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4,7-二甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	369.1
108	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4,7-二甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	369.1
109	2-乙基硫基-6,7-二氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	391.1
110	2-乙基硫基-N-(呋喃-2-基-甲基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	395.1
111	2-乙基硫基-4-甲基-N-[(5-甲基-呋喃-2-基)-甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	409.1
113	2-乙基硫基-N-[(3-羟基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	112	421.1
114	N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	409.1
115	N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	409.1
116	2-乙基硫基-6-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	373.1
117	2-乙基硫基-6-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	373.1
118	2-乙基硫基-6,7-二氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	391.1
119	2-乙基硫基-N-[(4-羟基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	112	421.1

120	2-乙基硫基-8-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	373.1
121	2-乙基硫基-8-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	373.1
123	2-乙基硫基-5-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	373.1
124	2-乙基硫基-5-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	373.1
125	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-5-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	385.1
126	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-5-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	30	385.1
127	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-5-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	112	371.1
128	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-6-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	112	371.1
129	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	112	371.1
133	7-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	132	398.2
134	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-吗啉-4-基-喹啉-3-甲酰胺	30	440.2
135	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-吗啉-4-基-喹啉-3-甲酰胺	30	440.2
136	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-8-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	132	423.1

137	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-8-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	132	423.1
138	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-8-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	132	385.1
139	2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-8-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	132	385.1
140	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-8-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	112	371.1
141	7-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺	132	398.2
142	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基氧基)-喹啉-3-甲酰胺	132	439.1
143	4-乙基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	437.1
144	2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-異丙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺	30	451.1

藥理試驗

使用一對電壓敏感之染劑之螢光測量法

將表現人類 KCNQ2/3 通道之中國倉鼠卵巢(CHO)-K1-細胞於 37°C 下，5%二氧化碳(CO₂)及 95%空氣濕度下以貼生之方式培養於含有含 10%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%小牛血清(Invitrogen，#10270-106，經加熱去除活性)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 1 x 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瓶底分離(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 CorningTM CellBINDTM 型(淺式透明底部黑色之聚苯乙烯微孔細胞培養盤，#3340)96 孔之測量盤中。接著於無氣體之供應下或於無空氣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(CO₂)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 mM 之氯化鈉、1 mM 之氯化鉀、10 mM 之 HEPES、2 mM 之氯化鈣、2 mM 之氯化鎂、10 mM

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 微升前面所配製之染劑溶液添加至細胞中，然後將細胞室溫及避光之下培養 45 分鐘。

螢光之測量係以 BMG Labtech FLUOstar™、BMG Labtech NOVOstar™ 或 BMG Labtech POLARstar™ 儀器(激發波長 525 nm，發射波長 560 nm，底部讀值模式)進行之。經以染劑培養後，將 50 微升所需濃度之待測物質或 50 微升作為對照組之 ES 緩衝溶液添加至該測量盤之個別小孔中，然後將其室溫及避光之下培養 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 F_1 。緊接著於每個小孔中添加 15 微升之 100 mM 氯化鉀溶液(末濃度為 92 mM)。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得螢光值 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。 F_2 與 F_1 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，僅僅添加緩衝溶液，然後測定螢光強度值 F_{1K} ，接著如前文所述添加鉀離子，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：

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

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。

EC₅₀-數值係藉助 'Prism v4.0' 軟體(GraphPad Soft-ware™)所計算。

低強度之大鼠甩尾試驗

試驗物質針對於急性有害之熱刺激之鎮痛效果於依據 D'Amour 及 Smith (J. Pharm. Exp. Ther. 72, 74 79 (1941))之大鼠甩尾試驗中已有所研究。於此試驗中，使用體重介於 200 至 250 公克之雄性 Sprague-Dawley 大鼠(動物飼養者：Janvier, Le Genest St. Isle，法國)。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)聚焦灼熱之光線之下。每組皆採用 10 隻大鼠。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(時間從開啟灼熱光線起算至尾巴突然移開為止)，並將其平均值定義為對照組之潛伏時間。灼熱光線之強度於本試驗中被如是選擇使得對照組之潛伏時間達到 7 至 9 秒。然後於試驗物質經口給藥後 10 分鐘、20 分鐘、30 分鐘及 60 分鐘重複進行測量移開尾巴之潛伏時間。依據下列公式測定試驗物質之鎮痛作用，其係以移開尾巴之潛伏時間變長為表徵：

$$MPE [\%] = [(T_1 - T_0)/(T_2 - T_0)] \times 100$$

其中：T₀：施予試驗物質前之對照組潛伏時間，T₁：施予試驗物質後之對照組潛伏時間，T₂：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於 ≤ 0.05 。

藥理試驗數據

於表 3 中列出前述諸藥理試驗模型之結果。

表 3：

範例號 碼	螢光測量 EC50 [nM]	螢光測量 % 療效 (50 μM Retigabine = 100%)	低強度之大 鼠甩尾試驗 口服% 作用 (劑量 [毫克/公斤])
1	744	143	
2		26	
3	1931	77	
4	144	168	
5	2657	98	
6	1221	111	
7	1350		
8		46	
9		26	
10		9	
11		41	
12	412	155	

13	991	136	
14	291	223	9 (21.5)
15	778	145	
16	78	164	
17		77	
18		72	
19	167	71	
20		64	
21	119	30	
22		15	
23		14	
24		27	
25		8	
28		47	
29	367	86	
30	82	141	31 (10)
31	145	159	
32	59	70	
33	140	162	
34	98	72	
35	2655	142	
36	136	93	
37	85	121	0 (10.0)
38	76	142	
39	473	48	
40	194	152	

41	1105	121	
42	1690	175	51 (21.5)
43	159	77	
44	587	169	
45		23	
46	141	155	
47	73	152	
48	56	133	
49	74	151	
50	61	150	
51	37	158	
52	64	102	
53	256	73	
54	162	229	
55	149	167	
56	67	97	
57	150	205	
69	858	123	
70	1463	114	
71	305	163	
72	732	59	
73		25	
74	163	128	
75	71	88	
76	92	182	ED ₅₀ 6.3
77	105	137	37 (10)

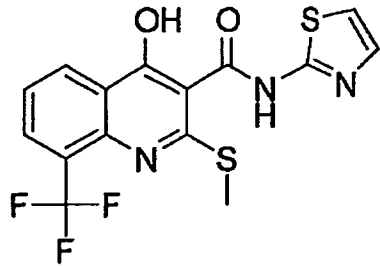
78		33	
79	124	116	
80	148	135	
81		28	
82	219	108	
83	242	130	
84		25	
85	413	89	
86	565	108	
87	144	159	
88	212	154	
89	64	220	ED ₅₀ 2.7
90	842	53	
91	1213	50	
92	950	65	
93	88	157	
94	54	162	71 (4.64)
95	627	96	
96	808	101	
97	622	60	
98	404	70	
99	623	90	
100	337	45	
101		17	
102		14	
103	784	115	

104		25	
105	248	140	
106	216	143	
107	499	161	
108	509	149	
109	187	144	7 (10.0)
110	89	183	
111	86	178	
112	130	211	17 (10.0)
113	3992	66	
114	169	175	
115	136	150	
116	598	147	
117	222	87	
118	147	149	
119	2748	72	
120	1212	157	
121	334	90	
122	65	171	
123		8	
124		8	
125		14	
126		5	
127		18	
128		39	
129		12	

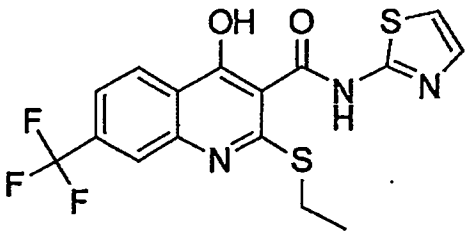
130	58	180	
131	1818	104	
132	51	161	
133		15	
134		21	
135		6	
136	227	164	
137	225	166	
138	2235	91	
139	1958	91	
140	1150	101	

由專利案 FR2532939 中得悉 4-羥基-2-巰基-喹啉-3-甲醯胺 (4-OH-Mercapto-chinolin-3-carboxamid)，該等醯胺化合物並無任何有關其於疼痛模型及發炎模型中藥理作用之作用機制論述。

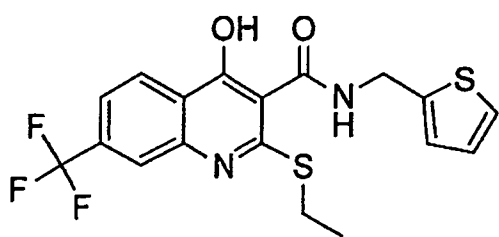
專利案 FR2532939 學理之增訂部份然而卻指出此類含 4-羥基官能基之 2-巰基-喹啉-3-甲醯胺於濃度於相關之範圍達至 30 微莫耳為止於螢光試驗之藥理模型中對於 KCNQ2/3 皆不具作用。



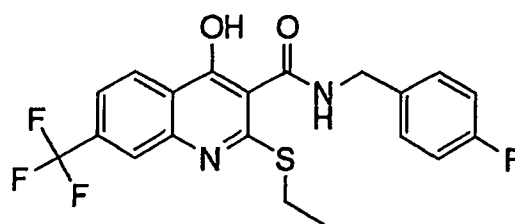
專利案 FR2532939 中之
範例 4



類似專利案 FR2532939 中範例
4 之化合物，其於第 7 個位置上，
而非於第 8 個位置上含三氟甲基



類似依據專利案 FR2532939
範例 4 之範例 14 及 30 之 4-
OH 化合物

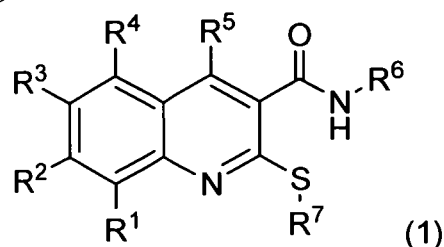


類似專利案 FR2532939 範例 4
之範例 77 之 4-OH 化合物

依據申請專利範圍之根據本發明之諸化合物，4-羥基官能基於 R^5
適當之定義下被加以排除。

七、申請專利範圍：

1. 一種具通式(1)之被取代之 2-巰基喹啉-3-甲醯胺，



其中

R^0 代表含 1 至 10 個碳原子之烷基(C_{1-10} -Alkyl)或含 2 至 10 個碳原子之雜烷基(C_{2-10} -Heteroalkyl)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或經取代一或數次；含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次；芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或經取代一或數次；經由含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基(C_{2-8} -Heteroalkyl)鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次，其中該烷基或雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉，飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次；或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基鍵結之芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或經取代一或數次，其中該烷基或雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉，飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次；

R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基；醛基($C(=O)H$)； R^0 酮基($C(=O)R^0$)；羧基； R^0 羧酸酯基($C(=O)OR^0$)；醯胺基；被一 R^0 基取代之醯胺基($C(=O)NH-R^0$)；被二 R^0 基取代之醯胺基($C(=O)N(R^0)_2$)；羥基； R^0 基氧基(OR^0)； R^0 基羰氧基($O-C(=O)-R^0$)； R^0 基氧基羰氧基($O-C(=O)-O-R^0$)；被一 R^0 基取代之醯胺基氧基($O-C(=O)NH-R^0$)；

被二 R^0 基取代之鹽胺基氧基($O-C(=O)N(R^0)_2$)； R^0 基磺鹽基氧基($O-S(=O)_2-R^0$)；羥基磺鹽基氧基($O-S(=O)_2OH$)； R^0 基氧基磺鹽基氧基($O-S(=O)_2OR^0$)；磺鹽胺基氧基($O-S(=O)_2NH_2$)；被一 R^0 基取代之磺鹽胺基氧基($O-S(=O)_2NHR^0$)；被二 R^0 基取代之磺鹽胺基氧基($O-S(=O)_2N(R^0)_2$)；胺基；被一 R^0 基取代之胺基($NH-R^0$)；被二 R^0 基取代之胺基($N(R^0)_2$)；被一 R^0 酮基取代之胺基($NH-C(=O)-R^0$)；被一 R^0 羧酸酯基取代之胺基($NH-C(=O)-O-R^0$)；被一鹽胺基取代之胺基($NH-C(=O)-NH_2$)；被一含一 R^0 基鹽胺基取代之胺基($NH-C(=O)-NH-R^0$)；被一含二 R^0 基鹽胺基取代之胺基($NH-C(=O)-N(R^0)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基酮基取代之胺基($NR^0-C(=O)-R^0$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基($NR^0-C(=O)-O-R^0$)；被一 R^0 基及一鹽胺基取代之胺基($NR^0-C(=O)-NH_2$)；被一 R^0 基及一含一 R^0 基鹽胺基取代之胺基($NR^0-C(=O)-NH-R^0$)；被一 R^0 基及一含二 R^0 基鹽胺基取代之胺基($NR^0-C(=O)-N(R^0)_2$)；被一羥基磺鹽基取代之胺基($NH-S(=O)_2-OH$)；被一 R^0 基磺鹽基取代之胺基($NH-S(=O)_2-R^0$)；被一 R^0 基氧基磺鹽基取代之胺基($NH-S(=O)_2OR^0$)；被一磺鹽胺基取代之胺基($NH-S(=O)_2NH_2$)；被一含一 R^0 基磺鹽胺基取代之胺基($NH-S(=O)_2NHR^0$)；被一含二 R^0 基磺鹽胺基取代之胺基($NH-S(=O)_2N(R^0)_2$)；被一 R^0 基及一羥基磺鹽基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2OH$)；被一 R^0 基及一 R^0 基磺鹽基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2R^0$)；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺鹽基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2OR^0$)；被一 R^0 基及一磺鹽胺基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2NH_2$)；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺鹽胺基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2NHR^0$)；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺鹽胺基取代之胺基($NR^0-S(=O)_2N(R^0)_2$)；巯基； R^0 基硫基(SR^0)； R^0 基氧硫基($S(=O)R^0$)；

R^0 基磺醯基($S(=O)_2R^0$)；羥基磺醯基($S(=O)_2-OH$)； R^0 基氧基磺醯基($S(=O)_2OR^0$)；磺醯胺基($S(=O)_2NH_2$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基($S(=O)_2NHR^0$)；或被二 R^0 基取代之磺醯胺基($S(=O)_2N(R^0)_2$)；

R^5 代表氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基；醛基； R^0 酮基；羧基； R^0 羧酸酯基；醯胺基；被一 R^0 基取代之醯胺基；被二 R^0 基取代之醯胺基； R^0 基氧基； R^0 基羰氧基； R^0 基氧基羰氧基；被一 R^0 基取代之醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之醯胺基氧基； R^0 基磺醯基氧基；羥基磺醯基氧基； R^0 基氧基磺醯基氧基；磺醯胺基氧基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；胺基；被一 R^0 基取代之胺基；被二 R^0 基取代之胺基；被一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基；被一醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 酮基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 羧酸酯基取代之胺基；被一 R^0 基及一醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一磺醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；巯基； R^0 基硫基； R^0 基氧硫基； R^0 基磺醯基；羥基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基；磺醯胺基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基；

R^6 代表 R^0 ；當 R^0 代表飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次

之雜環基，或代表未經取代或經取代一或數次之雜芳香基時，則該雜芳香基或雜環基之鍵結係經由該雜芳香基或雜環基上一碳原子達成；

R^7 代表 R^0 ；當 R^0 代表飽和或不飽和，未經取代或經取代一或數次之雜環基，或代表未經取代或經取代一或數次之雜芳香基時，則該雜芳香基或雜環基之鍵結係經由該雜芳香基或雜環基上一碳原子達成；

其中「雜烷基」包括飽和或不飽和之非環脂肪烴碳氫化合物殘基，其可各自為分叉或未分叉，且其中至少有一，必要時亦可有二或三個碳原子被一雜原子或一雜原子基團取代，其彼此各自無關地由氧原子、硫原子、氧硫基、磺基、氮原子、亞胺基及被含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之亞胺基($N(C_{1-8}\text{-Alkyl})$)構成之組群所選出，其中通過雜烷基之初始碳原子與較高層級之通式結構產生鍵結之雜烷基不可被一雜原子或雜原子基團取代，且相鄰之碳原子不可同時被一雜原子或雜原子基團取代；

其中「雜環基」包括脂肪烴之飽和或不飽和(但非芳香烴)含 3 至 10 個，亦即 3、4、5、6、7、8、9 或 10 個環元之環烷基，其中至少有一，必要時亦可二或三個碳原子被一雜原子或一雜原子基團取代，其彼此各自無關地由氧、硫、氮、亞胺基及被含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之亞胺基($N(C_{1-8}\text{-Alkyl})$)構成之組群所選出，其中該雜環基與較高層級之主要通式之鍵結可經由該雜環基殘基上任何想要及可能之環元達成；

其中「雜芳香基」代表含 5 或 6 個環元之環狀芳香烴殘基，其含至少 1，必要時亦可含 2、3、4 或 5 個雜原子，其中該雜原子彼此各自無關地由硫、氮及氧構成之組群所選出，及其中與較高層級之主要通式之鍵結可經由該雜芳香基殘基上任何想要及可能之環元達

成；

其中「芳香基」意指含達到 14 個環元之芳香烴碳氮化合物，尤其係苯及萘類，及其中與較高層級之主要通式之鍵結可經由該芳香基殘基上任何想要及可能之環元達成；

其中「烷基被取代」，「雜烷基被取代」，「雜環基被取代」及「環烷基被取代」係表示一或數個氫原子彼此各自無關地被氟；氯；溴；碘；氰基；三氟甲基；橋氧基；亞胺基；被二胺基取代之亞甲基；硝基； R^0 基；醛基； R^0 酮基；羧基； R^0 羧酸酯基；鹽胺基；被一 R^0 基取代之鹽胺基；被二 R^0 基取代之鹽胺基；羥基； R^0 基氧基；氧基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(-O-(C₁₋₈-Alkyl)-O-)； R^0 基羰氧基； R^0 基氧基羰氧基；被一 R^0 基取代之鹽胺基氧基；被二 R^0 基取代之鹽胺基氧基； R^0 基磺鹽基氧基；羥基磺鹽基氧基； R^0 基氧基磺鹽基氧基；磺鹽胺基氧基；被一 R^0 基取代之磺鹽胺基氧基；被二 R^0 基取代之磺鹽胺基氧基；胺基；被一 R^0 基取代之胺基；被二 R^0 基取代之胺基；被一 R^0 酮基取代之胺基；被一 R^0 羧酸酯基取代之胺基；被一鹽胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基；被一 R^0 基及一鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基鹽胺基取代之胺基；被一羥基磺鹽基取代之胺基；被一 R^0 基磺鹽基取代之胺基；被一 R^0 基氧基磺鹽基取代之胺基；被一磺鹽胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基磺鹽胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基磺鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一羥基磺鹽基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基磺鹽基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺鹽基取代之胺基；被一 R^0 基及一磺鹽胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺鹽胺基取代之胺基；

被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；巯基； R^0 基硫基； R^0 基氧硫基； R^0 基磺醯基；氫代磺醯基；羥基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基；磺醯胺基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基；

其中「芳香基被取代」及「雜芳香基被取代」係表示一或數個氫原子彼此各自無關地被氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基；醛基； R^0 酮基；羧基； R^0 羧酸酯基；醯胺基；被一 R^0 基取代之醯胺基；被二 R^0 基取代之醯胺基；羥基； R^0 基氧基；氧基含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(-O-(C₁₋₈-Alkyl)-O-)； R^0 基羧氧基； R^0 基氧基羧氧基；被一 R^0 基取代之醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之醯胺基氧基； R^0 基磺醯基氧基；羥基磺醯基氧基； R^0 基氧基磺醯基氧基；磺醯胺基氧基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基氧基；胺基；被一 R^0 基取代之胺基；被二 R^0 基取代之胺基；被一 R^0 酮基取代之胺基；被一 R^0 羧酸酯基取代之胺基；被一醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基酮基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基羧酸酯基取代之胺基；被一 R^0 基及一醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基；被一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一磺醯胺基取代之胺基；被一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一羥基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一 R^0 基氧基磺醯基取代之胺基；被一 R^0 基及一磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含一 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；被一 R^0 基及一含二 R^0 基磺醯胺基取代之胺基；巯基； R^0 基硫基(SR^0)；

R^0 基氧硫基； R^0 基磺醯基；羥基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基；磺醯胺基；被一 R^0 基取代之磺醯胺基；被二 R^0 基取代之磺醯胺基；

下列之化合物則為例外：

N-苯甲基-2-(3-氯-2-羥基丙基硫基)-4-(2,4-二氯苯基)喹啉-3-甲醯胺
(N-Benzyl-2-(3-chlor-2-hydroxypropylthio)-4-(2,4-dichlorophenyl)quinolin-3-carboxamid)；

其形式為自由之化合物或其與生理上可被接受之酸或鹼所形成之鹽類。

2. 根據申請專利範圍第 1 項被取代之甲醯胺，其特徵為， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($C(=O)(R^0$ 或 $H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基($C(=O)O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($C(=O)N(R^0$ 或 $H)_2$)；羥基； R^0 基氧基；羥基-含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-OH$)；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基-含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-(C_{1-8}\text{-Alkyl})-O-C_{1-8}\text{-Alkyl}$)；三氟甲氧基； R^0 基羰氧基；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羰基取代之胺基、或被一 R^0 基羰基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-N(R^0$ 或 $H)_2$)；巯基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基($S(=O)_2R^0$)； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0$

或 $H)_2$) 構成之組群所選出；

R^5 係由氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基 ($C(=O)(R^0$ 或 $H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基 ($C(=O)O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基 ($C(=O)N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基 ($N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羰基取代之胺基、或被一 R^0 基羰基取代之胺基 ($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基 ($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-N(R^0$ 或 $H)_2$)；巰基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基 ($S(=O)_2R^0$)； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基 ($S(=O)_2O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基 ($S(=O)_2-N(R^0$ 或 $H)_2$) 構成之組群所選出；

R^6 代表

含 1 至 10 個碳原子之烷基 (C_{1-10} -Alkyl) 或含 2 至 10 個碳原子之雜烷基 (C_{2-10} -Heteroalkyl)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C_{1-8} -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 ($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 ($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 ($N(C_{1-8}$ -Alkyl) $_2$)、含 3 至

10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)及雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)、或雜環基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、

羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、及雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)構成之組群所選出之取代基取

代一或數次；或

芳香基或雜芳香基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原

子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、及雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；及 R^7 代表

含 1 至 10 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-10}\text{-Alkyl}$)或含 2 至 10 個碳原子之雜烷基($\text{C}_{2-10}\text{-Heteroalkyl}$)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)或雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各

自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、羥基及三氟甲氧基等成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C₁₋₈-Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (NH-C₁₋₈-Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (N(C₁₋₈-Alkyl)₂) 構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

含 3 至 10 個碳原子之環烷基 (C₃₋₁₀-Cycloalkyl)、或雜環基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、巯基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 (S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (NH-C₁₋₈-Alkyl)、被

二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)及雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基(OH)、橋氧基($=\text{O}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基(OCF_3)、胺基(NH_2)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或

芳香基或雜芳香基、或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其各自

為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)、及雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，

分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N(C}_{1-8}\text{-Alkyl)}_2$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

3. 根據申請專利範圍第 1 項或第 2 項所述之被取代之甲醯胺，其特徵為，

R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($\text{C(=O)(R}^0\text{ 或 H)}$)； R^0 羧酸酯基或羧基($\text{C(=O)O(R}^0\text{ 或 H)}$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($\text{C(=O)N(R}^0\text{ 或 H)}_2$)；羥基； R^0 基氧基；羥基-含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-(C}_{1-8}\text{-Alkyl)-OH}$)；含 1 至 8 個碳原子之烷氧基-含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-(C}_{1-8}\text{-Alkyl)-O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)；三氟甲氧基； R^0 基羰氧基；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($\text{N(R}^0\text{ 或 H)}_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羰基取代之胺基、或被一 R^0 基羰基取代之胺基($\text{N(R}^0\text{ 或 H)-C(=O)-R}^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($\text{N(R}^0\text{ 或 H)-C(=O)-N(R}^0\text{ 或 H)}_2$)；巰基；三

氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2-O-(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0$ 或 $H)_2$)構成之組群所選出；

且 R^5 係由氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基； R^0 基； R^0 基酮基或醛基($C(=O)(R^0$ 或 $H)$)； R^0 羧酸酯基或羧基($C(=O)O(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之醯胺基、被二 R^0 基取代之醯胺基、或醯胺基($C(=O)N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基取代之胺基、或被二 R^0 基取代之胺基、或胺基($N(R^0$ 或 $H)_2$)；被一 R^0 基及一 R^0 基羰基取代之胺基、或被一 R^0 基羰基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-R^0$)；被一含一 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之 R^0 基胺基、或被一醯胺基取代之 R^0 基胺基、被一含一 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一含二 R^0 基醯胺基取代之胺基、或被一醯胺基取代之胺基($N(R^0$ 或 $H)-C(=O)-N(R^0$ 或 $H)_2$)；巰基；三氟甲硫基； R^0 基硫基； R^0 基磺醯基； R^0 基氧基磺醯基或羥基磺醯基($S(=O)_2-O-(R^0$ 或 $H)$)；被一 R^0 基取代之磺醯胺基、或被二 R^0 基取代之磺醯胺基、或磺醯胺基($S(=O)_2-N(R^0$ 或 $H)_2$)構成之組群所選出。

4. 根據申請專利範圍第 1 項或第 2 項其中一項所述之被取代之甲醯胺，其特徵為，

R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此各自無關地由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基；醛基；羧基；醯胺基；含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羰基($C(=O)C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基羰基($C(=O)O-C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羰氧基

(O-C(=O)-C₁₋₈-Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基(C(=O)NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之醯胺基(C(=O)N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(NH-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個碳原子之烷羰基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷基磺醯基(S(=O)₂C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基磺醯基(S(=O)₂O-C₁₋₈-Alkyl)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、甲氧基及羥基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；羥基；三氟甲基；巯基；三氟甲硫基；羥基磺醯基；胺基；含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C₃₋₁₀-Cycloalkyl)或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代；苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基，其各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、胺基、氰基、含 1 至 8 個碳原子之烷基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基、三氟甲基、羥基、三氟甲氧基、羧基、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次；

且 R⁵ 主要係由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基；醛基；羧基；醯胺基；含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羰基(C(=O)C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基羰基

(C(=O)O-C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷基羧基 (O-C(=O)-C₁₋₈-Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之鹽胺基(C(=O)NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之鹽胺基(C(=O)N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基及一含 1 至 8 個碳原子之烷基羧基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)-C(=O)C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基(S-C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷基磺鹽基(S(=O)₂C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基磺鹽基(S(=O)₂O-C₁₋₈-Alkyl)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、甲氧基及羥基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；三氟甲氧基；巰基；三氟甲硫基；羥基磺鹽基；胺基；含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C₃₋₁₀-Cycloalkyl)或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代；苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基，其各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、胺基、氰基、含 1 至 8 個碳原子之烷基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基、三氟甲基、羥基、三氟甲氧基、羧基、三氟甲硫基及羥基磺鹽基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

5. 根據申請專利範圍第 1 項或第 2 項其中一項所述之被取代之甲鹽胺，其特徵為，

R¹、R²、R³ 及 R⁴ 彼此各自無關地由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；正丙

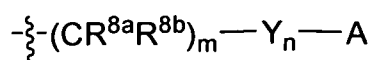
基(n-Propyl)；異丙基(iso-Propyl)；環丙基(Cyclopropyl)；正丁基(n-Butyl)；二級-丁基(sec.-Butyl)；三級-丁基(tert.-Butyl)；2,2,2-三氟乙基(CH₂CF₃)；乙醯基(C(=O)-Methyl)；丙醯基(C(=O)-Ethyl)；羧基；甲酯基(C(=O)-O-Methyl)；乙酯基(C(=O)-O-Ethyl)；醯胺基(C(=O)-NH₂)；被二甲基取代之醯胺基(C(=O)-N(Methyl)₂)；被二乙基取代之醯胺基(C(=O)N(Ethyl)₂)；被一甲基取代之醯胺基(C(=O)-NH-Methyl)；被一乙基取代之醯胺基(C(=O)-NH-Ethyl)；被一甲基及一乙基取代之羧基醯胺基(C(=O)-N(Methyl)(Ethyl)OH)；；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基(O-(CH₂)₂-O-CH₃)；羥基乙氧基(O-(CH₂)₂-OH)；三氟甲氧基(OCF₃)；甲基羧氧基(O-C(=O)-Methyl)；乙基羧氧基(O-C(=O)-Ethyl)；NR^aR^b，其中 R^a及 R^b彼此各自無關地由氫原子、甲基、乙基、甲氧基乙基((CH₂)₂-O-CH₃)及羥基乙基((CH₂)₂-OH)構成之組群所選出，或 R^a及 R^b及與 R^a及 R^b鍵結之氮原子形成一吡咯烷基、哌啶基、4-甲基哌嗪基(4-Methylpiperazinyl)或嗎啉基；被一甲基羧基取代之胺基(NHC(=O)-Methyl)；被一乙基羧基取代之胺基(NHC(=O)-Ethyl)；巰基；三氟甲硫基；甲硫基；乙硫基；羥基磺醯基；甲氧基磺醯基(S(=O)₂O-Methyl)；苯甲基、苯基、吡啶基，其各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、羥基、甲氧基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

6. 根據申請專利範圍第 1 項或第 2 項其中一項所述之被取代之甲醯胺，其特徵為，

R^5 係由該組群所選出，其包含氫、氟、氯、溴、碘；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；正丙基；異丙基；環丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；2,2,2-三氟乙基(CH_2CF_3)；乙醯基；丙醯基；羧基；甲酯基；乙酯基；醯胺基；被二甲基取代之醯胺基；被二乙基取代之醯胺基；被一甲基取代之醯胺基；被一乙基取代之醯胺基；被一甲基及一乙基取代之醯胺基($\text{C}(=\text{O})\text{-N}(\text{Methyl})(\text{Ethyl})$)；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)；羥基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{-OH}$)；三氟甲氧基；甲基羧氧基；乙基羧氧基； NR^aR^b ，其中 R^a 及 R^b 彼此各自無關地由氫原子、甲基、乙基、甲氧基乙基($(\text{CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)、羥基乙基($(\text{CH}_2)_2\text{-OH}$)、甲醯基($\text{C}(=\text{O})\text{-Methyl}$)及乙醯基($\text{C}(=\text{O})\text{-Ethyl}$)構成之組群所選出，或 R^a 及 R^b 及與 R^a 及 R^b 鍵結之氮原子形成一吡咯烷基、哌啶基、4-甲基哌嗪基或嗎啉基；巯基；三氟甲硫基；甲硫基；乙硫基；羥基磺醯基；甲氧基磺醯基；苯甲基，其為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、羥基、甲氧基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

7. 根據申請專利範圍第 1 項或第 2 項其中一項所述之被取代之甲醯胺，其特徵為，

R^6 代表下圖所示之部分結構(T1)



(T1)

其中

R^{8a} 及 R^{8b} 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基；羥基；三氟甲氧基；胺基；含 1 至 4 個碳原子之烷基 (C_{1-4} -Alkyl)、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基 ($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($NH-C_{1-4}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($N(C_{1-8}$ -Alkyl) $_2$)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基 ($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；含 3 至 10 個碳原子之環烷基 (C_{3-10} -Cycloalkyl) 或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 4 個碳原子之烷基 (C_{1-4} -Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基 ($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($NH-C_{1-4}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($N(C_{1-4}$ -Alkyl) $_2$) 構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

m 代表 0、1、2、3 或 4；

Y 代表氧原子或 NR^9 基，

其中 R^9 代表氫原子；含 1 至 4 個碳原子之烷基 (C_{1-4} -Alkyl)，其為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 4 個碳原子之烷基 (C_{1-4} -Alkyl)、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基 ($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($NH-C_{1-4}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($N(C_{1-4}$ -Alkyl) $_2$) 構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表含 3 至 10 個碳原子之環烷基，其為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至

4 個碳原子之烷基(C_{1-4} -Alkyl)、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-4}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-4}$ -Alkyl)₂)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

n 代表 0 或 1，

當 m 代表 0 時，則 n 不代表 1；

A 代表含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)，

其為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-4}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-4}$ -Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-4}$ -Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C_{3-10} -Cycloalkyl)或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}$ -Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、

溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 (S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 (S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C₁₋₈-Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (NH-C₁₋₈-Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基 (N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基 (S-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

8. 根據申請專利範圍第 7 項所述之被取代之甲醯胺，其特徵為，R^{8a} 及 R^{8b} 尤其偏好彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；正丙基；異丙基；環丙

基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；2,2,2-三氟乙基(CH_2CF_3)；羥基；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-\text{CH}_3$)；羥基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{OH}$)；三氟甲氧基；胺基；被一甲基取代之胺基；被二甲基取代之胺基；被一乙基取代之胺基；被二乙基取代之胺基；或代表被一甲基及一乙基取代之胺基；

m 代表 1、2 或 3；

n 代表 0；及

A 代表含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)，

其為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O}-\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基及三氟甲基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表飽和且未經取代之含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)；或代表苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯基、萘基、吡啶基、噻吩基，其各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O}-\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH}-\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基($\text{S}-\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次。

9. 根據申請專利範圍第 1 項或第 2 項其中一項或所述之被取代之甲醯胺，其特徵為，

R^7 係由該組群所選出，其包含甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、二級-丁基、三級-丁基、正戊基、異戊基、新戊基、正己基、

環丙基、環丁基、環戊基、環己基、甲基-環丙基

(Methyl-cyclopropyl)、甲基-環丁基(Methyl-cyclobutyl)、甲基-環戊基(Methyl-cyclopentyl)、甲基-環己基(Methyl-cyclohexyl)、乙基-環丙基(Ethyl-cyclopropyl)、乙基-環丁基(Ethyl-cyclobutyl)、乙基-環戊基(Ethyl-cyclopentyl)、乙基-環己基(Ethyl-cyclohexyl)，其各自為未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基及含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{OC}_{1-8}\text{-Alkyl}$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或苯基、苯甲基或苯乙基，其各自為未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{OC}_{1-8}\text{-Alkyl}$)及氰基構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

10. 根據申請專利範圍第 1 項所述之被取代之甲醯胺，其特徵為， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此各自無關地由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；甲醯基；羥基；甲氧基；甲氧基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)；三氟甲氧基；甲基羧基；胺基；被一甲基羧基取代之胺基；被二甲基取代之胺基；嗎啉基；甲硫基；三氟甲硫基；苯甲基及苯基，其各自為未經取代； R^5 係由該組群所選出，其包含氫；氟；氯；溴；碘；硝基；三氟甲基；氰基；甲基；乙基；乙醯基；甲氧基；甲氧基乙氧基($\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{-O-CH}_3$)；三氟甲氧基；甲基羧基(O-C(=O)-Methyl)；胺基；被一甲基羧基取代之胺基；被二甲基取代之胺基；嗎啉基；甲硫基；三氟甲硫基；未經取代之苯甲基； R^6 代表下圖所示之部分結構(T1-1)：



(T1-1)

其中

R^{8a} 及 R^{8b} 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘；甲基；乙基；正丙基；異丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；羥基；甲氧基；乙氧基；甲氧基乙氧基 ($\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-\text{CH}_3$) 或羥基乙氧基 ($\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{OH}$)；

m 代表 1、2 或 3；

A 代表甲基；乙基；正丙基；異丙基；正丁基；二級-丁基；三級-丁基；環丙基；環丁基；環戊基；環己基；環庚基；金剛烷基；雙環 [2.2.1] 庚基 (Bicyclo[2.2.1]heptyl)；雙環 [2.2.2] 辛基 (Bicyclo[2.2.2]octyl)；苯基、吡啶基、噻吩基，

其各自為未經取代或被一、二或三個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基 ($\text{O}-\text{C}_{1-4}-\text{Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基 ($\text{C}_{1-4}-\text{Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{NH}-\text{C}_{1-4}-\text{Alkyl}$)、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基 ($\text{N}(\text{C}_{1-4}-\text{Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基 ($\text{S}-\text{C}_{1-4}-\text{Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一、二或三次；

R^7 代表

含 1 至 8 個碳原子之烷基 ($\text{C}_{1-8}-\text{Alkyl}$) 或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基 ($\text{C}_{2-8}-\text{Heteroalkyl}$)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟

甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、含 3 至 8 個碳原子之環烷基(C_{3-8} -Cycloalkyl)或雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

含 3 至 8 個碳原子之環烷基(C_{3-8} -Cycloalkyl)、或雜環基、或經由含 1 至 6 個碳原子之烷基或經由含 2 至 6 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 8 個碳原子之環烷基或雜環基，其各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($O-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C_{1-8} -Alkyl)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($NH-C_{1-8}$ -Alkyl)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($N(C_{1-8}-Alkyl)_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($S-C_{1-8}$ -Alkyl)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、

苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、含 3 至 8 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-8}\text{-Cycloalkyl}$)及雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、

及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

芳香基或雜芳香基、或經由含 1 至 6 個碳原子之烷基或經由含 2 至 6 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基、羥基磺醯基、苯甲基、苯基、吡啶基及噻吩基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中苯甲基、苯基、吡啶基、噻吩基可各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；

且其中必要時該烷基鏈或該雜烷基鏈可各自為分叉或未分叉、飽和或不飽和、未經取代或被一或數個由氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基、氰基、羥基、橋氧基、羧基、三氟甲氧基、胺基、羥基磺醯基、巰基、三氟甲硫基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH}-\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基

(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)、含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C₃₋₁₀-Cycloalkyl)、及雜環基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中前述之烷基殘基又可各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)、羥基及三氟甲氧基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；且其中前述之含 3 至 10 個碳原子之環烷基或雜環基，其可各自為飽和或不飽和，未經取代或被一或數個彼此各自無關地由氟、氯、溴、碘、含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、胺基、被一含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(NH-C₁₋₈-Alkyl)、及被二含 1 至 8 個碳原子之烷基取代之胺基(N(C₁₋₈-Alkyl)₂)構成之組群所選出之取代基取代一或數次。

11. 根據申請專利範圍第 1 項所述之被取代之甲鹽胺，其特徵為，R¹、R²、R³ 及 R⁴ 彼此各自無關地代表氫；氟；氯；溴；碘；三氟甲基；羥基；三氟甲氧基；胺基；巰基；三氟甲硫基；含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代；

R⁵ 代表氫；氟；氯；溴；碘；三氟甲基；三氟甲氧基；胺基；巰基；三氟甲硫基；含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基(O-C₁₋₈-Alkyl)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代；

R⁶ 代表含 1 至 8 個碳原子之烷基(C₁₋₈-Alkyl)或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基(C₂₋₈-Heteroalkyl)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代；含 3 至 10 個碳原子之環烷基(C₃₋₁₀-Cycloalkyl)，其為飽和或不飽和，未經取代；芳香基或雜

芳香基，其各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲基、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基被一含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基，其為飽和或不飽和，未經取代；或代表經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基被一含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲基、巰基、含 1 至 8 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中該烷基鏈可各自為分叉或未分叉，飽和或不飽和，未經取代；

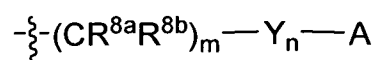
R^7 代表含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)或含 2 至 8 個碳原子之雜烷基($\text{C}_{2-8}\text{-Heteroalkyl}$)，其各自為飽和或不飽和，分叉或未分叉，未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、羥基、橋氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)構成之組群所選出之取代基取代一或數次；或代表含 3 至 10 個碳原子之環烷基($\text{C}_{3-10}\text{-Cycloalkyl}$)，其為飽和或不飽和，未經取代；芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘等原子、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基含 1 至 8 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-8}\text{-Alkyl}$)、三氟甲基、三氟甲硫基構成之組群所選出之取代

基取代一或數次；或代表經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基被一含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之含 3 至 10 個碳原子之環烷基，其為飽和或不飽和，未經取代，其中該烷基鏈可為分叉或未分叉，飽和或不飽和，未經取代；或代表經由含 1 至 8 個碳原子之烷基或經由含 1 至 8 個碳原子之烷基被一含 2 至 8 個碳原子之雜烷基所鍵結之芳香基或雜芳香基，其各自為未經取代或被一或數個彼此無關地由氟、氯、溴、碘、羥基、含 1 至 8 個碳原子之烷氧基 (O-C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲氧基、含 1 至 8 個碳原子之烷基 (C₁₋₈-Alkyl)、三氟甲基、三氟甲硫基構成之組群所選出之取代基取代一或數次，其中該烷基鏈可各自為分叉或未分叉，飽和或不飽和，未經取代。

12. 根據申請專利範圍第 1 項所述之被取代之甲醯胺，其特徵為，R¹、R²、R³ 及 R⁴ 彼此各自無關地由氫、氟、氯、三氟甲基及三氟甲氧基構成之組群所選出；

R⁵ 代表甲基、甲氧基或甲氧基甲基(-CH₂O-Methyl)；

R⁶ 代表下圖所示之部分結構(T1)



(T1)

其中

R^{8a} 及 R^{8b} 彼此各自無關地代表氫原子；

m 代表 1，

n 代表 0 及

A 代表苯基、吡啶基或噻吩基，

其各自被一由氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、羥基、含 1 至 4 個碳原子之烷氧基($\text{O-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲氧基、含 1 至 4 個碳原子之烷基($\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、羧基、三氟甲基、胺基、被一含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{NH-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、被二含 1 至 4 個碳原子之烷基取代之胺基($\text{N}(\text{C}_{1-4}\text{-Alkyl})_2$)、巰基、含 1 至 4 個碳原子之烷硫基($\text{S-C}_{1-4}\text{-Alkyl}$)、三氟甲硫基及羥基磺醯基構成之組群所選出之取代基取代零次、一、二或三次；及 R^7 代表甲基、乙基、異丙基、三級-丁基或環丙基。

13. 根據申請專利範圍第 1 項所述之被取代之甲醯胺，其係選自於該組群，其包含：

- 1 2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉-甲醯胺；
- 2 3-[[3-[氧基-(2-噻吩基甲胺基)甲基]-噻啉基]硫基]丙酸甲酯；
- 3 2-(3-環己基丙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 4 2-(3-苯基丙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 5 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基-甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 6 2-[3-(4-氟苯基)丙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 7 2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 8 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 9 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-7-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 10 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-5-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 11 2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；

- 12 2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-6-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 13 N-(2-噻吩基甲基)-2-[2-[3-(三氟甲基)-苯基]磺醯基乙基硫基]-3-喹啉甲醯胺；
- 14 2-(乙基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-7-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 15 2-(戊基硫基)-N-(2-噻吩基甲基)-7-(三氟甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 16 2-[2-(4-氟苯基)磺醯基乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 17 2-[2-(對-甲苯基磺醯基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 18 2-[2-(對-甲苯基硫基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 19 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(環己基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 20 2-[3-(對甲苯基)丙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 21 2-[2-(苯基硫基)乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 22 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(2-環己基乙基)-3-喹啉甲醯胺；
- 23 2-[2-(苯磺醯基)乙基硫基]-N-(3,3-二甲基丁基)-3-喹啉甲醯胺；
- 24 2-[2-[(4-氟苯基)硫基]乙基硫基]-N-(2-噻吩基甲基)-3-喹啉甲醯胺；
- 25 N-(3,3-二甲基丁基)-2-(乙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-3-喹

啉甲醯胺；

- 26 3-(3-(噻吩-2-基甲基胺基甲醯基)-6-(三氟甲基)喹啉-2-基硫基)丙酸甲酯；
- 27 3-(3-(噻吩-2-基甲基胺基甲醯基)-7-(三氟甲基)喹啉-2-基硫基)丙酸甲酯；
- 28 N-(2,2-二甲基丙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 29 N-(環庚基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 31 N-[(3,4-二氟苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 32 N-[(2,4-二氟苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 33 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[(3,4,5-三氟苯基)甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 34 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[(2,4,5-三氟苯基)甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 35 2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-4-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 36 N-[(4-三級-丁基-苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 37 2-乙基硫基-4-甲基-N-(3-甲基-丁基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 38 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[[3-(三氟甲基)苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 39 2-乙基硫基-4-甲基-N-苯乙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 40 2-乙基硫基-4-甲基-N-(3-苯基-丙基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 41 2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 42 2-乙基硫基-4-甲基-N-(吡啶-3-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 43 2-乙基硫基-4-甲基-N-(萘-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 44 2-乙基硫基-4-甲基-N-(噻唑-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 45 2-乙基硫基-4-甲基-N-([1,3,4]噁二唑-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 47 N-[(3-氟苯基)甲基]-2-(異丙基硫基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 48 2-(環戊基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 49 2-(丁基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 50 N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(戊基硫基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 51 N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-2-(1-甲基-丙基硫基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 52 2-(環己基硫基)-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 53 N-(2-環戊基-乙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 54 N-(3-環戊基-丙基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 55 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 56 N-[(3-三級-丁基-苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 57 2-乙基硫基-4-甲基-N-(4-甲基戊基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 58 2-苯甲基硫基-N-[(3-氟苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 59 2-乙基硫基-N-[(3-氟-2-甲氧基-苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 60 2-乙基硫基-N-[(5-氟-2-甲氧基-苯基)甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 61 N-[(3,4-二甲基苯基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 62 2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-N-[[4-(三氟甲基硫基)苯基]甲基]-喹啉-3-甲醯胺；
- 63 N-(環己基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 64 2-乙基硫基-4-甲基-N-(四氫吡喃-2-基甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 65 2-乙基硫基-4-甲基-N-丙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 66 N-丁基-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 67 2-乙基硫基-N-(2-甲氧基-乙基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 68 2-乙基硫基-4-甲基-N-戊基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 69 2-乙基硫基-4-甲基-N-[(5-甲基-噁吩-2-基)甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 70 2-乙基硫基-4-甲基-N-[(4-甲基-噁吩-2-基)甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 71 N-[(5-氯-噁吩-2-基)甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 72 2-乙基硫基-4-甲基-N-(2-噁吩-2-基-乙基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 73 N-(5-雙環[2.2.1]庚基-甲基)-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 74 N-苯甲基-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 75 2-乙基硫基-N-[(2-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 76 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 77 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 78 N-[(2-氯苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 79 N-[(3-氯苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 80 N-[(4-氯苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 81 2-乙基硫基-4-甲基-N-(鄰-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

- 82 2-乙基硫基-4-甲基-N-(間-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 83 2-乙基硫基-4-甲基-N-(對-甲苯基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 84 2-乙基硫基-N-[(2-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 85 2-乙基硫基-N-[(3-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 86 2-乙基硫基-N-[(4-甲氧基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 87 N-[(3,5-二氟-苯基)-甲基]-2-乙基硫基-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 88 4-甲基-2-甲基硫基-N-(噁吩-2-基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 89 2-(三級-丁基硫基)-4-甲基-N-(噁吩-2-基-甲基)-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 90 N-(2,2-二甲基-丙基)-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 91 2-乙基硫基-4-甲基-N-(噁吩-2-基-甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 92 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 93 2-(三級-丁基硫基)-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 94 2-(三級-丁基硫基)-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 95 7-三級-丁基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；

- 96 7-三級-丁基-2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 97 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 98 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-7-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 99 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4,6-二甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 100 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4,6-二甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 101 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-6-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 102 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-6-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 103 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-6-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 104 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-6-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 105 2-乙基硫基-7-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 106 2-乙基硫基-7-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 107 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4,7-二甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 108 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4,7-二甲基-喹啉-3-甲醯胺；

- 109 2-乙基硫基-6,7-二氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲
醯胺；
- 110 2-乙基硫基-N-(呋喃-2-基-甲基)-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹啉
-3-甲醯胺；
- 111 2-乙基硫基-4-甲基-N-[(5-甲基-呋喃-2-基)-甲基]-7-(三氟甲
基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 113 2-乙基硫基-N-[(3-羥基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹
啉-3-甲醯胺；
- 114 N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉
-3-甲醯胺；
- 115 N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-2-甲基硫基-7-(三氟甲基)-喹啉
-3-甲醯胺；
- 116 2-乙基硫基-6-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯
胺；
- 117 2-乙基硫基-6-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯
胺；
- 118 2-乙基硫基-6,7-二氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲
醯胺；
- 119 2-乙基硫基-N-[(4-羥基苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基)-喹
啉-3-甲醯胺；
- 120 2-乙基硫基-8-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯
胺；
- 121 2-乙基硫基-8-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯
胺；
- 123 2-乙基硫基-5-氟-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯
胺；

- 124 2-乙基硫基-5-氟-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 125 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-5-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 126 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-5-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 127 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-5-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 128 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-6-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 129 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-羧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 133 7-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 134 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-嗎啉-4-基-喹啉-3-甲酰胺；
- 135 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-嗎啉-4-基-喹啉-3-甲酰胺；
- 136 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-8-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 137 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-4-甲基-8-(三氟甲基)-喹啉-3-甲酰胺；
- 138 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-8-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；
- 139 2-乙基硫基-N-[(4-氟苯基)-甲基]-8-甲氧基-4-甲基-喹啉-3-甲酰胺；

- 140 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-8-羥基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 141 7-二甲胺基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺；
- 142 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-甲基-7-(三氟甲基氧基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 143 4-乙基-2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；
- 144 2-乙基硫基-N-[(3-氟苯基)-甲基]-4-異丙基-7-(三氟甲基)-喹啉-3-甲醯胺；

或其生理上可被接受之鹽類。

14. 一種含至少根據申請專利範圍第 1 項或第 13 項中任一項所述之被取代之甲醯胺或化合物 N-苯甲基-2-(3-氯-2-羥基丙基硫基)-4-(2,4-二氯苯基)喹啉-3-甲醯胺 (N-Benzyl-2-(3-chlor-2-hydroxypropylthio)-4-(2,4-dichlorophenyl)chinolin-3-carboxamid) 之藥物，

其形式為一種單獨之立體異構物或其混合物，其自由化合物及/或其於生理上可被接受之鹽類，及必要時適用之添加劑及/或輔助劑及/或必要時其他之主成分。

15. 一種至少根據申請專利範圍第 1 項或第 13 項中任一項所述之被取代之甲醯胺或化合物 N-苯甲基-2-(3-氯-2-羥基丙基硫基)-4-(2,4-二氯苯基)喹啉-3-甲醯胺 (N-Benzyl-2-(3-chlor-2-hydroxypropyl-thio)-4-(2,4-dichlorophenyl)chinolin-3-carboxamid) 之用途，

其各自之形式為一種單獨之立體異構物或其混合物，其自由化合物及/或其於生理上可被接受之鹽類，以製備一藥物用於治療

疼痛、癲癇、尿失禁、焦慮狀態、成癮症、躁鬱症、雙階段障礙症、偏頭痛、認知之病症、與肌張力不全症相關之不自主運動及/或尿失禁。

16. 一種根據申請專利範圍第 1 項或第 13 項中任一項所述之被取代之甲醯胺或化合物 N-苯甲基-2-(3-氯-2-羥基丙基硫基)-4-(2,4-二氯苯基)喹啉-3-甲醯胺(N-Benzyl-2-(3-chlor-2-hydroxypropylthio)-4-(2,4-dichlorophenyl)chinolin-3-carboxamid)，其形式各自為一種單獨之立體異構物或其混合物，其自由化合物及/或其於生理上可被接受之鹽類，用於治療疼痛、癲癇、尿失禁、焦慮狀態、成癮症、躁鬱症、雙階段障礙症、偏頭痛、認知之病症、與肌張力不全症相關之不自主運動及/或尿失禁。