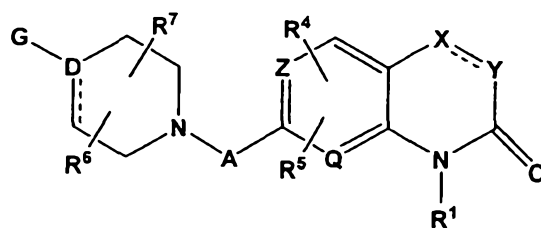


(2)



(其中 A 為  $-(\text{CH}_2)_m\text{CH}_2-$ ， $-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$  等；m 為 2 至 5 之整數；D 為 N，C 等；Z 及 Q 個自為 N，C 或 CH，惟 Z 及 Q 中至少有一者為 N；X 及 Y 個自為 N，C 等，且 X 與 Y 間之鍵為單鍵或雙鍵， $\text{R}^1$  為氫， $(\text{C}_1-\text{C}_3)$  烷基團等； $\text{R}^4$ ， $\text{R}^5$ ， $\text{R}^6$  及  $\text{R}^7$  各自代表氫，烷基團等；且 G 代表單環型或二環型化合物之基團)，其乃結合至多巴胺  $\text{D}_2$  受體上。WO2005/019215 A1 教示，其文中所揭示之一些化合物具有作為  $\text{D}_2$  受體部分激動劑之活性或作為  $\text{D}_2$  受體拮抗劑之活性，且可有效以供治療精神分裂症及其它中樞神經系統。

然而，WO2005/019215 A1 並未特別揭示本發明之化合物。

### 【發明內容】

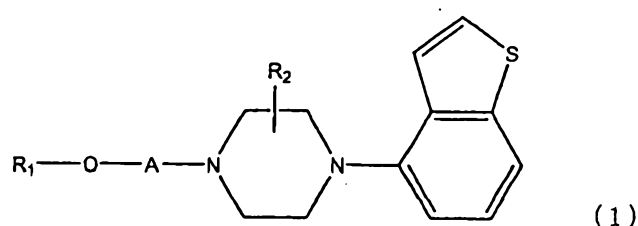
本發明之目的係提供抗精神病藥，此藥與已詳知之典型及非典型抗精神病藥相比之下，乃具有較廣效治療，較少之副作用及優良之耐受性及安全性。

本發明人業已對上述的問題進行深入之研究，結果成功地合成一種新穎化合物，其具有多巴胺  $\text{D}_2$  受體部分激

(3)

動劑活性（ $D_2$  受體部分激動劑活性），血清素  $5-HT_{2A}$  受體拮抗劑活性（ $5-HT_{2A}$  受體拮抗劑活性）及腎上腺素  $\alpha_1$  受體拮抗劑活性（ $\alpha_1$  受體拮抗劑活性）且除了這些效應之外，亦進一步具有血清素吸收抑制效應（或血清素再吸收抑制效應）。本發明係以這些發現為基礎而完成。

本發明提供式（1）所代表之雜環型化合物或其鹽：



其中  $R^2$  代表氫原子或低級烷基團；

A 代表低級烷撐基團或低級烯撐基團；且

$R^1$  代表擇自下列（I）至（IV）之環 C3-C8 烷基團、芳族基團或雜環型基團：

（I）環 C3-C8 烷基團；

（II）擇自苯基團、萘基團、二氫茚基團及四氫萘基團中之芳族基團；

（III）具有 1 至 4 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中之雜原子之飽和或不飽和雜單環型基團；及

（IV）具有 1 至 4 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中之雜原子之苯稠合性雜環型基團，其擇自（1）四氫喹啉基團，（2）四氫喹啉基團，（3）二氫喹啉基團，（4）吲哚基團，（5）吲哚基團，（6）異吲哚基

(4)

團，(7) 苯並咪唑基團，(8) 二氫苯並咪唑基團，  
 (9) 四氫苯並氮雜草基團，(10) 四氫苯並二氮雜草基  
 團，(11) 六氫苯並吡辛因基團，(12) 二氫苯並噁吡基  
 團，(13) 二氫苯並噁唑基團，(14) 苯並異噁唑基團，  
 (15) 苯並噁二唑基團，(16) 四氫苯並氧氮雜草基團，  
 (17) 二氫苯並噻吡基團，(18) 苯並噻唑基團，(19)  
 苯並噁噻基團，(20) 吡烯基團，(21) 二氫苯並呋喃基  
 團，(22) 呋唑基團，(23) 二苯並呋喃基團及(24) 喹  
 噁啉基團。

其中至少有一個擇自下列(1)至(66)中之基團可  
 存在於  $R^1$  所代表之環 C3-C8 烷基團、芳族基團及雜環型  
 基團上以作為取代基：

- (1) 低級烷基團，
- (2) 低級烯基團，
- (3) 經鹵素取代之低級烷基團，
- (4) 低級烷氧基團，
- (5) 芳氧基團，
- (6) 低級烷硫基團，
- (7) 經鹵素取代之低級烷氧基團，
- (8) 羥基團，
- (9) 經保護之羥基團，
- (10) 羥基低級烷基團，
- (11) 經保護之羥基低級烷基團，
- (12) 鹵素原子，

(5)

( 13 ) 氰基團，

( 14 ) 芳基團，

( 15 ) 硝基團，

( 16 ) 胺基團，

( 17 ) 具有擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團、低級烷磺醯基團、胺基甲醯基團、低級烷基胺基甲醯基團、胺基低級烷醯基團、低級烷醯胺基低級烷醯基團及低級烷氧基羰胺基低級烷醯基團中之基團以作為取代基之胺基團，

( 18 ) 低級烷醯基團，

( 19 ) 芳磺醯基團（其可於芳基團上具有低級烷基團），

( 20 ) 羧基團，

( 21 ) 低級烷氧羰基團，

( 22 ) 羧基低級烷基團，

( 23 ) 低級烷氧羰基低級烷基團，

( 24 ) 低級烷醯胺基低級烷醯基團，

( 25 ) 羧基低級烯基團，

( 26 ) 低級烷氧羰基低級烯基團，

( 27 ) 胺基甲醯基低級烯基團（其可具有擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團以作為取代基），

( 28 ) 胺基甲醯基團，其可具有擇自下列 ( i ) 至 ( lxxviii ) 中之基團以作為取代基：



(6)

( i ) 低級烷基團，

( ii ) 低級烷氧基團，

( iii ) 羥基低級烷基團，

( iv ) 低級烷氧基低級烷基團，

( v ) 芳氧基低級烷基團，

( vi ) 經鹵素取代之低級烷基團，

( vii ) 胺基低級烷基團（其可具有擇自低級烷基團、低級烷醯基團、芳醯基團及胺基甲醯基團中之基團），

( viii ) 環 C3-C8 烷基團（其可具有擇自低級烷基團、羥基團、低級烷氧羰基團及苯基低級烷氧基團中之基團以作為取代基），

( ix ) 經環 C3-C8 烷基取代之低級烷基團，

( x ) 低級烯基團，

( xi ) 胺基甲醯基低級烷基團（其可具有擇自低級烷基團、苯基團（可具有低級烷基團）及苯基團（可具有低級烷氧基團）中之基團以作為取代基），

( xii ) 低級烷氧羰基低級烷基團，

( xiii ) 呋喃基低級烷基團（其可於呋喃基團上具有低級烷基團以作為取代基），

( xiv ) 四氫呋喃基低級烷基團，

( xv ) 1,3-二噁茂烷基低級烷基團，

( xvi ) 四氫吡喃基低級烷基團，

( xvii ) 吡咯基低級烷基團（其可於吡咯基團上具有低級烷基團以作為取代基），

(7)

( xviii ) 經二氫吡啶基團取代之低級烷氧基團 ( 其可具有酮基團 ) ,

( xix ) 吡啶基低級烷基團 ( 其可於吡啶基團上具有低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xx ) 咪啶基低級烷基團 ,

( xxi ) 吡啶基低級烷基團 ,

( xxii ) 吡嗪基低級烷基團 ( 其可於吡嗪基團上具有低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xxiii ) 吡咯啶基低級烷基團 ( 其可於吡咯啶基團上具有擇自酮基團及低級烷基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxiv ) 六氫吡啶基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有擇自苯甲醯基團及低級烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxv ) 六氫吡嗪基低級烷基團 ( 其可於六氫吡嗪基團上具有低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xxvi ) 嗎啉基低級烷基團 ,

( xxvii ) 噻吩基低級烷基團 ( 其可於噻吩基團上具有低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xxviii ) 噻啶基低級烷基團 ,

( xxix ) 二氫苯並呋喃基低級烷基團 ,

( xxx ) 苯並哌喃基低級烷基團 ( 其可於苯並哌喃基團上具有酮基團以作為取代基 ) ,

( xxxi ) 苯並咪啶基低級烷基團 ,

( xxxii ) 吲哚基低級烷基團 ( 其可於低級烷基團上具

(8)

有低級烷氧羰基團)，

( xxxiii ) 咪唑基低級烷基團（其可於低級烷基團上具有擇自胺基甲醯基團及低級烷氧羰基團中之取代基），

( xxxiv ) 吡啶基團（其可具有擇自低級烷基團、低級烷氧基團及低級烷硫基低級烷基團中之基團以作為取代基），

( xxxv ) 吡咯啉基團（其可具有擇自低級烷基團、低級烷氧羰基團、低級烷醯基團及芳醯基團中之基團以作為取代基），

( xxxvi ) 六氫吡啶基團（其可具有擇自低級烷基團、低級烷氧羰基團、低級烷醯基團及芳醯基團（其可具有擇自低級烷基團及鹵素原子中之基團以作為取代基）中之基團），

( xxxvii ) 四氫呋喃基團（其可具有酮基團），

( xxxviii ) 六氫氮雜草基團（其可具有酮基團），

( xxxix ) 吡唑基團（其可具有擇自低級烷基團、芳基團及呋喃基團中之基團以作為取代基），

( xl ) 噻唑基團，

( xli ) 噻二唑基團（其可具有低級烷基團），

( xlii ) 異噻唑基團（其可具有低級烷基團），

( xliii ) 吲唑基團，

( xliv ) 吲哚基團，

( xlv ) 四氫苯並噻唑基團，

( xlvi ) 四氫喹啉基團（其可具有擇自低級烷基團、

(9)

低級烷氧基團、鹵素原子及酮基團中之基團以作為取代基)，

( xlvii) 喹啉基團 ( 其可具有低級烷基團 ) ，

( xlviii) 苯並二噁茂基低級烷基團，

( xlix) 芳基團 ( 其可具有擇自

鹵素原子；低級烷基團；低級烷氧基團；經鹵素取代之低級烷基團；經鹵素取代之低級烷氧基團；低級烯基團；胺基團 ( 其可具有擇自低級烷醯基團，低級烷磺醯基團，低級烷基團及芳基團中之基團 ) ；胺基磺醯基團；低級烷硫基團；低級烷醯基團；低級烷氧羰基團；吡咯基團；低級炔基團；氰基團；硝基團；芳氧基團；芳基低級烷氧基團；羥基團；羥基低級烷基團；胺基甲醯基團 ( 其可具有擇自低級烷基及芳基團中之基團 ) ；吡啶基團；吡咯啉基團 ( 其可具有酮基團 ) ；噁啶基團；咪啶基團 ( 其可具有低級烷基團 ) ；二氫呋喃基團 ( 其可具有酮基團 ) ；噻啶基團低級烷基團 ( 其可具有酮基團 ) ；咪啶基低級烷醯基團及六氫吡啶羰基團中之取代基 ) ，

( l) 氰基低級烷基團，

( li) 二氫喹啉基團 ( 其可具有擇自低級烷基團及酮基團中之基團 ) ，

( lii) 經鹵素取代之低級烷胺基團，

( liii) 低級烷硫基低級烷基團，

( liv) 脒基團 ( 其可具有低級烷基團 ) ，

( lv) 脒基低級烷基團，

(10)

( lvi ) 低級烯氧基低級烷基團，

( lvii ) 芳胺基團（其可於芳基團上具有擇自低級烷基團，低級烷氧基團，經鹵素取代之低級烷基團及經鹵素取代之低級烷氧基團中之取代基），

( lviii ) 芳基低級烯基團，

( lix ) 吡啶基胺基團（其可具有低級烷基團），

( lx ) 芳基低級烷基團（其可於芳基團及/或低級烷基團上具有擇自鹵素原子，低級烷基團，經鹵素取代之烷基團，經鹵素取代之低級烷氧基團，低級烷氧基團，胺基甲醯基團，及低級烷氧羰基團中之基團以作為取代基），

( lxi ) 低級炔基團，

( lxii ) 芳氧基低級烷基團（其可於芳基團上具有擇自低級烷氧基團；胺基甲醯基團（其可具有擇自低級烷氧基團及低級烷基團中之基團）；及吡咯啶基團（其可具有酮基團）中之基團以作為取代基），

( lxiii ) 異噁唑啶基團（其可具有酮基團），

( lxiv ) 二氫茛基團，

( lxv ) 芳基低級烷氧基低級烷基團，

( lxvi ) 四氫哌喃基團，

( lxvii ) 吡丁啶基團（其可具有擇自低級烷醯基團及芳醯基團中之基團），

( lxviii ) 吡丁啶基低級烷基團（其可具有擇自低級烷醯基團及芳醯基團中之基團），

( lxix ) 四唑基團，

(11)

( lxx ) 吡啶基團 ( 其可具有酮基團 ) ,

( lxxi ) 三唑基團 ( 其可具有擇自低級烷基團及低級  
烷硫基團中之基團 ) ,

( lxxii ) 咪唑基團 ( 其可具有胺基甲醯基團 ) ,

( lxxiii ) 噁唑基團 ( 其可具有低級烷基團 ) ,

( lxxiv ) 異噻唑基團 ( 其可具有低級烷基團 ) ,

( lxxv ) 苯並咪唑基團 ,

( lxxvi ) 二氫苯並噻唑基團 ( 其可具有酮基團 ) ,

( lxxvii ) 噻吩基團 ( 其可具有低級烷氧羰基團 ) ,

( lxxviii ) 噁唑基低級烷基團 ( 其可具有低級烷基  
團 ) ,

( 29 ) 胺基低級烷基團 ( 其可於胺基團上具有擇自低  
級烷基團 , 經鹵素取代之低級烷基團 , 低級烷氧羰基團 ,  
低級烷醯基團 , 芳基團 , 芳基低級烷基團 , 芳醯基團 , 及  
經胺基取代之烷基團 ( 經胺基取代之烷基團中之胺基團  
上 , 可存在低級烷基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ,

( 30 ) 經胺基甲醯基團取代之低級烷基團 ( 其可具有  
擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團 ) ,

( 31 ) 硫代胺基甲醯基團 ( 其可具有低級烷基團 ) ,

( 32 ) 胺基磺醯基團 ,

( 33 ) 噁唑啉基團 ( 其可具有酮基團 ) ,

( 34 ) 咪唑啉基團 ( 其可具有擇自酮基團及低級烷基  
團中之基團 ) ,

( 35 ) 吡咯啉基團 ( 其可具有酮基團 ) ,

(12)

( 36 ) 咪唑基團，

( 37 ) 三唑基團，

( 38 ) 異噁唑基團，

( 39 ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有擇自低級烷基團、低級烷醯基團、芳磺醯基團、酮基團、羥基團及胺基團 ( 其可具有擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團及低級烷醯胺基低級烷醯基團中之基團 ) 中之取代基 ) ，

( 40 ) 六氫吡啶基羰基團 ( 其可具有擇自低級烷基團，羥基團，羥基低級烷基團，低級烷醯基團，羧基低級烷基團，低級烷基胺基甲醯基低級烷基團，胺基甲醯基團，低級烷氧基團，羧基團，低級烷氧羰基團，胺基團 ( 其上可存在 1 至 2 個擇自低級烷基團，低級烷醯基團，低級烷氧羰基團及芳醯基團中之基團 ) ，六氫吡啶基團 ( 其上可存在擇自低級烷醯基團，低級烷氧羰基團及芳醯基團中之基團 ) ，六氫吡啶基團 ( 其上可存在低級烷基團以作為取代基 ) ，1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基團，嗎啉基團，六氫-1,4-二氮雜草基團 ( 其上可存在低級烷基團以作為取代基 ) ，吡啶基團，吡啶氧基團，吡啶基低級烷氧基團，四氫喹啉基團 ( 其上可存在酮基團 ) ，苯並二噁茂基團，芳基低級烷氧基團 ( 其可於芳基團上具有擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷氧基團中之基團 ) ，芳基團 ( 其上可存在擇自鹵素原子，低級烷氧基團及羥基團中之基團 ) ，芳氧基團 ( 其可於芳基團上具有擇自氰基團，鹵素原子，低級烷基團，低級烷

(13)

氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團)，芳基低級烷基團（其可於芳基團上具有擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），及芳醯基團（其可於芳基團上具有擇自鹵素原子及低級烷氧基團中之基團）中之基團），

（41）吡咯啉基羰基團（其可具有擇自羥基低級烷基團，胺基甲醯基團，羥基團，胺基團（胺基團上可具有擇自低級烷基團，低級烷醯基團及芳醯基團中之基團），嗎啉基低級烷基團，吡咯啉基低級烷基團，六氫吡啶基低級烷基團，六氫吡嗪基低級烷基團（六氫吡嗪基團上可具有低級烷基團以作為取代基），胺基低級烷基團（胺基團上可具有低級烷基團以作為取代基），及芳氧基團（芳基團上可具有經鹵素取代之低級烷氧基團），芳氧基低級烷基團（芳基團上可存在經鹵素取代之低級烷氧基團），及四氫喹啉基團（其上可存在酮基團）中之基團），

（42）六氫吡嗪基羰基團（其可具有擇自低級烷基團，環 C3-C8 烷基團，低級烷醯基團，羥基低級烷基團，低級烷氧基低級烷基團，低級烷氧羰基團，胺基低級烷基團（胺基團上可具有低級烷基團以作為取代基），六氫吡啶基低級烷基團（六氫吡啶基團上可具有低級烷基團以作為取代基），嗎啉基低級烷基團，吡咯啉基低級烷基團，1,3-二噁茂烷基低級烷基團，四氫呋喃基低級烷基團，吡啶基低級烷基團（低級烷基團上可具有苯基團以作為取代基），咪唑基低級烷基團，呋喃基低級烷基團，吡咯啉基



(14)

羰基低級烷基團，六氫吡啶基團（其可具有低級烷基團以作為取代基），吡啶基團（吡啶基團上可存在擇自低級烷基團，氰基團，及經鹵素取代之低級烷基團中之基團以作為取代基），噻吩並[2,3-b]吡啶基團，芳基團（其上可存在擇自鹵素原子及低級烷基團中之基團），芳醯基團，呋喃基羰基團，芳基低級烷氧羰基團及酮基團中之基團），

（43）六氫氮雜草基羰基團，

（44）六氫-1,4-二氮雜草基羰基團（其可具有擇自低級烷基團及吡啶基團中之取代基），

（45）二氫吡咯基羰基團（其可具有低級烷基團），

（46）硫代嗎啉基羰基團，

（47）嗎啉基羰基團（其可具有擇自低級烷基團、六氫吡啶基低級烷基團、及芳基團中之基團），

（48）噻唑啶基羰基團（其可具有芳基團且芳基團可具有擇自低級烷氧基團及氰基團中之基團），

（49）氮雜二環[3.2.2]壬基羰基團，

（50）8-氮雜二環[3.2.1]辛基羰基團（其可具有經鹵素取代或未經取代之芳氧基團），

（51）吲哚基羰基團，

（52）四氫喹啉基羰基團，

（53）四氫吡啶並[3.4-b]吲哚基羰基團，

（54）嗎啉基低級烷基團，

（55）六氫吡嗪基低級烷基團（其可於六氫吡嗪基團上具有低級烷基團），

(15)

(56) 嗎啉基羰基低級烷基團，

(57) 六氫吡咩基羰基低級烷基團（其可於六氫吡咩基團上具有低級烷基團），

(58) 酮基團，

(59) 胺基低級烷氧基團（於胺基團上可存在低級烷基團），

(60) 低級烷氧基低級烷氧基團，

(61) 六氫吡咩基團（其可具有擇自酮基團、低級烷基團、低級烷醯基團及低級烷氧羰基團中之基團），

(62) 嗎啉基團，

(63) 1,3,8-三氮雜螺[4.5]癸基羰基團（其可具有擇自酮基團及芳基團中之基團），

(64) 四氫吡啶基羰基團（其可具有吡啶基團），

(65) 咪唑啶基羰基團（其可具有硫酮基團），

(66) 1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基團。

本發明提供通式（1）之化合物，其中

$R^1$  代表擇自下列（I）至（IV）之環 C5-C6 烷基團、芳族基團或雜環型基團：

（I）環 C5-C6 烷基團；

（II）擇自苯基團、萘基團、二氫茚基團及四氫萘基團中之芳族基團；

（III）具有 1 至 2 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中之雜原子之飽和或不飽和雜單環型基團，其擇自吡咯啶基團、六氫吡啶基團、吡唑基團、吡啶基團、嘧啶基團、吡

(16)

吡基團、異噁唑基團、噻唑基團、哌喃基團、及噻吩基團；及

(IV) 具有 1 至 4 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中之雜原子之苯稠合性雜環型基團，其擇自 (1) 四氫喹啉基團，(2) 四氫喹啉基團，(3) 二氫喹啉基團，(4) 吡啶基團，(5) 吡啶基團，(6) 異吡啶基團，(7) 苯並咪唑基團，(8) 二氫苯並咪唑基團，(9) 四氫苯並氮雜草基團，(10) 四氫苯並二氮雜草基團，(11) 六氫苯並吡辛因基團，(12) 二氫苯並噁吡基團，(13) 二氫苯並噁唑基團，(14) 苯並異噁唑基團，(15) 苯並噁二唑基團，(16) 四氫苯並氧氮雜草基團，(17) 二氫苯並噻吡基團，(18) 苯並噻唑基團，(19) 苯並噁噻基團，(20) 吡烯基團，(21) 二氫苯並呋喃基團，(22) 呋唑基團，(23) 二苯並呋喃基團及 (24) 喹啉基團。

其中  $R^1$  所代表之芳族基團及雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自下列 (1) 至 (66) 中之基團以作為取代基：

- (1) 低級烷基團，
- (2) 低級烯基團，
- (3) 經鹵素取代之低級烷基團，
- (4) 低級烷氧基團，
- (5) 苯氧基團，
- (6) 低級烷硫基團，
- (7) 經鹵素取代之低級烷氧基團，

(17)

( 8 ) 羥基團，

( 9 ) 苯基低級烷氧基團，

( 10 ) 羥基低級烷基團，

( 11 ) 低級烷氧基低級烷基團，

( 12 ) 鹵素原子，

( 13 ) 氰基團，

( 14 ) 苯基團，

( 15 ) 硝基團，

( 16 ) 胺基團，

( 17 ) 胺基團 ( 其具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團、低級烷磺醯基團、胺基甲醯基團、低級烷基胺基甲醯基團、胺基低級烷醯基團、低級烷醯胺基低級烷醯基團及低級烷氧基羰胺基低級烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ，

( 18 ) 低級烷醯基團，

( 19 ) 苯磺醯基團 ( 其可於苯基團上具有單一之低級烷基團 ) ，

( 20 ) 羧基團，

( 21 ) 低級烷氧羰基團，

( 22 ) 羧基低級烷基團，

( 23 ) 低級烷氧羰基低級烷基團，

( 24 ) 低級烷醯胺基低級烷醯基團，

( 25 ) 羧基低級烯基團，

( 26 ) 低級烷氧羰基低級烯基團，

(18)

(27) 胺基甲醯基低級烯基團 (其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團及經 1 至 3 個鹵素取代之低級烷基團中之基團以作為取代基) ,

(28) 胺基甲醯基團, 其可具有 1 至 2 個擇自下列 (i) 至 (lxxviii) 中之基團以作為取代基:

(i) 低級烷基團,

(ii) 低級烷氧基團,

(iii) 羥基低級烷基團,

(iv) 低級烷氧基低級烷基團,

(v) 苯氧基低級烷基團,

(vi) 經鹵素取代之低級烷基團,

(vii) 胺基低級烷基團 (其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、苯甲醯基團及胺基甲醯基團中之基團) ,

(viii) 環 C3-C8 烷基團 (其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團、羥基團、低級烷氧羰基團及苯基低級烷氧基團中之基團以作為取代基) ,

(ix) 經環 C3-C8 烷基取代之低級烷基團,

(x) 低級烯基團,

(xi) 具 1 至 2 個胺基甲醯基團之低級烷基團 (其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、苯基團 (可具有單一之低級烷基團) 及苯基團 (可具有單一之低級烷氧基團) 中之基團以作為取代基) ,

(xii) 具有 1 至 2 個低級烷氧羰基團之低級烷基團,

(19)

( xiii ) 呋喃基低級烷基團（其可於呋喃基團上具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），

( xiv ) 四氫呋喃基低級烷基團，

( xv ) 1,3-二噁茂烷基低級烷基團，

( xvi ) 四氫吡喃基低級烷基團，

( xvii ) 吡咯基低級烷基團（其可於吡咯基團上具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），

( xviii ) 經二氫吡啶基團取代之低級烷氧基團（其可具有單一之酮基團），

( xix ) 吡啶基低級烷基團（其可於吡啶基團上具有 1 至 3 個低級烷基團以作為取代基），

( xx ) 咪啶基低級烷基團，

( xxi ) 吡啶基低級烷基團，

( xxii ) 吡嗪基低級烷基團（其可於吡嗪基團上具有 1 至 3 個（最好 1 個）低級烷基團以作為取代基），

( xxiii ) 吡咯啉基低級烷基團（其可於吡咯啉基團上具有 1 至 2 個擇自酮基團及低級烷基團中之基團以作為取代基），

( xxiv ) 六氫吡啶基低級烷基團（其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個擇自苯甲醯基團及低級烷醯基團中之基團以作為取代基），

( xxv ) 六氫吡嗪基低級烷基團（其可於六氫吡嗪基團上具有 1 至 3 個低級烷基團以作為取代基），

( xxvi ) 嗎啉基低級烷基團，

(20)

( xxvii ) 噻吩基低級烷基團 ( 其可於噻吩基團上具有 1 至 3 個低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xxviii ) 噻唑基低級烷基團 ,

( xxix ) 二氫苯並呋喃基低級烷基團 ,

( xxx ) 苯並呋喃基低級烷基團 ( 其可於苯並呋喃基團上具有單一之酮基團以作為取代基 ) ,

( xxxii ) 苯並咪唑基低級烷基團 ,

( xxxiii ) 吡啶基低級烷基團 ( 其可於低級烷基團上具有 1 至 3 個低級烷氧羰基團 ) ,

( xxxiv ) 咪唑基低級烷基團 ( 其可於低級烷基團上具有 1 至 3 個擇自胺基甲醯基團及低級烷氧羰基團中之取代基 ) ,

( xxxv ) 吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團、低級烷氧基團及低級烷硫基低級烷基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxxvi ) 吡咯啉基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團、低級烷氧羰基團、低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxxvii ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團、低級烷氧羰基團、低級烷醯基團及苯甲醯基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團及鹵素原子中之基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ,

( xxxviii ) 四氫呋喃基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

(21)

( xxxix ) 六氫氮雜草基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( xxxix ) 吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團、苯基團及呋喃基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xl ) 噻啶基團 ,

( xli ) 噻二啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個低級烷基團 ) ,

( xlii ) 異噻啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個低級烷基團 ) ,

( xliii ) 吲啶基團 ,

( xliv ) 吲哚基團 ,

( xlv ) 四氫苯並噻啶基團 ,

( xlvii ) 四氫喹啉基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團、低級烷氧基團、鹵素原子及酮基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xlviii ) 喹啉基團 ( 其可具有 1 至 3 個低級烷基團 ) ,

( xlviii ) 苯並二噁茂基低級烷基團 ,

( xlix ) 苯基團或萘基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自

鹵素原子 ; 低級烷基團 ; 低級烷氧基團 ; 經鹵素取代之低級烷基團 ; 經鹵素取代之低級烷氧基團 ; 低級烯基團 ; 胺基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自低級烷醯基團 , 低級烷磺醯基團 , 低級烷基團及芳基團中之基團 ) ; 胺基磺醯基團 ; 低級烷硫基團 ; 低級烷醯基團 ; 低級烷氧羰基團 ;



(22)

吡咯基團；低級炔基團；氰基團；硝基團；苯氧基團；苯基低級烷氧基團；羥基團；羥基低級烷基團；胺基甲醯基團（其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基及苯基團中之基團）；吡唑基團；吡咯啉基團（其可具有單一之酮基團）；噁唑基團；咪唑基團（其可具有 1 至 3 個低級烷基團）；二氫呋喃基團（其可具有單一之酮基團）；噻唑啉基低級烷基團（其可具有兩個酮基團）；咪唑基低級烷醯基團及六氫吡啶羰基團中之取代基），

（1）氰基低級烷基團，

（1i）二氫喹啉基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團及酮基團中之基團），

（1ii）經鹵素取代之低級烷胺基團，

（1iii）低級烷硫基低級烷基團，

（1iv）脒基團（其可具有低級烷基團），

（1v）脒基低級烷基團，

（1vi）低級烯氧基低級烷基團，

（1vii）苯胺基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自低級烷基團，低級烷氧基團，經鹵素取代之低級烷基團及經鹵素取代之低級烷氧基團中之取代基），

（1viii）苯基低級烯基團，

（lix）吡啶基胺基團（其可具有 1 至 3 個低級烷基團），

（1x）苯基低級烷基團（其可於苯基團及/或低級烷基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子，低級烷基團，經鹵素取

(23)

代之烷基團，經鹵素取代之低級烷氧基團，低級烷氧基團，胺基甲醯基團，及低級烷氧羰基團中之基團以作為取代基），

( lxi ) 低級炔基團，

( lxii ) 苯氧基低級烷基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自低級烷氧基團，N-低級烷氧基-N-低級烷基胺基甲醯基團，及酮基吡咯啉基團中之基團以作為取代基），

( lxiii ) 異噁唑啉基團（其可具有單一之酮基團），

( lxiv ) 二氫茛基團，

( lxv ) 苯基低級烷氧基低級烷基團，

( lxvi ) 四氫哌喃基團，

( lxvii ) 吡啶基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團），

( lxviii ) 吡啶基低級烷基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團），

( lxix ) 四唑基團，

( lxx ) 吡啶基團（其可具有單一之酮基團），

( lxxi ) 三唑基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團及低級烷硫基團中之基團），

( lxxii ) 咪唑基團（其可具有 1 至 3 個胺基甲醯基團），

( lxxiii ) 噁唑基團（其可具有 1 至 3 個低級烷基團），

(24)

( lxxiv ) 異噻唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個低級烷基團 ) ,

( lxxv ) 苯並咪唑基團 ,

( lxxvi ) 二氫苯並噻唑基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( lxxvii ) 噻吩基團 ( 其可具有 1 至 3 個低級烷氧羰基團 ) ,

( lxxviii ) 噁唑基低級烷基團 ( 其可具有 1 至 3 個低級烷基團 ) ,

( 29 ) 胺基低級烷基團 ( 其可於胺基團上具有 1 至 2 個擇自低級烷基團, 經鹵素取代之低級烷基團, 低級烷氧羰基團, 低級烷醯基團, 苯基團, 苯基低級烷基團, 苯甲醯基團, 及經胺基取代之烷基團 ( 經胺基取代之烷基團中之胺基團上, 可存在 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ,

( 30 ) 經單一之胺基甲醯基團取代之低級烷基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團 ) ,

( 31 ) 硫代胺基甲醯基團 ( 其可具有 1 至 2 個低級烷基團 ) ,

( 32 ) 胺基磺醯基團 ,

( 33 ) 噁唑啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( 34 ) 咪唑啉基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自酮基團及低級烷基團中之基團 ) ,

(25)

(35) 吡咯啉基團 (其可具有單一之酮基團) ,

(36) 咪唑基團 ,

(37) 三唑基團 ,

(38) 異噁唑基團 ,

(39) 六氫吡啶基團 (其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基基團、低級烷醯基團、低級烷基苯磺醯基團、酮基團、羥基基團及胺基基團 (其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基基團及低級烷醯胺基低級烷醯基團中之基團) 中之取代基) ,

(40) 六氫吡啶基羰基基團 (其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基基團, 羥基基團, 羥基低級烷基基團, 低級烷醯基團, 羧基低級烷基基團, 低級烷基胺基甲醯基低級烷基基團, 胺基甲醯基基團, 低級烷氧基基團, 羧基基團, 低級烷氧羰基基團, 胺基基團 (其上可存在 1 至 2 個擇自低級烷基基團, 低級烷醯基基團, 低級烷氧羰基基團及苯甲醯基基團中之基團) , 六氫吡啶基基團 (其上可存在 1 至 3 個擇自低級烷醯基基團, 低級烷氧羰基基團及苯甲醯基基團中之基團) , 六氫吡啶基基團 (其上可存在 1 至 3 個低級烷基基團以作為取代基) , 1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基基團, 嗎啉基基團, 六氫-1,4-二氮雜草基基團 (其上可存在單一之低級烷基基團以作為取代基) , 吡啶基基團, 吡啶氧基基團, 吡啶基低級烷氧基基團, 四氫喹啉基基團 (其上可存在單一之酮基基團) , 苯並二噁茂基基團, 苯基低級烷氧基基團 (其可於苯基基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子, 低級烷基基團, 低級烷氧基基團及經鹵素取代之低級烷氧

(26)

基團中之基團)，苯基團（其上可存在 1 至 3 個擇自鹵素原子，低級烷氧基團及羥基團中之基團），苯氧基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自氰基團，鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），苯基低級烷基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），及苯甲醯基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子及低級烷氧基團中之基團）中之基團），

（41）吡咯啉基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自羥基低級烷基團，胺基甲醯基團，羥基團，胺基團（胺基團上可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團，低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團），嗎啉基低級烷基團，吡咯啉基低級烷基團，六氫吡啶基低級烷基團，六氫吡嗪基低級烷基團（六氫吡嗪基團上可具有單一之低級烷基團以作為取代基），胺基低級烷基團（胺基團上可具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），苯氧基團（苯基團上可具有 1 至 3 個經鹵素取代之低級烷氧基團），苯氧基低級烷基團（苯基團上可存在 1 至 3 個經鹵素取代之低級烷氧基團），及四氫喹啉基團（其上可存在酮基團）中之基團），

（42）六氫吡嗪基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團，環 C3-C8 烷基團，低級烷醯基團，羥基低級烷基團，低級烷氧基低級烷基團，低級烷氧羰基團，胺基低級烷基團（胺基團上可具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取

(27)

代基)，六氫吡啶基低級烷基團（六氫吡啶基團上可具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），嗎啉基低級烷基團，吡咯啶基低級烷基團，1,3-二噁茂烷基低級烷基團，四氫呋喃基低級烷基團，吡啶基低級烷基團（低級烷基團上可具有 1 至 2 個苯基團以作為取代基），咪唑基低級烷基團，呋喃基低級烷基團，吡咯啶基羰基低級烷基團，六氫吡啶基團（其可具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），吡啶基團（吡啶基團上可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團，氰基團，及經鹵素取代之低級烷基團中之基團以作為取代基），噻吩並[2,3-b]吡啶基團，苯基團（其上可存在 1 至 3 個擇自鹵素原子及低級烷基團中之基團），苯甲鹽基團，呋喃基羰基團，苯基低級烷氧羰基團及酮基團中之基團），

（43）六氫氮雜草基羰基團，

（44）六氫-1,4-二氮雜草基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團及吡啶基團中之取代基），

（45）二氫吡咯基羰基團（其可具有 1 至 3 個低級烷基團），

（46）硫代嗎啉基羰基團，

（47）嗎啉基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基團、六氫吡啶基低級烷基團、及苯基團中之基團），

（48）噻唑啶基羰基團（其可具有 1 至 3 個苯基團且苯基團可具有 1 至 3 個擇自低級烷氧基團及氰基團中之基團），

(28)

( 49 ) 氮雜二環 [3.2.2]壬基羰基團，

( 50 ) 8-氮雜二環 [3.2.1]辛基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個經鹵素取代或未經取代之苯氧基團 ) ，

( 51 ) 吡啶基羰基團，

( 52 ) 四氫喹啉基羰基團，

( 53 ) 四氫吡啶並 [3.4-b]吡啶基羰基團，

( 54 ) 嗎啉基低級烷基團，

( 55 ) 六氫吡啶基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個低級烷基團 ) ，

( 56 ) 嗎啉基羰基低級烷基團，

( 57 ) 六氫吡啶基羰基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個低級烷基團 ) ，

( 58 ) 酮基團，

( 59 ) 胺基低級烷氧基團 ( 其可於胺基團上具有 1 至 2 個低級烷基團 ) ，

( 60 ) 低級烷氧基低級烷氧基團，

( 61 ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自酮基團、低級烷基團、低級烷醯基團及低級烷氧羰基團中之基團 ) ，

( 62 ) 嗎啉基團，

( 63 ) 1,3,8-三氮雜螺 [4.5]癸基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自酮基團及苯基團中之基團 ) ，

( 64 ) 四氫吡啶基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個吡啶基團 ) ，

(29)

( 65 ) 咪唑啉基羰基團 ( 其可具有單一之硫酮基團 ) ,

( 66 ) 1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基團。

本發明提供通式 ( 1 ) 所代表之化合物，其中

$R^1$  代表擇自下列 ( I ) 至 ( III ) 之環 C5-C6 烷基團、芳族基團或雜環型基團：

( I ) 環 C5-C6 烷基團；

( II ) 苯基團；及

( III ) 具有 1 至 2 個氮原子之擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡啶基團、吡啉基團、嘧啶基團及噻啶基團中之飽和或不飽和雜單環型基團，且

$R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基團、芳族基團及雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 ( 1 ) 至 ( 66 ) 中之基團以作為取代基。

本發明提供通式 ( 1 ) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表 ( I ) 環 C5-C6 烷基團；且於  $R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 ( 1 ) 至 ( 66 ) 中之基團以作為取代基。

本發明提供通式 ( 1 ) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表 ( II ) 苯基團；且於  $R^1$  所代表之芳族基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 ( 1 ) 至 ( 66 ) 中之基團以作為取代基。

本發明提供通式 ( 1 ) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表 ( III ) 具有 1 至 2 個氮原子之擇自吡咯啉基團、六氫吡啶



(30)

基團、吡唑基團、吡啶基團、嘧啶基團及噻唑基團中之飽和或不飽和雜單環型基團；且於  $R^1$  所代表之雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 (1) 至 (66) 中之基團以作為取代基。

本發明提供通式 (1) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表擇自下列 (I) 至 (III) 之環 C5-C6 烷基團、芳族基團或雜環型基團：

(I) 環 C5-C6 烷基團；

(II) 苯基團；

(III) 具有 1 至 2 個氮原子之擇自吡咯啶基團、六氫吡啶基團、吡唑基團、吡啶基團、嘧啶基團及噻唑基團中之飽和或不飽和雜單環型基團；且

於  $R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基團、芳族基團及雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自下列 (1)、(4)、(10)、(17)、(18)、(21)、(28)、(29)、(30)、(33)、(34)、(35)、(36)、(39)、(61) 及 (62) 中之基團以作為取代基：

(1) 低級烷基團，

(4) 低級烷氧基團，

(10) 羥基低級烷基團，

(17) 胺基團（其具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團、低級烷磺醯基團、胺基甲醯基團、低級烷基胺基甲醯基團、胺基低級烷醯基團、低級烷醯胺基低級烷醯基團及低級烷氧基羰胺基低級烷醯基

(31)

團中之基團以作為取代基)，

(18) 低級烷醯基團，

(21) 低級烷氧羰基團，

(28) 胺基甲醯基團，其可具有 1 至 2 個擇自下列 (i)、(ii)、(iv)、(xii) 及 (xxi) 中之基團以作為取代基：

(i) 低級烷基團，

(ii) 低級烷氧基團，

(iv) 低級烷氧基低級烷基團，

(xxii) 具有 1 至 2 個低級烷氧羰基團之低級烷基團，

(xxi) 吡啶基低級烷基團，

(29) 胺基低級烷基團（其可於胺基團上具有 1 至 2 個擇自低級烷基團，經鹵素取代之低級烷基團，低級烷氧羰基團，低級烷醯基團，苯基團，苯基低級烷基團，苯甲醯基團，及經胺基取代之烷基團（經胺基取代之烷基團中之胺基團上，可存在 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基）中之基團），

(30) 經單一之胺基甲醯基團取代之低級烷基團（其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），

(33) 噁唑啶基團（其可具有單一之酮基團），

(34) 咪唑啶基團（其可具有 1 至 2 個擇自酮基團及低級烷基團中之基團），

(32)

(35) 吡咯啉基團（其可具有單一之酮基團），

(36) 咪唑基團，

(39) 六氫吡啶基團（其可具有 1 至 3 個擇自低級烷基基團、低級烷醯基團、低級烷基苯磺醯基團、酮基團、羥基團及胺基團（其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團及低級烷醯胺基低級烷醯基團中之基團）中之取代基），

(61) 六氫吡嗪基團（其可具有 1 至 3 個擇自酮基團、低級烷基基團、低級烷醯基團及低級烷氧羰基團中之基團），及

(62) 嗎啉基團。

本發明提供通式 (1) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表 (I) 環己基團；且於  $R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基團上可存在 1 至 3 個擇自申請專利範圍第 8 項所定義之 (1)、(4)、(10)、(17)、(18)、(21)、(28)、(29)、(30)、(33)、(34)、(35)、(36)、(39)、(61) 及 (62) 中之基團以作為取代基。

本發明提供通式 (1) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表 (II) 苯基團；且於  $R^1$  所代表之芳族基團上可存在 1 至 3 個擇自申請專利範圍第 8 項所定義之 (1)、(4)、(10)、(17)、(18)、(21)、(28)、(29)、(30)、(33)、(34)、(35)、(36)、(39)、(61) 及 (62) 中之基團以作為取代基。

本發明提供通式 (1) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表

(33)

(II) 苯基團；且於  $R^1$  所代表之芳族基團上可存在 1 至 3 個下列 (1)、(4)、(10)、(17)、(18)、(28)、(33)、(35)、(39)、及 (61) 中之基團以作為取代基。

(1) 低級烷基團，

(4) 低級烷氧基團，

(10) 羥基低級烷基團，

(17) 胺基團（其具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、胺基低級烷醯基團、低級烷醯胺基低級烷醯基團及低級烷氧基羰胺基低級烷醯基團中之基團以作為取代基），

(18) 低級烷醯基團，

(28) 胺基甲醯基團，其可具有單一之低級烷氧基低級烷基團：

(33) 噁唑啉基團（其可具有單一之酮基團），

(35) 吡咯啉基團（其可具有單一之酮基團），

(39) 六氫吡啶基團，及

(61) 六氫吡啶基團（其可具有 1 至 2 個擇自酮基團、低級烷醯基團及低級烷氧羰基團中之基團）。

根據申請專利範圍第 11 項之化合物，其中  $R^1$  為苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之胺基團（胺基團上具有 1 或 2 個低級烷基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之胺基甲醯基團（具有單一之低級

(34)

烷基團，且低級烷基團上具有兩個低級烷氧基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之羥基低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之噁唑啉基團（噁唑啉基團上具有單一之酮基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之吡咯啉基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之六氫吡啶基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之六氫吡嗪基團（六氫吡嗪基團上具有單一之低級烷醯基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之六氫吡嗪基團（六氫吡嗪基團上具有單一之低級烷醯基團及單一之酮基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之六氫吡嗪基團（六氫吡嗪基團上具有單一之低級烷氧羰基團及單一之酮基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之 N-[（N-低級烷氧羰基胺基）低級烷醯基]胺基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之低級烷氧基團、及單一之 N-（胺基低級烷醯基）胺基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷基團、單一之

(35)

低級烷氧基團、及單一之 N-[ ( N-低級烷醯胺基 ) 低級烷醯基 ]胺基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷氧基團、單一之低級醯基團、及單一之六氫吡咩基團（六氫吡咩基團上具有單一之低級烷氧羰基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之低級烷氧基團、單一之羥基低級烷基團、及單一之六氫吡咩基團（六氫吡咩基團上具有單一之低級烷氧羰基團）。

本發明提供通式（1）所代表之化合物，其中  $R^1$  代表（III）具有 1 至 2 個氮原子之擇自六氫吡啶基團、吡啶基團、及噻啶基團中之飽和或不飽和雜單環型基團；且於  $R^1$  所代表之雜環型基團上可存在 1 至 3 個擇自申請專利範圍第 8 項所定義之（1）、（4）、（10）、（17）、（18）、（21）、（28）、（29）、（30）、（33）、（34）、（35）、（36）、（39）、（61）及（62）中之基團以作為取代基。

本發明提供通式（1）所代表之化合物，其中  $R^1$  代表（III）具有 1 至 2 個氮原子之擇自六氫吡啶基團、吡啶基團、及噻啶基團中之飽和或不飽和雜單環型基團；且於  $R^1$  所代表之雜環型基團上可存在 1 至 3 個擇自下列（1）、（17）、及（28）中之基團以作為取代基。

（1）低級胺基團；

（17）胺基團（其具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、及低級烷醯基團中之基團以作為取代基），

(36)

(28) 胺基甲醯基團，其可具有 1 至 2 個低級烷基團。

本發明提供通式 (1) 所代表之化合物，其中  $R^1$  代表吡唑基團（其具有單一之低級烷基團及單一之低級烷醯胺基團）；

吡唑基團（其具有單一之低級烷基團及單一之 N,N-二-低級烷胺基團）；

六氫吡啶基團（其具有單一之 N,N-二-低級烷基胺基甲醯基團）；

噻唑基團（其具有單一之 N,N-二-低級烷基胺基甲醯基團）。

本發明提供藥學組成物，其包含根據本發明之作爲有效成分之通式 (1) 雜環型化合物或其鹽，以及藥學上可接受之載體。

本發明提供根據本發明之藥學組成物，其可以藥學組成物之形式用以治療或預防中樞神經系統病症。

本發明提供根據本發明之藥學組成物，其可以藥學組成物之形式用以治療或預防擇自精神分裂症；執拗性、頑固性或慢性精神分裂症；情緒性障礙；精神性病症；情感性病症；第 I 型躁鬱症；第 II 型躁鬱症；抑鬱症；內源性抑鬱症；重症抑鬱症；憂鬱症及執拗性抑鬱症；情緒不良病症；循環性情感精神病症；恐慌發作；恐慌症；廣場恐怖症；社交恐懼症；強迫症；外傷後壓力症；全身性焦慮症；急性壓力症；歇斯底里症；軀體症狀病症；轉化性病

(37)

症；疼痛病症；疑病症；捏造性病症；分裂性病症；性功能障礙；性慾病症；性喚醒病症；勃起功能障礙；厭食症；飽食症；睡眠症；適應病症；酒精濫用；酒精中毒；藥物成癮；興奮劑中毒；麻醉劑中毒；快感缺乏；醫師原性快感缺乏；精神或心理原因之快感缺乏；與抑鬱症有關之快感缺乏；與精神分裂症有關之快感缺乏；譫妄；認知損害；與阿滋海默症有關之認知損害；帕金森氏症及其它神經變性病症；因阿滋海默症，帕金森氏症及相關之神經變性病症所致之認知損害；精神分裂症之認知損害；因執拗性、頑固性或慢性精神分裂症所致之認知損害；嘔吐；動暈症；肥胖症；偏頭痛；疼痛；精神障礙；自閉症；妥瑞氏症；抽搐症；注意力缺乏/過動症；行為障礙；及唐氏症中之中樞神經系統病症。

本發明提供藥學組成物之製造方法，其包含將式（1）所代表之雜環型化合物或其鹽與藥學上可接受之載體混合。

本發明提供將式（1）所代表之雜環型化合物或其鹽作為藥物上之用途。

本發明特別提供將式（1）所代表之雜環型化合物或其鹽作為多巴胺 D<sub>2</sub> 受體部分激動劑及/或血清素 5-HT<sub>2A</sub> 受體拮抗劑及/或腎上腺素  $\alpha$  1 受體拮抗劑及/或血清素吸收抑制劑（或血清素再吸收抑制劑）。

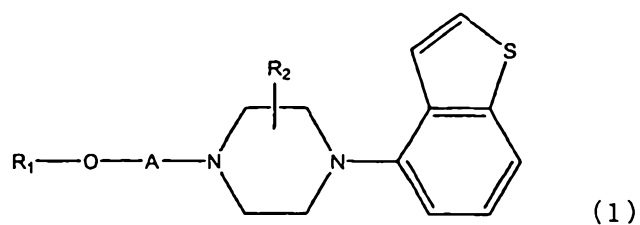
本發明提供治療或預防中樞神經系統病症之方法，其包含將式（1）所代表之雜環型化合物或其鹽投服予人類



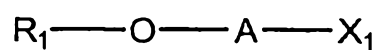
(38)

或動物。

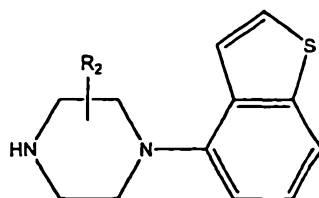
本發明提供式(1)所代表之雜環型化合物或其鹽之製造方法：



[其中  $R_1$ 、 $R_2$  及  $A$  與申請專利第 1 項中所定義者相同]，  
其特徵為包含令下式所代表之化合物或其鹽



[其中  $R_1$  及  $A$  與上文所定義者相同，且  $X_1$  代表鹵素原子  
或代表與鹵素原子中所引致之取代反應相同之基團]與下  
式所代表之化合物或其鹽起反應



[其中  $R_2$  與上文所定義者相同]。

進行本發明之最佳模式

(39)

通式 (1) 中所示之每一個基團之特定實例如下。

通式中所示之每一個基團之特定實例如下。

低級烷基團之實例包括具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團。其特定實例包括甲基團、乙基團、正丙基團、異丙基團、正丁基團、異丁基團、第三丁基團、另丁基團、正戊基團、1-乙基丙基團、異戊基團、新戊基團、正己基團、1,2,2-三甲基丙基團、3,3-二甲基丁基團、2-乙基丁基團、異己基團、及 3-甲基戊基團。

低級烷撐基團之實例包括具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷撐基團。其特定實例包括甲撐基團、乙撐基團、丙撐基團、2-甲基丙撐基團、2,2-二甲基乙撐基團、2,2-二甲基丙撐基團、1-甲基丙撐基團、甲基甲撐基團、乙基甲撐基團、丁撐基團、戊撐基團及己撐基團。

低級烯撐基團之實例包括具 1 至 3 個雙鍵及 2 至 6 個碳原子之直或支鏈烯撐基團。其特定實例包括乙烯撐基團、1-丙烯撐基團、1-甲基-1-丙烯撐基團、2-甲基-1-丙烯撐基團、2-丙烯撐基團、2-丁烯撐基團、1-丁烯撐基團、3-丁烯撐基團、2-戊烯撐基團、1-戊烯撐基團、3-戊烯撐基團、4-戊烯撐基團、1,3-丁二烯撐基團、1,3-戊二烯撐基團、2-戊烯-4-撐基團、2-己烯撐基團、1-己烯撐基團、5-己烯撐基團、3-己烯撐基團、4-己烯撐基團、3,3-二甲基-1-丙烯撐基團、2-乙基-1-丙烯撐基團、1,3,5-己三烯撐基團、1,3-己二烯撐基團、及 1,4-己二烯撐基團。

低級烯基團之實例包括具 1 至 3 個雙鍵及 2 至 6 個碳

(40)

原子之直或支鏈烯基團，且包括反式及順式-構型。其特定實例包括乙烯基團、1-丙烯基團、2-丙烯基團、1-甲基-1-丙烯基團、2-甲基-1-丙烯基團、2-甲基-2-丙烯基團、2-丙烯基團、2-丁烯基團、1-丁烯基團、3-丁烯基團、2-戊烯基團、1-戊烯基團、3-戊烯基團、4-戊烯基團、1,3-丁二烯基團、1,3-戊二烯基團、2-戊烯-4-炔基團、2-己烯基團、1-己烯基團、5-己烯基團、3-己烯基團、4-己烯基團、3,3-二甲基-1-丙烯基團、2-乙基-1-丙烯基團、1,3,5-己三烯基團、1,3-己二烯基團、及1,4-己二烯基團。

鹵素原子之實例包括氟原子、氯原子、溴原子及碘原子。

經鹵素取代之低級烷基團之實例包括經1至7個，最好1至3個鹵素原子取代之上述低級烷基團。其特定實例包括氟甲基團、二氟甲基團、三氟甲基團、氯甲基團、二氯甲基團、三氯甲基團、溴甲基團、二溴甲基團、二氯基氟甲基團、2,2-二氟基乙基團、2,2,2-三氟基乙基團、五氟基乙基團、2-氟乙基團、2-氯乙基團、3,3,3-三氟丙基團、七氟丙基團、2,2,3,3,3-五氟丙基團、七氟異丙基團、3-氯丙基團、2-氯丙基團、3-溴丙基團、4,4,4-三氟丁基團、4,4,4,3,3-五氟丁基團、4-氯丁基團、4-溴丁基團、2-氯丁基團、5,5,5-三氟戊基團、5-氯戊基團、6,6,6-三氟己基團、6-氯己基團、及全氟己基團。

低級烷氧基團之實例包括具1至6個碳原子之直或支鏈烷氧基團。其特定實例包括甲氧基團、乙氧基團、正丙

(41)

氧基團、異丙氧基團、正丁氧基團、異丁氧基團、第三丁氧基團、另丁氧基團、正戊氧基團、異戊氧基團、新戊氧基團、正己氧基團、異己氧基團、及 3-甲基戊氧基團。

芳基團之實例包括苯基團、經取代苯基團、聯苯基團、經取代聯苯基團、萘基團及經取代萘基團。供芳基用之取代基實例包括如上所述之低級烷基團（最好為具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團），如上所述之鹵素原子，及胺基團。芳基團上可存在 1 至 7 個，最好 1 至 5 個，尤其 1 至 2 個這些當中之至少一種型式之取代基。芳基團之特定實例可包括苯基團、（2-，3-，或 4-）聯苯基團、（1-或 2-）萘基團、（2-，3-，或 4-）甲基苯基團、（2-，3-，或 4-）乙基苯基團、（2-，3-，或 4-）正丙基苯基團、（2-，3-，或 4-）正丁基苯基團、（2-，3-，或 4-）正戊基苯基團、（2-，3-，或 4-）正己基苯基團、（2-，3-，或 4-）異丁基苯基團、（2-，3-，或 4-）第三丁基苯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-2-聯苯基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5-，或 6'-）甲基-3-聯苯基團、（2-，3-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-4-聯苯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙基-2-聯苯基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙基-3-聯苯基團、（2-，3-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙基-4-聯苯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）正丙基-2-聯苯基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-

(42)

， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丙基-3-聯苯基團、( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丙基-4-聯苯基團、( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丁基-2-聯苯基團、( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丁基-3-聯苯基團、( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丁基-4-聯苯基團、( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正戊基-2-聯苯基團、( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正戊基-3-聯苯基團、( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正戊基-4-聯苯基團、( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正己基-2-聯苯基團、( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正己基-3-聯苯基團、( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正己基-4-聯苯基團、( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 異丁基-2-聯苯基團、( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 異丁基-3-聯苯基團、( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 異丁基-4-聯苯基團、( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 第三丁基-2-聯苯基團、( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 第三丁基-3-聯苯基團、( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 第三丁基-4-聯苯基團、( 2-， 3-， 4-， 5-， 6-， 7-， 或 8-) 甲基-1-萘基團、( 1-， 3-， 4-， 5-， 6-， 7-， 或 8-) 甲基-2-萘基團、( 2-， 3-， 4-， 5-， 6-， 7-， 或 8-) 乙基-1-萘基團、( 1-， 3-， 4-， 5-， 6-， 7-， 或 8-) 乙基-

(43)

2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丙基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丙基-2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丁基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丁基-2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正戊基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正戊基-2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正己基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正己基-2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 異丁基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 異丁基-2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 第三丁基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 第三丁基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 氨基苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 氟基苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 溴基苯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氨基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氨基-2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氟基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氟基-2-萘基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 溴基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 溴基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 胺基苯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 胺基-1-萘基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 胺基-2-萘基團、2,3-二甲基苯基團、3,4-二甲基苯基團、2,4-二甲基苯基團、2,5-二甲基苯基團、2,6-二甲基苯基團、2,4,6-三甲基苯基團、3,4,5-三

(44)

甲基苯基團、2,3,4,5-四乙基苯基團、五甲基苯基團、2,4-二甲基-1-萘基團、2,3-二甲基-1-萘基團、3,4-二甲基-1-萘基團、3,5,7-三乙基萘基團、3,4,5,7-四甲基-1-萘基團、2,3,4,5,7-五甲基-1-萘基團、2,3,4,5,6,7-六乙基-1-萘基團、七甲基-1-萘基團、2,3-二胺基苯基團、2,4,6-三胺基苯基團、及 2-甲基-5-氨基-1-萘基團。

芳氧基團之實例包括苯氧基團、經取代苯氧基團、聯苯氧基團、經取代聯苯氧基團、萘氧基團及經取代萘氧基團。供芳氧基團用之取代基實例包括如上所述之低級烷基團（最好為具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團），如上所述之鹵素原子，及胺基團。芳基團上可存在 1 至 7 個，最好 1 至 5 個，尤其 1 至 2 個這些當中之至少一種型式之取代基。芳氧基團之特定實例可包括苯氧基團、（2-，3-，或 4-）聯苯氧基團、（1-或 2-）萘氧基團、（2-，3-，或 4-）甲基苯氧基團、（2-，3-，或 4-）乙基苯氧基團、（2-，3-，或 4-）正丙基苯氧基團、（2-，3-，或 4-）正丁基苯氧基團、（2-，3-，或 4-）正戊基苯氧基團、（2-，3-，或 4-）正己基苯氧基團、（2-，3-，或 4-）異丁基苯氧基團、（2-，3-，或 4-）第三丁基苯氧基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-2-聯苯氧基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-3-聯苯氧基團、（2-，3-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-4-聯苯氧基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙基-2-聯苯氧基團、（2-，4-，5-

(45)

， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 乙基-3-聯苯氧基團、  
 ( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 乙基-4-  
 聯苯氧基團、 ( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或  
 6'-) 正丙基-2-聯苯氧基團、 ( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-  
 ， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丙基-3-聯苯氧基團、 ( 2-， 3-， 5-  
 ， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丙基-4-聯苯氧基  
 團、 ( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丁  
 基-2-聯苯氧基團、 ( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-  
 ， 或 6'-) 正丁基-3-聯苯氧基團、 ( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-  
 ， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正丁基-4-聯苯氧基團、 ( 3-，  
 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正戊基-2-聯苯  
 氧基團、 ( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-)  
 正戊基-3-聯苯氧基團、 ( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-  
 ， 5'-， 或 6'-) 正戊基-4-聯苯氧基團、 ( 3-， 4-， 5-， 6-  
 ， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正己基-2-聯苯氧基團、  
 ( 2-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 正己基-  
 3-聯苯氧基團、 ( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-，  
 或 6'-) 正己基-4-聯苯氧基團、 ( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-，  
 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 異丁基-2-聯苯氧基團、 ( 2-， 4-  
 ， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 異丁基-3-聯苯氧  
 基團、 ( 2-， 3-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 異  
 丁基-4-聯苯氧基團、 ( 3-， 4-， 5-， 6-， 2'-， 3'-， 4'-，  
 5'-， 或 6'-) 第三丁基-2-聯苯氧基團、 ( 2-， 4-， 5-， 6-  
 ， 2'-， 3'-， 4'-， 5'-， 或 6'-) 第三丁基-3-聯苯氧基團、



(46)

( 2- , 3- , 5- , 6- , 2'- , 3'- , 4'- , 5'- , 或 6'- ) 第三丁基 -4-聯苯氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 甲基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 甲基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 乙基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 乙基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丙基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丙基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丁基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丁基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正戊基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正戊基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正己基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正己基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 異丁基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 異丁基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 第三丁基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 第三丁基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 或 4- ) 氯基苯氧基團、 ( 2- , 3- , 或 4- ) 氟基苯氧基團、 ( 2- , 3- , 或 4- ) 溴基苯氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氯基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氯基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -1-萘氧基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -2-萘氧基團、 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 溴基 -1-萘氧基

(47)

團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 溴基-2-萘氧基團、(2-, 3-, 或 4-) 胺基苯氧基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 胺基-1-萘氧基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 胺基-2-萘氧基團、2,3-二甲基苯氧基團、3,4-二甲基苯氧基團、2,4-二甲基苯氧基團、2,5-二甲基苯氧基團、2,6-二甲基苯氧基團、2,4,6-三甲基苯氧基團、3,4,5-三甲基苯氧基團、2,3,4,5-四乙基苯氧基團、五甲基苯氧基團、2,4-二甲基-1-萘氧基團、2,3-二甲基-1-萘氧基團、3,4-二甲基-1-萘氧基團、3,5,7-三乙基-1-萘氧基團、3,4,5,7-四甲基-1-萘氧基團、2,3,4,5,7-五甲基-1-萘氧基團、2,3,4,5,6,7-六乙基-1-萘氧基團、七甲基-1-萘氧基團、2,3-二胺基苯氧基團、2,4,6-三胺基苯氧基團、及 2-甲基-5-氯基-1-萘氧基團。

低級烷硫基團之實例包括具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷硫基團。其特定實例包括甲硫基團、乙硫基團、正丙硫基團、異丙硫基團、正丁硫基團、第三丁硫基團、正戊硫基團、及正己硫基團。

經鹵素取代之低級烷氧基團之實例包括經 1 至 7 個、最好 1 至 3 個鹵素原子取代之如上所述之低級烷氧基團。其特定實例包括氟甲氧基團、二氟甲氧基團、三氟甲氧基團、氯甲氧基團、二氯甲氧基團、三氯甲氧基團、溴甲氧基團、二溴甲氧基團、二氯基氟甲氧基團、2,2,2-三氟基乙氧基團、五氟基乙氧基團、2-氯乙氧基團、3,3,3-三氟丙氧基團、七氟丙氧基團、七氟異丙氧基團、3-氯丙氧基

(48)

團、2-氯丙氧基團、3-溴丙氧基團、4,4,4-三氟丁氧基團、4,4,4,3,3-五氟丁氧基團、4-氯丁氧基團、4-溴丁氧基團、2-氯丁氧基團、5,5,5-三氟戊氧基團、5-氯戊氧基團、6,6,6-三氟己氧基團、及6-氯己氧基團。

經保護之羥基之實例包括甲氧基團、乙氧基團、正丙氧基團、異丙氧基團、正丁氧基團、異丁氧基團、第三丁氧基團、另丁氧基團、正戊氧基團、異戊氧基團、新戊氧基團、正己氧基團、異己氧基團、3-甲基戊氧基團、低級烷醯氧基團及苯基低級烷氧基團。特定實例包括甲醯氧基團、乙醯氧基團、丙醯氧基團、丁醯氧基團、異丁醯氧基團、戊醯氧基團、第三丁羧氧基團、己醯氧基團、苄氧基團、2-苯基乙氧基團、1-苯基乙氧基團、3-苯基丙氧基團、4-苯基丁氧基團、5-苯基戊氧基團、6-苯基己氧基團、1,1-二甲基-2-苯基乙氧基團、及2-甲基-3-苯基丙氧基團。

羥基低級烷基團之實例包括具有1至5個，最好1至3個羥基團之如上所述之低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括羥甲基團、2-羥基乙基團、1-羥基乙基團、3-羥基丙基團、2,3-二羥基丙基團、4-羥基丁基團、3,4-二羥基丁基團、1,1-二甲基-2-羥基乙基團、5-羥基戊基團、6-羥基己基團、3,3-二甲基-3-羥基丙基團、2-甲基-3-羥基丙基團、2,3,4-三羥基丁基團、及全羥基己基團。

羥基低級烷基團之保護基團之實例包括具1至6個碳

(49)

原子之直或支鏈烷基團、低級烷醯基團（最好為具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團），及苯基低級烷基團且彼之低級烷基部分為具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團。

經保護之羥基低級烷基團之實例包括具 1 至 5 個，最好 1 至 3 個如上所述經保護羥基團（最好為低級烷氧基團、低級烷醯氧基團或苯基低級烷氧基團）之如上所述低級烷基團（最好為具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括甲氧基甲基團、2-甲氧基乙基團、2-乙氧基乙基團、2-正丙氧基乙基團、2-異丙氧基乙基團、2-正丁氧基乙基團、2-異丁氧基乙基團、2-第三丁氧基乙基團、2-另丁氧基乙基團、2-正戊氧基乙基團、2-異戊氧基乙基團、2-新戊氧基乙基團、2-正己氧基乙基團、2-異己氧基乙基團、2-（3-甲基戊氧基）乙基團、2-甲醯氧基乙基團、2-乙醯氧基乙基團、2-丙醯氧基乙基團、2-丁醯氧基乙基團、2-異丁醯氧基乙基團、2-戊醯氧基乙基團、2-第三丁基羧氧基乙基團、2-己醯氧基乙基團、2-苄氧基乙基團、2-（2-苯基乙氧基）乙基團、2-（1-苯基乙氧基）乙基團、2-（3-苯基丙氧基）乙基團、2-（4-苯基丁氧基）乙基團、2-（5-苯基戊氧基）乙基團、2-（6-苯基己氧基）乙基團、2-（1,1-二甲基-2-苯基乙氧基）乙基團、2-（2-甲基-3-苯基丙氧基）乙基團、3-乙氧基丙基團、2,3-二乙氧基丙基團、4-乙氧基丁基團、3,4-二乙氧基丁基團、1,1-二甲基-2-乙氧基乙基團、5-乙氧基戊基團、6-乙氧基己基團、3,3-二甲基-3-乙氧基丙基團、2-甲

(50)

基-3-乙氧基丙基團、及2,3,4-三乙氧基丁基團。

低級烷醯基團之實例包括具1至6個碳原子之直或支鏈烷醯基團。其特定實例包括甲醯基團、乙醯基團、丙醯基團、丁醯基團、異丁醯基團、戊醯基團、第三丁羰基團、及己醯基團。

低級烷氧羰基團之實例包括直或支鏈之烷氧羰基團且彼之低級烷氧基部分為如上所述者，且最好具有1至6個碳原子。其特定實例包括甲氧羰基團、乙氧羰基團、正丙氧羰基團、異丙氧羰基團、正丁氧羰基團、異丁氧羰基團、第三丁氧羰基團、另丁氧羰基團、正戊氧羰基團、新戊氧羰基團、正己氧羰基團、異己及3-甲基戊氧羰基團。

低級烷磺醯基團之實例包括直或支鏈之烷磺醯基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，且最好具有1至6個碳原子。其特定實例包括甲磺醯基團、乙磺醯基團、正丙磺醯基團、異丙磺醯基團、正丁磺醯基團、異丁磺醯基團、第三丁磺醯基團、另丁磺醯基團、正戊磺醯基團、異戊磺醯基團、新戊磺醯基團、正己異己磺醯基團、及3-甲基戊磺醯基團。

低級烷基胺基甲醯基團之實例包括具有1至2個如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基之胺基甲醯基團。其特定實例包括N-甲基胺基甲醯基團、N,N-二甲基胺基甲醯基團、N-乙基胺基甲醯基團、N,N-二乙基胺基甲醯基團、N-正丙基胺基甲醯基團、N-正丁基胺基甲醯基團、N-正戊基胺基甲醯基

(51)

團、N-正己基胺基甲醯基團、N-異丁基胺基甲醯基團、N-第三丁基胺基甲醯基團、及N,N-二正丙基胺基甲醯基團。

胺基烷醯基團之實例包括具有1至3個（最好1個）胺基團之如上所述之低級烷醯基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷醯基團）。其特定實例包括胺基乙醯基團、3-胺基丙醯基團、4-胺基丁醯基團、3,4-二胺基丁醯基團、3,3-二甲基-3-胺基丙醯基團、4-胺基丁醯基團及5-胺基戊醯基團。

低級烷醯胺基低級烷醯基團之實例包括如上所述之低級烷醯基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷醯基團）且彼之低級烷醯基部分乃具有1至3個（最好1個）如上所述之低級烷醯胺基團。其特定實例包括N-甲醯胺基乙醯基團、N-乙醯胺基乙醯基團、N-丙醯胺基乙醯基團、3-（N-乙醯胺基）丙醯基團、4-（N-乙醯胺基）丁醯基團、3,4-二（N-乙醯胺基）丁醯基團、3,3-二甲基-3-（N-丙醯胺基）丙醯基團、4-（N-甲醯胺基）丁醯基團、及5-（N-乙醯胺基）戊醯基團。

低級烷氧羰基胺基低級烷醯基團之實例包括如上所述之低級烷醯基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷醯基團）且彼之低級烷氧羰基部分乃具有1至3個（最好1個）如上所述之低級烷氧羰基胺基團。其特定實例包括N-甲氧羰基胺基乙醯基團、N-乙氧羰基胺基乙醯基團、N-第三丁氧羰基胺基乙醯基團、3-（N-甲氧羰基胺基）丙醯基團、4-（N-乙醯胺基）丁醯基團、3,4-二（N-

(52)

乙醯胺基) 丁醯基團、3,3-二甲基-3-(N-丙醯胺基) 丙醯基團、4-(N-甲醯胺基) 丁醯基團及 5-(N-乙醯胺基) 戊醯基團。具有擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團、低級烷磺醯基團、胺基甲醯基團、低級烷基胺基甲醯基團、胺基低級烷醯基團、低級烷醯胺基低級烷醯基團、及低級烷氧羰胺基低級烷醯基團中之基團以作為取代基之胺基團之實例包括具有 1 至 2 個擇自：

如上所述之低級烷基團最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)；

如上所述之低級烷醯基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團)；

如上所述之低級烷氧羰基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團)；

如上所述之低級烷磺醯基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷磺醯基團)；

胺基甲醯基團；

如上所述之低級烷基胺基甲醯基團(最好為具有 1 至 2 個如上所述之低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)以作為取代基之胺基甲醯基團)；如上所述之胺基低級烷醯基團；如上所述之低級烷醯胺基低級烷醯基團；及如上所述之低級烷氧羰胺基低級烷醯基團中之基團以作為取代基之胺基團。其特定實例包括胺基團，N-甲胺基團、N,N-二甲胺基團、N-乙胺基團、N-丙胺基團、N-異丙胺基團、N-甲醯胺基團、N-乙醯胺基團、N-

(53)

第三丁氧羰基胺基團、N-甲氧羰基胺基團、N-甲磺醯基胺基團、N-乙磺醯基胺基團、N-甲基-N-乙醯胺基團、N-甲基-N-甲氧羰基胺基團、N-[N,N-二甲基胺基甲醯基]胺基團、N-胺基甲醯基胺基團、N-[N-甲基胺基甲醯基]胺基團、N-[N,N-二乙基胺基甲醯基]胺基團、N-[胺基乙醯基]胺基團、N-[[N 甲醯胺基]乙醯基]胺基團、N-[[N-乙醯胺基]乙醯基]胺基團、N-[[N-甲氧羰基胺基]乙醯基]胺基團、及 N-[[N-第三丁氧羰基胺基]乙醯基]胺基團。

芳磺醯基團（其可於芳基團上具有低級烷基團）之實例包括芳磺醯基團且彼之芳基部分為苯基、聯苯基、萘基等且於其上可具有 1 至 7 個，最好 1 至 5 個，尤其 1 至 2 個具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團。芳磺醯基團（其可於芳基團上具有低級烷基團）之特定實例包括苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）聯苯磺醯基團、（1-或 2-）萘磺醯基團、（2-，3-，或 4-）甲苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）乙苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正丙苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正丁苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正戊苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正己苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）異丁苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）第三丁苯磺醯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-2-聯苯磺醯基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5-，或 6'-）甲基-3-聯苯磺醯基團、（2-，3-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-4-聯苯磺醯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙



(54)

基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 乙基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 乙基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丙基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丙基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丙基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丁基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丁基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丁基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正戊基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正戊基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正戊基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正己基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正己基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正己基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 異丁基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 異丁基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 異丁基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 第三丁基-2-聯苯磺醯基團、

(55)

( 2- , 4- , 5- , 6- , 2'- , 3'- , 4'- , 5'- , 或 6'- ) 第三丁基 -3-聯苯磺醯基團、( 2- , 3- , 5- , 6- , 2'- , 3'- , 4'- , 5'- , 或 6'- ) 第三丁基 -4-聯苯磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 甲基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 甲基 -2-萘磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 乙基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 乙基 -2-萘磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丙基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丙基 -2-萘磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丁基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丁基 -2-萘磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正戊基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正戊基 -2-萘磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正己基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正己基 -2-萘磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 異丁基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 異丁基 -2-萘磺醯基團、( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 第三丁基 -1-萘磺醯基團、( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 第三丁基 -2-萘磺醯基團、2,3-二甲基苯磺醯基團、3,4-二甲基苯磺醯基團、2,4-二甲基苯磺醯基團、2,5-二甲基苯磺醯基團、2,6-二甲基苯磺醯基團、2,4,6-三甲基苯磺醯基團、3,4,5-三甲基苯磺醯基團、2,3,4,5-四乙基苯磺醯基團、五甲基苯磺醯基團、2,4-二甲基 -1-萘磺醯基團、2,3-二甲基 -

(56)

1-萘磺醯基團、3,4-二甲基-1-萘磺醯基團、3,5,7-三乙基-1-萘磺醯基團、3,4,5,7-四甲基-1-萘磺醯基團、2,3,4,5,7-五甲基-1-萘磺醯基團、2,3,4,5,6,7-六乙基-1-萘磺醯基團、及七甲基-1-萘磺醯基團。

羧基低級烷基團之實例包括具 1 至 3 個（最好 1 個）羧基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括羧甲基團、2-羧乙基團、1-羧乙基團、1-羧基-1-甲基乙基團、3-羧丙基團、2,3-二羧基丙基團、4-羧丁基團、3,4-二羧基丁基團、1,1-二甲基-2-羧乙基團、5-羧戊基團、6-羧己基團、3,3-二甲基-3-羧丙基團、2-甲基-3-羧丙基團、及 2,3,4-三羧丁基團。

低級烷氧羰基低級烷基團之實例包括具有 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述烷氧羰基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團）之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括甲氧羰基甲基團、乙氧羰基甲基團、1-甲氧羰基乙基團、2-甲氧羰基乙基團、2-乙氧羰基乙基團、1-乙氧羰基乙基團、3-甲氧羰基丙基團、3-乙氧羰基丙基團、4-乙氧羰基丁基團、5-異丙氧羰基戊基團、6-正丙氧羰基己基團、1,1-二甲基-2-正丁氧羰基乙基團、1-甲基-1-甲氧羰基乙基團、2-甲基-1-甲氧羰基丙基團、2-甲基-3-第三丁氧羰基丙基團、3-甲基-1-甲氧羰基丁基團、二乙氧羰基甲基團、1,2-二乙氧羰基乙基團、2-正丙氧羰基乙基團、

(57)

及正己氧羰基甲基團。

胺基甲醯基低級烷基團（其可具有擇自低級烷基團，苯基團（其可具有低級烷基團）及苯基團（其可具有低級烷氧基團）中之基團以作為取代基）之實例包括具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）胺基甲醯基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。胺基甲醯基部分可具有 1 至 2 個擇自可具有 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）之苯基團及可具有 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述低級烷氧基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）之苯基團中之基團。胺基甲醯基低級烷基團之特定實例包括胺基甲醯基甲基團、二胺基甲醯基甲基團、2-胺基甲醯基乙基團、1-胺基甲醯基乙基團、1-胺基甲醯基-2-甲基丙基團、3-胺基甲醯基丙基團、4-胺基甲醯基丁基團、5-胺基甲醯基戊基團、6-胺基甲醯基己基團、1,1-二甲基-2-胺基甲醯基乙基團、2-甲基-3-胺基甲醯基丙基團、N-甲基胺基甲醯基甲基團、N,N-二甲基胺基甲醯基甲基團、N-甲基-N-乙基胺基甲醯基甲基團、N-甲基胺基甲醯基甲基團、2-（N-甲基胺基甲醯基）乙基團、2-（N-乙基胺基甲醯基）乙基團、N-苯基胺基甲醯基甲基團、N-（2-甲氧基苯基）胺基甲醯基甲基團、及 N-（4-甲苯基）胺基甲醯基甲基團。

羧基低級烯基團之實例包括具有 1 至 3 個，最好 1 個羧基團之如上所述低級烯基團，且順式及反式構型均包括

(58)

在內（最好為具 1 至 3 個雙鍵及 2 至 6 個碳原子之直或支鏈烯基團）。其特定實例包括 2-羧基乙烯基團、3-羧基-2-丙烯基團、4-羧基-2-丁烯基團、4-羧基-3-丁烯基團、4-羧基-1,3-丁二烯基團、5-羧基-1,3,5-己三烯基團、5-羧基-2,4-己二烯基團、5-羧基-3-戊烯基團、及 3-羧基-1-丙烯基團。

低級烷氧羰基低級烯基團之實例包括具有 1 至 3 個如上所述低級烷氧羰基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團）之如上所述低級烯基團（最好為具 1 至 3 個雙鍵及 2 至 6 個碳原子之直或支鏈烯基團），且順式及反式構型均包括在內。低級烷氧羰基低級烯基團之特定實例包括 2-甲氧羰基乙烯基團、2-乙氧羰基乙烯基團、1-乙氧羰基乙烯基團、3-甲氧羰基-2-丙烯基團、3-乙氧羰基-2-丙烯基團、4-乙氧羰基-2-丁烯基團、4-乙氧羰基-1,3-丁二烯基團、5-異丙氧羰基-3-戊烯基團、6-正丙氧羰基-1,3,5-己三烯基團、1,1-二甲基-2-正丁氧羰基乙烯基團、2-甲基-3-第三丁氧羰基-2-丙烯基團、及 2-正戊氧羰基乙烯基團。

胺基甲醯基低級烯基團之實例包括具 1 至 3 個，最好 1 個胺基甲醯基團之如上所述低級烯基團（最好為具 2 至 6 個碳原子及 1 至 3 個雙鍵之直或支鏈烯基團）。其特定實例包括 2-胺基甲醯基乙烯基團、3-胺基甲醯基-2-丙烯基團、4-胺基甲醯基-2-丁烯基團、4-胺基甲醯基-3-丁烯基團、4-胺基甲醯基-1,3-丁二烯基團、5-胺基甲醯基-

(59)

1,3,5-己三烯基團、5-胺基甲醯基-2,4-己二烯基團、5-胺基甲醯基-3-戊烯基團、及3-胺基甲醯基-1-丙烯基團。

胺基甲醯基低級烯基團（其可具有擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團以作為取代基）之實例包括具1至3個，最好1個胺基甲醯基團之如上所述低級烯基團（最好為具1至3個雙鍵及2至6個碳原子之直或支鏈烯基團）且其可於胺基甲醯基團上具有1至2個擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）；及

如上所述經鹵素取代之低級烷基團（最好為具有1至7個，尤其1至3個鹵素原子取代基之具1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）中之取代基。其特定實例包括2-胺基甲醯基乙烯基團、2-（N-甲基胺基甲醯基）乙烯基團、2-（N-乙基胺基甲醯基）乙烯基團、2-（N,N-二甲基胺基甲醯基）乙烯基團、及2-[N-（2,2,2-三氟乙基）胺基甲醯基]乙烯基團。

低級烷氧基低級烷基團之實例包括具有1至3個如上所述低級烷氧基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷氧基團）之如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括甲氧基甲基團、2-甲氧基乙基團、1-乙氧基乙基團、2-乙氧基乙基團、2-異丁氧基乙基團、2,2-二甲氧基乙基團、2-甲氧基-1-甲基乙基團、2-甲氧基-1-乙基乙基團、3-甲氧基丙基團、3-乙氧基丙基團、2-異丙氧基乙基團、3-異丙氧基丙

(60)

基團、3-正丁氧基丙基團、4-正丙氧基丁基團、1-甲基-3-異丁氧基丙基團、1,1-二甲基-2-正戊氧基乙基團、5-正己氧基戊基團、6-甲氧基己基團、1-乙氧基異丙基團、及2-甲基-3-甲氧基丙基團。

芳氧基低級烷基團之實例包括具有1至3個，最好1個芳氧基團之如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）且彼之芳基部分為苯基、聯苯基及萘基等。供芳基團用之取代基實例包括如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團），如上所述鹵素原子，及胺基團。一至七個取代基以這些當中之至少一種型式存在於芳基環上。芳氧基低級烷基團之特定實例包括苯氧基甲基團、2-苯氧基乙基團、2-[(1-或2-)萘氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)甲基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)乙基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)正丙基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)正丁基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)正戊基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)正己基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)異丁基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或4-)第三丁基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或8-)甲基-1-萘氧基]乙基團、2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或8-)甲基-2-萘氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或8-)乙基-1-萘氧基]乙基團、2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或8-)乙基-2-萘氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或8-)正丙

(61)

基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丙基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丁基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正丁基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正戊基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正戊基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正己基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 正己基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 異丁基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 異丁基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 第三丁基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 第三丁基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 氟基苯氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 氟基苯氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 溴基苯氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 溴基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 溴基 -2-萘氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 胺基苯氧基]乙基團、2-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 胺基 -1-萘氧基]乙基團、2-[ ( 1- ,



(62)

3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 胺基 -2-萘氧基 ]乙基團、2-  
 ( 2,3-二甲基苯氧基 ) 乙基團、2- ( 3,4-二甲基苯氧基 )  
 乙基團、2- ( 2,4-二甲基苯氧基 ) 乙基團、2- ( 2,5-二甲基  
 苯氧基 ) 乙基團、2- ( 2,6-二甲基苯氧基 ) 乙基團、2-  
 ( 2,4,6-三甲基苯氧基 ) 乙基團、2- ( 3,4,5-三甲基苯氧  
 基 ) 乙基團、2- ( 2,3,4,5-四乙基苯氧基 ) 乙基團、2- ( 五  
 甲基苯氧基 ) 乙基團、2- ( 2,4-二甲基 -1-萘氧基 ) 乙基  
 團、2- ( 2,3-二甲基 -1-萘氧基 ) 乙基團、2- ( 3,4-二甲基 -  
 1-萘氧基 ) 乙基團、2- ( 3,5,7-三乙基 -1-萘氧基 ) 乙基  
 團、2- ( 3,4,5,7-四甲基 -1-萘氧基 ) 乙基團、2-  
 ( 2,3,4,5,7-五甲基 -1-萘氧基 ) 乙基團、2- ( 2,3,4,5,6,7-  
 六乙基 -1-萘氧基 ) 乙基團、2- ( 七甲基 -1-萘氧基 ) 乙基  
 團、2- ( 2,3-二胺基苯氧基 ) 乙基團、2- ( 2,4,6-三胺基苯  
 氧基 ) 乙基團、2- ( 2-甲基 -5-氟基 -1-萘基 ) 乙基團、3-苯  
 氧基丙基團、2,3-二苯氧基丙基團、4-苯氧基丁基團、  
 3,4-二苯氧基丁基團、1,1-二甲基 -2-苯氧基乙基團、5-苯  
 氧基戊基團、6-苯氧基己基團、3,3-二甲基 -3-苯氧基丙基  
 團、2-甲基 -3-苯氧基丙基團、2,3,4-三苯氧基丁基團、3-  
 [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]丙基團、2,3-二 [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]  
 丙基團、4- [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]丁基團、3,4-二 [ ( 1-或 2-  
 ) 萘氧基 ]丁基團、1,1-二甲基 -2- [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]乙基  
 團、5- [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]戊基團、6- [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]  
 己基團、3,3-二甲基 -3- [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]丙基團、2-甲  
 基 -3- [ ( 1-或 2- ) 萘氧基 ]丙基團、及 2,3,4-三 [ ( 1-或 2- )

(63)

萘氧基]丁基團。

胺基低級烷基團（其可具有擇自低級烷基團、低級烷醯基團、芳醯基團及胺基甲醯基團中之基團）之實例包括

具 1 至 5 個（最好 1 個）胺基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）且其可具有 1 至 2 個擇自如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）、如上所述低級烷醯基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團）、如上所述芳醯基團（最好為苯甲醯基團）及胺基甲醯基團中之基團。胺基低級烷基團之特定實例包括胺基甲基團、2-胺基乙基團、1-胺基乙基團、3-胺基丙基團、4-胺基丁基團、5-胺基戊基團、6-胺基己基團、1,1-二甲基-2-胺基乙基團、2-甲基-3-胺基丙基團、N,N-二甲胺基甲基團、N-甲基-N-乙胺基甲基團、N-甲胺基甲基團、2-（N-甲胺基）乙基團、1-甲基-2-（N,N-二甲胺基）乙基團、1-甲基-2-（N,N-二乙胺基）乙基團、2-（N,N-二甲胺基）乙基團、2-（N,N-二乙胺基）乙基團、2-（N,N-二異丙胺基）乙基團、3-（N,N-二甲胺基）丙基團、3-（N,N-二乙胺基）丙基團、2-（N-乙醯胺基）乙基團、2-（N-甲基-N-乙醯胺基）乙基團、2-（N-甲基-N-正丁醯胺基）乙基團、2-（N-甲基-N-苯甲醯基胺基）乙基團、及 2-（N-胺基甲醯基胺基）乙基團。

環 C3-C8 烷基團之實例包括環丙基團、環丁基團、環戊基團、環己基團、環庚基團、及環辛基團。

(64)

環 C3-C8 烷基團（其可具有擇自低級烷基團、羥基團、低級烷氧羰基團及苯基低級烷氧基團中之基團以作為取代基）之實例包括環 C3-C8 烷基團，其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

羥基團；

如上所述低級烷氧羰基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團）；及

具 1 至 3 個（最好 1 個）苯基團之如上所述低級烷氧基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）

中之基團以作為取代基。其特定實例包括環丙基團、環丁基團、環戊基團、環己基團、環庚基團、環辛基團、1-甲基環丙基團、1-甲基環戊基團、1-甲基環己基團、2-甲基環己基團、4-羥基環己基團、4-甲氧羰基環己基團、2-苄氧基戊基團、及 2-苄氧基己基團。

經環 C3-C8 烷基取代之低級烷基團之實例包括具有 1 至 3 個，最好 1 個如上所述環 C3-C8 烷基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括環丙基甲基團、環己基甲基團、2-環丙基乙基團、1-環丁基乙基團、環戊基甲基團、3-環戊基丙基團、4-環己基丁基團、5-環庚基戊基團、6-環辛基己基團、1,1-二甲基-2-環己基乙基團、及 2-甲基-3-環丙基丙基團。

(65)

呋喃基低級烷基團（其可於呋喃基團上具有低級烷基團取代基）之實例包括具有 1 至 2 個（最好 1 個）呋喃基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）且呋喃基團上可存在 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基。其特定實例包括 [（2-或 3-）呋喃基]甲基團、2-[（2-或 3-）呋喃基]乙基團、1-[（2-或 3-）呋喃基]乙基團、3-[（2-或 3-）呋喃基]丙基團、4-[（2-或 3-）呋喃基]丁基團、5-[（2-或 3-）呋喃基]戊基團、6-[（2-或 3-）呋喃基]己基團、1,1-二甲基-2-[（2-或 3-）呋喃基]乙基團、2-甲基-3-[（2-或 3-）呋喃基]丙基團、[5-乙基-（2-，3-，或 4-）呋喃基]甲基團、[5-甲基-（2-，3-，或 4-）呋喃基]甲基團、[2-正丙基-（3-，4-，或 5-）呋喃基]甲基團、[3-第三丁基-（2-，4-，或 5-）呋喃基]甲基團、[4-正戊基-（2-，3-，或 5-）呋喃基]甲基團、[2-正己基-（3-，4-，或 5-）呋喃基]甲基團、[2,5-二甲基-（3-或 4-）呋喃基]甲基團、[2,5-二乙基-（3-或 4-）呋喃基]甲基團、及[2,4,5-三乙基-3-呋喃基]甲基團。

四氫呋喃基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個（最好 1 個）四氫呋喃基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括（2-或 3-）（2,3,4,5-四氫呋喃基）甲基團、2-[（2-或 3-）（2,3,4,5-四氫呋喃基）]乙基團、1-[（2-或 3-）

(66)

( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]乙基團、3-[ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]丙基團、2,3-二 [ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]丙基團、4-[ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]丁基團、3,4-二 [ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]丁基團、1,1-二甲基-2-[ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]乙基團、5-[ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]戊基團、6-[ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]己基團、3,3-二甲基-3-[ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]丙基團、2-甲基-3-[ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]丙基團、及 2,3,4-三 [ ( 2-或 3- )  
 ( 2,3,4,5-四氫呋喃基 ) ]丁基團。

1,3-二噁茂烷基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個  
 ( 最好 1 個 ) 1,3-二噁茂烷基團之如上所述低級烷基團  
 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 。其特  
 定實例包括 [ ( 2-或 4- ) 1,3-二噁茂烷基 ]甲基團、2-[ ( 2-  
 或 4- ) 1,3-二噁茂烷基 ]乙基團、1-[ ( 2-或 4- ) 1,3-二噁茂  
 烷基 ]乙基團、3-[ ( 2-或 4- ) 1,3-二噁茂烷基 ]丙基團、4-  
 [ ( 2-或 4- ) 1,3-二噁茂烷基 ]丁基團、1,1-二甲基-2-[ ( 2-  
 或 4- ) 1,3-二噁茂烷基 ]乙基團、5-[ ( 2-或 4- ) 1,3-二噁茂  
 烷基 ]戊基團、6-[ ( 2-或 4- ) 1,3-二噁茂烷基 ]己基團、1-  
 [ ( 2-或 4- ) 1,3-二噁茂烷基 ]異丙基團、及 2-甲基-3-[ ( 1-  
 , 2- , 或 4- ) 咪唑基 ]丙基團。

四氫呋喃基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個 ( 最  
 好 1 個 ) 四氫呋喃基團之如上所述低級烷基團 ( 最好為具

(67)

有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括 [ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 甲基團、2-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 乙基團、1-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 乙基團、3-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 丙基團、4-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 丁基團、1,1-二甲基-2-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 乙基團、5-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 戊基團、6-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 己基團、1-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 異丙基團、及 2-甲基-3-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 四氫呋喃基 ] 丙基團。

吡咯基低級烷基團 ( 其可於吡咯基團上具有低級烷基團取代基 ) 之實例包括具有 1 至 2 個 ( 最好 1 個 ) 吡咯基團之如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 且吡咯基團上可存在 1 至 3 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 以作為取代基。其特定實例包括 [ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 甲基團、2- ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 乙基團、1-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 乙基團、3-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 丙基團、4-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 丁基團、1,1-二甲基-2-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 乙基團、5-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 戊基團、6-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 己基團、1-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 異丙基團、2-甲基-3-[ ( 1- , 2-或 3- ) 吡咯基 ] 丙基團、[1-甲基- ( 2-或 3- ) 吡咯基 ] 甲基團、[1-乙基- ( 2-或 3- ) 吡咯基 ] 甲基團、[1-正丙基- ( 2-或 3- ) 吡咯基 ] 甲基團、[1-正丁基- ( 2-或 3- )

(68)

吡咯基]甲基團、[1-正戊基-(2-或3-)吡咯基]甲基團、[1-正己基-(2-或3-)吡咯基]甲基團、2-[5-甲基-(1-, 2-, 3-, 或4-)吡咯基]乙基團、1-[1-乙基-(2-或3-)吡咯基]乙基團、3-[1-乙基-(2-或3-)吡咯基]丙基團、4-[1-正丙基-(2-或3-)吡咯基]丁基團、5-[1-正丁基-(2-或3-)吡咯基]戊基團、6-[1-正戊基-(2-或3-)吡咯基]己基團、[1,5-二甲基-(2-, 3-, 或4-)吡咯基]甲基團、[1,3,5-三甲基-2-吡咯基]甲基團, 及[1,2,4-三甲基-3-吡咯基]甲基團。

經二氫吡啶基團取代之低級烷基團(其可具有酮基團)之實例包括具有2,3-二氫吡啶基團或4,5-二氫吡啶基團以作為二氫吡啶基團且可於其上具有酮基團之如上所述低級烷基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括3-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基甲基團、2-[4-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]乙基團、1-[5-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]乙基團、3-[3-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]丙基團、4-[4-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]丁基團、5-[1-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]戊基團、6-[5-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]己基團、2-甲基-3-[1-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]丙基團、1,1-二甲基-2-[3-(2,3-或4,5-)二氫吡啶基]乙基團、5-酮基-4-(4,5-二氫吡啶基)甲基團、2-[5-酮基-4-(4,5-二氫吡啶基)]乙基團、及3-[5-酮基-4-(4,5-二氫吡啶基)]丙基團。

吡啶基低級烷基團(其可於吡啶基團上具有低級烷基

(69)

團取代基)之實例包括具有 1 至 2 個(最好 1 個)吡啶基團之如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)且吡啶喃基團上可存在 1 至 3 個(最好 1 至 2 個)如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)以作為取代基。其特定實例包括 3-吡啶基甲基團、2-(4-吡啶基)乙基團、2-(1-吡啶基)乙基團、1-(5-吡啶基)乙基團、3-(3-吡啶基)丙基團、4-(4-吡啶基)丁基團、5-(1-吡啶基)戊基團、6-(5-吡啶基)己基團、2-甲基-3-(1-吡啶基)丙基團、1,1-二甲基-2-(3-吡啶基)乙基團、1-甲基-3-吡啶基甲基團、1-乙基-3-吡啶基甲基團、1-正丙基-3-吡啶基甲基團、1-正丁基-3-吡啶基甲基團、1-正戊基-3-吡啶基甲基團、1-甲基-4-吡啶基甲基團、5-甲基-3-吡啶基甲基團、1-乙基-4-吡啶基甲基團、1-正丙基-4-吡啶基甲基團、1-正丁基-4-吡啶基甲基團、1-正己基-4-吡啶基甲基團、3-甲基-1-吡啶基甲基團、3-乙基-1-吡啶基甲基團、3-正丙基-1-吡啶基甲基團、3-正丁基-1-吡啶基甲基團、1,5-二甲基-3-吡啶基甲基團、3,5-二甲基-4-吡啶基甲基團、3,4-二甲基-1-吡啶基甲基團、1,3-二甲基-5-吡啶基甲基團、3,4-二乙基-1-吡啶基甲基團、3,4-二正丙基-1-吡啶基甲基團、3,4-二正丁基-1-吡啶基甲基團、1,3,5-三甲基-4-吡啶基甲基團、3,4,5-三甲基-1-吡啶基甲基團、3,4,5-三乙基-1-吡啶基甲基團、3,4,5-三正丙基-1-吡啶基甲基團、3,4,5-三正丁基-1-吡啶基甲基團、1-甲基-5-吡啶基甲基團、1-乙



(70)

基-5-吡啶基甲基團、1-正丙基-5-吡啶基甲基團、1-正丁基-5-吡啶基甲基團、2-(3-吡啶基)乙基團、3-(3-吡啶基)丙基團、4-(3-吡啶基)丁基團、5-(3-吡啶基)戊基團、6-(3-吡啶基)己基團、2-(1-(4-氯苯基)-3-吡啶基)乙基團、3-(1-甲基-3-吡啶基)丙基團、3-(3-甲基-4-吡啶基)丙基團、3-(5-甲基-4-吡啶基)丙基團、3-(1,5-二甲基-3-吡啶基)丙基團、3-(1-乙基-3-吡啶基)丙基團、3-(1-正丙基-3-吡啶基)丙基團、3-(1-正丁基-3-吡啶基)丙基團、4-(1-甲基-3-吡啶基)丁基團、4-(1-乙基-3-吡啶基)丁基團、4-(1-正丙基-3-吡啶基)丁基團、4-(1-正丁基-3-吡啶基)丁基團、5-(1-甲基-3-吡啶基)戊基團、5-(1-乙基-3-吡啶基)戊基團、5-(1-正丙基-3-吡啶基)戊基團、5-(1-正丁基-3-吡啶基)戊基團、6-(1-甲基-3-吡啶基)己基團、6-(1-乙基-3-吡啶基)己基團、6-(1-正丙基-3-吡啶基)己基團、及 6-[1-(3-丁基)-3-吡啶基]己基團。

咪啞基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個（最好 1 個）咪啞基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括[(1-, 2-, 4-, 或 5-)咪啞基]甲基團、2-[(1-, 2-, 4-, 或 5-)咪啞基]乙基團、1-[(1-, 2-, 4-, 或 5-)咪啞基]乙基團、3-[(1-, 2-, 4-, 或 5-)咪啞基]丙基團、4-[(1-, 2-, 4-, 或 5-)咪啞基]丁基團、1,1-二甲基-2-[(1-, 2-, 4-, 或 5-)咪啞基]乙基團、5-[(1-, 2-, 4-, 或 5-)

(71)

咪唑基]戊基團、6-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]己基團、1-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]異丙基團、及 2-甲基-3-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]丙基團。

吡啶基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個（最好 1 個）吡啶基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括（2-, -3-, 或 4-）吡啶基甲基團、2-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]甲基團、1-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]乙基團、3-[(2-, -3-, 或 4-) 吡啶基]丙基團、4-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]丁基團、1,1-二甲基-2-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]乙基團、5-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]戊基團、6-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]己基團、1-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]異丙基團、及 2-甲基-3-[(2-, 3-, 或 4-) 吡啶基]丙基團。

吡嗪基低級烷基團（吡嗪基團上可存在低級烷基團以作為取代基）之實例包括具有 1 至 2 個（最好 1 個）吡嗪基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）且吡嗪喃基團上可存在 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基。其特定實例包括 2-吡嗪基甲基團、2-(2-吡嗪基)乙基團、1-(2-吡嗪基)乙基團、3-(2-吡嗪基)丙基團、4-(2-吡嗪基)丁基團、5-(2-吡嗪基)戊基團、6-(2-吡嗪基)己基團、3-甲基-3-(2-吡嗪基)丙基團、1,1-二甲基-2-(2-吡嗪基)乙基團、3-甲基-2-吡嗪基甲基團、3-乙基-2-吡嗪基甲基

(72)

團、3-正丙基-2-吡嗪基甲基團、3-正丁基-2-吡嗪基甲基團、3-正戊基-2-吡嗪基甲基團、5-甲基-2-吡嗪基甲基團、5-乙基-2-吡嗪基甲基團、5-正丙基-2-吡嗪基甲基團、3-正丁基-2-吡嗪基甲基團、6-甲基-2-吡嗪基甲基團、6-乙基-2-吡嗪基甲基團、6-正丙基-2-吡嗪基甲基團、6-正丁基-2-吡嗪基甲基團、3,5-二甲基-2-吡嗪基甲基團、3,5-二乙基-2-吡嗪基甲基團、3,5-二正丙基-2-吡嗪基甲基團、3,5-二正丁基-2-吡嗪基甲基團、2-(5-甲基-2-吡嗪基)乙基團、2-(5-乙基-2-吡嗪基)乙基團、2-(5-正丙基-2-吡嗪基)乙基團、2-(5-正丁基-2-吡嗪基)乙基團、3-(5-甲基-2-吡嗪基)丙基團、3-(5-乙基-2-吡嗪基)丙基團、3-(5-正丙基-2-吡嗪基)丙基團、3-(5-正丁基-2-吡嗪基)丙基團、4-(5-甲基-2-吡嗪基)丁基團、4-(5-乙基-2-吡嗪基)丁基團、4-(5-正丙基-2-吡嗪基)丁基團、4-(5-正丁基-2-吡嗪基)丁基團、5-(5-甲基-2-吡嗪基)戊基團、5-(5-乙基-2-吡嗪基)戊基團、5-(5-正丙基-2-吡嗪基)戊基團、5-(5-正丁基-2-吡嗪基)戊基團、6-(5-甲基-2-吡嗪基)己基團、6-(5-乙基-2-吡嗪基)己基團、6-(5-正丙基-2-吡嗪基)己基團、及 6-(5-正丁基-2-吡嗪基)己基團。

吡咯啉基低級烷基團（吡咯啉基團上可存在擇自酮基團及低級烷基團中之基團以作為取代基）之實例包括具有 1 至 2 個（最好 1 個）吡咯啉基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）且吡咯

(73)

啖基團上可存在 1 至 3 個（最好 1 個）擇自酮基團及如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）中之基團以作為取代基。其特定實例包括 [（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 甲基團、2-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 乙基團、1-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 乙基團、3-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 丙基團、4-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 丁基團、5-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 戊基團、6-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 己基團、1-甲基-2-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 乙基團、1,1-二甲基-2-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 乙基團、2-甲基-3-[（1-，2-，或 3-）吡咯啖基] 丙基團、1-甲基-（2-，或 3-）吡咯啖基甲基團、1-乙基-（2-，或 3-）吡咯啖基甲基團、1-正丙基-（2-，或 3-）吡咯啖基甲基團、1-正丁基-（2-，或 3-）吡咯啖基甲基團、1-正戊基-（2-，或 3-）吡咯啖基甲基團、1-正己基-（2-，或 3-）吡咯啖基甲基團、2-甲基-1-吡咯啖基甲基團、2-乙基-1-吡咯啖基甲基團、2-正丙基-1-吡咯啖基甲基團、2-正丁基-1-吡咯啖基甲基團、2-正戊基-1-吡咯啖基甲基團、2-正己基-1-吡咯啖基甲基團、3-甲基-2-吡咯啖基甲基團、3-乙基-2-吡咯啖基甲基團、3-正丙基-2-吡咯啖基甲基團、3-正丁基-2-吡咯啖基甲基團、1,5-二甲基-（2-或 3-）吡咯啖基甲基團、1,5-二乙基-（2-或 3-）吡咯啖基甲基團、1,5-二正丙基-（2-或 3-）吡咯啖基甲基團、1,5-二正丁基-（2-或 3-）吡咯啖基甲基團、1,4,5-三乙基-（2-或 3-）吡咯啖基甲基團、1,4,5-三

(74)

正丙基 - ( 2- 或 3- ) 吡咯啉基甲基團、1,4,5-三正丁基 - ( 2- 或 3- ) 吡咯啉基甲基團、3-[2-酮基 - ( 1-吡咯啉基 ) 丙基]團、3-[5-酮基 - ( 2- , 3- , 或 4 ) 吡咯啉基]丙基團、及 3-[1-甲基 -5-酮基 - ( 2- , 3- , 或 4 ) 吡咯啉基]丙基團。

六氫吡啉基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啉基團上具有擇自苯甲醯基團及低級烷醯基團中之基團以作為取代基 ) 之實例包括具有 1 至 2 個 ( 最好 1 個 ) 六氫吡啉基團之如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 且六氫吡啉基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自苯甲醯基團及如上所述低級烷醯基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團 ) 中之基團以作為取代基。其特定實例包括 ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基甲基團、2-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]乙基團、2-[1-苯甲醯 - ( 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]乙基團、2-[1-乙醯 - ( 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]乙基團、2-[1-丁醯 - ( 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]乙基團、1-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]乙基團、3-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]丙基團、4-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]丁基團、1,1-二甲基-2-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]乙基團、5-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]戊基團、6-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]己基團、1-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]異丙基團、及 2-甲基-3-[ ( 1- , 2- , 3- , 或 4- ) 六氫吡啉基]丙基團。

六氫吡啉基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啉基團上具有

(75)

低級烷基團以作為取代基)之實例包括具有 1 至 2 個(最好 1 個)六氫吡啶基團之如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)且六氫吡啶基團上可存在 1 至 3 個(最好 1 個)如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)以作為取代基。其特定實例包括 1-六氫吡啶基甲基團、2-六氫吡啶基甲基團、2-(1-六氫吡啶基)乙基團、2-(2-六氫吡啶基)乙基團、1-(1-六氫吡啶基)乙基團、1-(2-六氫吡啶基)乙基團、3-(1-六氫吡啶基)丙基團、3-(2-六氫吡啶基)丙基團、4-(1-六氫吡啶基)丁基團、4-(2-六氫吡啶基)丁基團、2-(4-乙基-2-六氫吡啶基)乙基團、1-(4-正丙基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(4-正丁基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(4-正戊基-2-六氫吡啶基)乙基團、1-(4-正己基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(5-甲基-2-六氫吡啶基)乙基團、1-(5-乙基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(5-正丙基-2-六氫吡啶基)乙基團、1-(5-正丁基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(5-正戊基-2-六氫吡啶基)乙基團、1-(5-正己基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(6-甲基-2-六氫吡啶基)乙基團、1-(6-乙基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(6-正丙基-2-六氫吡啶基)乙基團、1-(6-正丁基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(6-正戊基-2-六氫吡啶基)乙基團、2-(6-正己基-2-六氫吡啶基)乙基團、3-(2-甲基-1-六氫吡啶基)丙基團、3-(2-乙基-1-六氫吡啶基)丙基團、3-(2-正丙基-1-六氫吡啶基)丙基團、3-(2-正丁基-

(76)

1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(2-正戊基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(2-正己基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(3-甲基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(3-乙基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(3-正丙基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(3-正丁基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(3-正戊基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(3-正己基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(4-甲基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(4-乙基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(4-正丙基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(4-正丁基-1-六氫吡咩基) 丙基團、3-(4-正戊基-1-六氫吡咩基) 丙基團、6-(5-正丁基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(5-正戊基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(5-正己基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(6-甲基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(6-乙基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(6-正丙基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(6-正丁基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(6-正戊基-2-六氫吡咩基) 己基團、6-(6-正己基-2-六氫吡咩基) 己基團、2,3-二甲基-1-六氫吡咩基甲基團、3,3-二甲基-1-六氫吡咩基甲基團、及 2-(1,3,4-三甲基-2-六氫吡咩基) 乙基團。

嗎啉基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個(最好 1 個)嗎啉基團之如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括 2-嗎啉基甲基團、3-嗎啉基甲基團、4-嗎啉基甲基團、2-(2-嗎啉基) 乙基團、2-(3-嗎啉基) 乙基團、2-(4-嗎啉基) 乙基團、1-(2-嗎啉基) 乙基團、1-(3-嗎啉基) 乙基團、

(77)

1- ( 4-嗎啉基 ) 乙基團、3- ( 2-嗎啉基 ) 丙基團、3- ( 3-嗎啉基 ) 丙基團、3- ( 4-嗎啉基 ) 丙基團、4- ( 2-嗎啉基 ) 丁基團、4- ( 3-嗎啉基 ) 丁基團、4- ( 4-嗎啉基 ) 丁基團、5- ( 2-嗎啉基 ) 戊基團、5- ( 3-嗎啉基 ) 戊基團、5- ( 4-嗎啉基 ) 戊基團、6- ( 2-嗎啉基 ) 己基團、6- ( 3-嗎啉基 ) 己基團、6- ( 4-嗎啉基 ) 己基團、3-甲基-3- ( 2-嗎啉基 ) 丙基團、3-甲基-3- ( 3-嗎啉基 ) 丙基團、3-甲基-3- ( 4-嗎啉基 ) 丙基團、1,1-二甲基-2- ( 2-嗎啉基 ) 乙基團、1,1-二甲基-2- ( 3-嗎啉基 ) 乙基團、及 1,1-二甲基-2- ( 4-嗎啉基 ) 乙基團。

噻吩基低級烷基團 ( 其可於噻吩基團上具有低級烷基團以作為取代基 ) 之實例包括具有 1 至 2 個 ( 最好 1 個 ) 噻吩基團之如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 且噻吩基團上可存在 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 以作為取代基。其特定實例包括 ( 2-或 3-) 噻吩基甲基團、2- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 乙基團、1- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 乙基團、3- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 丙基團、4- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 丁基團、5- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 戊基團、6- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 己基團、1,1-二甲基-2- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 乙基團、2-甲基-3- [ ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 丙基團、3-甲基- ( 2-, 4-, 或 5-) 噻吩基甲基團、[ 5-甲基- ( 2-, 3-, 或 4-) 噻吩基 ] 甲基團、[ 4-乙基- ( 2-或 3-) 噻吩基 ] 甲基團、[ 5-正丙基- ( 2-, 3-或 4-) 噻吩基 ] 甲



(78)

基團、[3-正丁基-(2-, 4-, 或 5-)噻吩基]甲基團、[4,5-二甲基-(2-或 3-)噻吩基]甲基團、(3,4,5-三甲基-2-噻吩基)甲基團、2-[3-甲基-(2-, 4-, 或 5-)噻吩基]乙基團、1-[4-正戊基-(2-或 3-)噻吩基]乙基團、3-[3-己基-2-噻吩基]丙基團、4-[4,5-二甲基-(2-或 3-)噻吩基]丁基團、5-(2,4,5-三甲基-3-噻吩基)戊基團、及 6-[5-乙基-(2-, 3-或 4-)噻吩基]己基團。

噻唑基團之實例包括(2-, 4-, 或 5-)噻唑基團。

噻唑基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個(最好 1 個)噻唑基團之如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括(2-, 4-, 或 5-)噻唑基甲基團、2-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]乙基團、1-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]乙基團、3-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]丙基團、4-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]丁基團、5-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]戊基團、6-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]己基團、1,1-二甲基-2-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]乙基團、及[2-甲基-3-[(2-, 4-, 或 5-)噻唑基]丙基團。

二氫苯並呋喃基團之實例包括 2,3-二氫-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-或 7-)苯並呋喃基團。

二氫苯並呋喃基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個(最好 1 個)二氫苯並呋喃基團之如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括 2,3-二氫-4-苯並呋喃基甲基團、2-(2,3-二氫-

(79)

4-苯並呋喃基) 乙基團、3-(2,3-二氫-4-苯並呋喃基) 丙基團、4-(2,3-二氫-4-苯並呋喃基) 丁基團、5-(2,3-二氫-4-苯並呋喃基) 戊基團、6-(2,3-二氫-4-苯並呋喃基) 己基團、2,3-二氫-5-苯並呋喃基甲基團、2-(2,3-二氫-5-苯並呋喃基) 乙基團、3-(2,3-二氫-5-苯並呋喃基) 丙基團、4-(2,3-二氫-5-苯並呋喃基) 丁基團、2,3-二氫-6-苯並呋喃基甲基團、2-(2,3-二氫-6-苯並呋喃基) 乙基團、3-(2,3-二氫-6-苯並呋喃基) 丙基團、4-(2,3-二氫-6-苯並呋喃基) 丁基團、5-(2,3-二氫-6-苯並呋喃基) 戊基團、2,3-二氫-7-苯並呋喃基甲基團、2,3-二氫-7-苯並呋喃基乙基團、3-(2,3-二氫-7-苯並呋喃基) 丙基團、4-(2,3-二氫-7-苯並呋喃基) 丁基團、及 6-(2,3-二氫-7-苯並呋喃基) 己基團。

苯並呋喃基低級烷基團(其可於苯並呋喃基團上具有酮基團以作為取代基)之實例包括具有 1 至 2 個(最好 1 個)苯並呋喃基團之如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)且苯並呋喃基團上可存在酮基團以作為取代基。其特定實例包括(4H-1-苯並呋喃-2-基)甲基團、2-(4H-1-苯並呋喃-2-基)乙基團、3-(4H-1-苯並呋喃-2-基)丙基團、4-(4H-1-苯並呋喃-2-基)丁基團、5-(4H-1-苯並呋喃-2-基)戊基團、6-(4H-1-苯並呋喃-2-基)己基團、(4H-1-苯並呋喃-3-基)甲基團、2-(4H-1-苯並呋喃-3-基)乙基團、3-(4H-1-苯並呋喃-3-基)丙基團、4-(4H-1-苯並呋喃-3-基)丁基團、5-



(81)

喃 -4-基 ) 甲基團、2- ( 1H-2-苯並哌喃 -4-基 ) 乙基團、3-  
 ( 1H-2-苯並哌喃 -4-基 ) 丙基團、4- ( 1H-2-苯並哌喃 -4-  
 基 ) 丁基團、5- ( 4H-1-苯並哌喃 -4-基 ) 戊基團、6- ( 1H-  
 2-苯並哌喃 -4-基 ) 己基團、( 4-酮基 -4H-1-苯並哌喃 -2-  
 基 ) 甲基團、2- ( 4-酮基 -4H-1-苯並哌喃 -2-基 ) 乙基團、  
 3- ( 4-酮基 -4H-1-苯並哌喃 -2-基 ) 丙基團、4- ( 4-酮基 -  
 4H-1-苯並哌喃 -2-基 ) 丁基團、5- ( 4-酮基 -4H-1-苯並哌  
 喃 -2-基 ) 戊基團、6- ( 4-酮基 -4H-1-苯並哌喃 -2-基 ) 己基  
 團、( 4-酮基 -4H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 甲基團、2- ( 4-酮基 -  
 4H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 乙基團、3- ( 4-酮基 -4H-1-苯並哌  
 喃 -3-基 ) 丙基團、4- ( 4-酮基 -4H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 丁基  
 團、5- ( 4-酮基 -4H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 戊基團、6- ( 4-酮  
 基 -4H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 己基團、( 4-酮基 -4H-1-苯並哌  
 喃 -4-基 ) 甲基團、( 2-酮基 -2H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 甲基  
 團、2- ( 2-酮基 -2H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 乙基團、3- ( 2-酮  
 基 -2H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 丙基團、4- ( 2-酮基 -2H-1-苯並  
 哌喃 -3-基 ) 丁基團、5- ( 2-酮基 -2H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 戊  
 基團、6- ( 2-酮基 -2H-1-苯並哌喃 -3-基 ) 己基團、( 2-酮  
 基 -2H-1-苯並哌喃 -4-基 ) 甲基團、2- ( 2-酮基 -2H-1-苯並  
 哌喃 -4-基 ) 乙基團、3- ( 2-酮基 -2H-1-苯並哌喃 -4-基 ) 丙  
 基團、4- ( 2-酮基 -2H-1-苯並哌喃 -4-基 ) 丁基團、5- ( 2-  
 酮基 -2H-1-苯並哌喃 -4-基 ) 戊基團、6- ( 2-酮基 -2H-1-苯  
 並哌喃 -4-基 ) 己基團、( 1-酮基 -1H-2-苯並哌喃 -3-基 ) 甲  
 基團、2- ( 1-酮基 -1H-2-苯並哌喃 -3-基 ) 乙基團、3- ( 1-

(82)

酮基 -1H-2-苯並呋喃 -3-基 ) 丙基團、4- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -3-基 ) 丁基團、5- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -3-基 ) 戊基團、6- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -3-基 ) 己基團、( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -4-基 ) 甲基團、2- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -4-基 ) 乙基團、3- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -4-基 ) 丙基團、4- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -4-基 ) 丁基團、5- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -4-基 ) 戊基團、及 6- ( 1-酮基 -1H-2-苯並呋喃 -4-基 ) 己基團。

苯並咪唑基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個 ( 最好 1 個 ) 苯並咪唑基團之如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 。其特定實例包括 1-苯並咪唑基甲基團、2- ( 1-苯並咪唑基 ) 乙基團、3- ( 1-苯並咪唑基 ) 丙基團、4- ( 1-苯並咪唑基 ) 丁基團、5- ( 1-苯並咪唑基 ) 戊基團、6- ( 1-苯並咪唑基 ) 己基團、2-苯並咪唑基甲基團、2- ( 2-苯並咪唑基 ) 乙基團、3- ( 2-苯並咪唑基 ) 丙基團、4- ( 2-苯並咪唑基 ) 丁基團、5- ( 2-苯並咪唑基 ) 戊基團、及 6- ( 2-苯並咪唑基 ) 己基團。

吡啶基低級烷基團 ( 其可於低級烷基團上具有低級烷氧羰基團 ) 之實例包括可具有 1 至 2 個 ( 最好 1 個 ) 吡啶基團之如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 且低級烷基團上可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 如上所述低級烷氧羰基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團 ) 。其特定實例包括吡啶

(83)

(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基甲基團、2-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基乙基團、3-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基丙基團、4-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基丁基團、5-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基戊基團、6-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基己基團、3-甲基-3-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基丙基團、1,1-二甲基-2-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基乙基團、及 1-甲氧羰基-2-吡啶(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, 或 -7-) 基乙基團。

咪唑基低級烷基團（其於低級烷基團上具有擇自胺基甲醯基團及低級烷氧羰基團中之取代基）之實例包括咪唑基低級烷基團，其於低級烷基團上具有擇自胺基甲醯基團及如上所述低級烷氧羰基團中之取代基，且彼之低級烷基部分與如上所述者相同，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團。其特定實例包括胺基甲醯基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、甲氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、乙氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、正丁氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、異丁氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、第三丁氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、另丁氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、正戊氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、新戊氧羰基-[(1-, 2-, 4-, 或 5-) 咪唑基]甲基團、正己氧羰

(84)

基 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 甲基團、異己氧羰基 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 甲基團、3-甲基戊氧羰基 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 甲基團、1-胺基甲醯基 - 2 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 乙基團、1-甲氧羰基 - 2 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 乙基團、1,1-二甲氧羰基 - 2 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 乙基團、1,1-二胺基甲醯基 - 2 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 乙基團、2-胺基甲醯基 - 1 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 乙基團、2-甲氧羰基 - 3 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 丙基團、2-胺基甲醯基 - 4 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 丁基團、1-甲基 - 1-胺基甲醯基甲基 - 2 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 乙基團、2-甲氧羰基 - 5 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 戊基團、3-胺基甲醯基 - 6 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 己基團、2-甲氧羰基 - 1 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 異丙基團、及 2-胺基甲醯基甲基 - 3 - [ ( 1 - , 2 - , 4 - , 或 5 - ) 咪唑基 ] 丙基團。

吡啶基團 ( 其可具有擇自低級烷基團、低級烷氧基團、及低級烷硫基低級烷基團中之基團以作為取代基 ) 之實例包括吡啶基團，其可具有 1 至 4 個 ( 最好 1 個 ) 擇自如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 )，如上所述低級烷氧基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團 )，及低級烷硫基低級烷基團 ( 其中之兩個低級烷基部分係由如上所述低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 所組

(85)

成) 中之基團以作為取代基。其特定實例包括 2-吡啶基團、3-吡啶基團、4-吡啶基團、4-甲基-2-吡啶基團、5-甲基-2-吡啶基團、5-乙基-3-吡啶基團、2-正丙基-3-吡啶基團、4-正丁基-2-吡啶基團、4-第三丁基-2-吡啶基團、5-正戊基-3-吡啶基團、4-正己基-2-吡啶基團、4-甲氧基-2-吡啶基團、5-甲氧基-2-吡啶基團、2-甲硫基甲基-3-吡啶基團、5-乙硫基甲基-2-吡啶基團、4-正丙硫基甲基-2-吡啶基團、3-正丁硫基甲基-2-吡啶基團、5-正戊硫基甲基-3-吡啶基團、4-正己硫基甲基-3-吡啶基團、2-(2-甲硫基乙基)-3-吡啶基團、2-(3-甲硫基丙基)-4-吡啶基團、3-(4-甲硫基丁基)-4-吡啶基團、3-(5-甲硫基戊基)-2-吡啶基團、4-(6-甲硫基己基)-2-吡啶基團、3,4-二甲基-2-吡啶基團、2,4,6-三乙基-3-吡啶基團、2,3,5,6-四甲基-4-吡啶基團，及 2-甲基-3-甲硫基甲基-4-吡啶基團。

吡咯啉基團(其可具有擇自低級烷基團，低級烷氧羰基團，低級烷醯基團，及芳醯基團中之基團以作為取代基)之實例為吡咯啉基團，其可具有 1 至 3 個(最好 1 個)擇自如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)，如上所述低級烷氧基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團)，如上所述低級烷醯基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團)，及芳醯基團(最好為苯甲醯基團)中之基團以作為取代基。其特定實例包括吡咯啉-1-基團、吡咯啉-2-基團、吡咯啉-3-基團、2-乙基吡咯啉-3-基團、3-正丙基吡



(86)

咯啉-3-基團、4-正丁基吡咯啉-3-基團、1-第三丁基吡咯啉-3-基團、5-正戊基吡咯啉-3-基團、1-正己基吡咯啉-2-基團、2-甲氧羰基-2-基團、3-乙氧羰基吡咯啉-2-基團、1-第三丁氧羰基吡咯啉-3-基團、4-丙氧羰基吡咯啉-2-基團、5-丁氧羰基吡咯啉-2-基團、1-戊氧羰基-2-基團、2-己氧羰基吡咯啉-2-基團、1,3-二甲氧羰基吡咯啉-2-基團、3,4,5-三乙基吡咯啉-2-基團、2,3,4,5-四甲基吡咯啉-1-基團、2,4-二甲氧羰基吡咯啉-1-基團、3,4,5-三乙氧羰基吡咯啉-1-基團、2-甲基-4-甲氧羰基吡咯啉-1-基團、1-苯甲醯基吡咯啉-3-基團、1-乙醯基吡咯啉-3-基團、及 1-丁醯基吡咯啉-3-基團。

六氫吡啶基團（其可具有擇自低級烷基基團，低級烷氧羰基基團，低級烷醯基基團，及芳醯基基團中之基團以作為取代基）之實例為六氫吡啶基團，其可具有 1 至 5 個（最好 1 至 4 個）擇自如上所述低級烷基基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基基團）；

如上所述低級烷氧基基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基基團）；

如上所述低級烷醯基基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基基團）；

及芳醯基基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自如上所述低級烷基基團及如上所述鹵素原子中之基團，最好為苯甲醯基基團）中之基團以作為取代基。

其特定實例包括 1-六氫吡啶基團、2-六氫吡啶基團、

(87)

3-六氫吡啶基團、4-六氫吡啶基團、1-甲基-4-六氫吡啶基團、2-乙基-4-六氫吡啶基團、3-正丙基-4-六氫吡啶基團、4-正丁基-4-六氫吡啶基團、1-正戊基-4-六氫吡啶基團、2-正己基-4-六氫吡啶基團、1-甲氧羰基-4-六氫吡啶基團、1-乙氧羰基-4-六氫吡啶基團、4-正丙氧羰基-4-六氫吡啶基團、5-正丁氧羰基-4-六氫吡啶基團、1-第三丁氧羰基-4-六氫吡啶基團、1-甲醯基-4-六氫吡啶基團、1-乙醯基-4-六氫吡啶基團、1-丁醯基-4-六氫吡啶基團、1-丁醯基-3-六氫吡啶基團、2-丙醯基-4-六氫吡啶基團、3-丁醯基-4-六氫吡啶基團、4-異丁醯基-4-六氫吡啶基團、1-正戊醯基-4-六氫吡啶基團、2-第三丁羰基-4-六氫吡啶基團、3-正己醯基-4-六氫吡啶基團、1-苯甲醯基-4-六氫吡啶基團、1-苯甲醯基-3-六氫吡啶基團、1-(2-, 3-, 或 4-氯苯甲醯基)-4-六氫吡啶基團、1-(2-, 3-, 或 4-氟苯甲醯基)-4-六氫吡啶基團、1-(2-, 3-, 或 4-甲基苯甲醯基)-4-六氫吡啶基團、2,6-二甲基-4-六氫吡啶基團、2,4,6-三甲基-3-六氫吡啶基團、2,2,6,6-四甲基-4-六氫吡啶基團、及 2,2,4,4,6-五甲基-3-六氫吡啶基團。

四氫呋喃基團（其可具有酮基團）之實例包括 2-四氫呋喃基團、3-四氫呋喃基團、3-酮基-2-四氫呋喃基團、4-酮基-2-四氫呋喃基團、5-酮基-2-四氫呋喃基團、2-酮基-3-四氫呋喃基團、4-酮基-3-四氫呋喃基團、及 5-酮基-4-四氫呋喃基團。

六氫氮雜草基團（其可具有酮基團）之實例包括 2-六

(88)

氫氮雜草基團、3-六氫氮雜草基團、4-六氫氮雜草基團、2-酮基-3-六氫氮雜草基團、3-酮基-2-六氫氮雜草基團、4-酮基-2-六氫氮雜草基團、5-酮基-2-六氫氮雜草基團、及6-酮基-2-六氫氮雜草基團。

吡啶基團（其可具有擇自低級烷基團、芳基團、及呋喃基團中之基團以作為取代基）之實例包括吡啶基團，其可具有1至3個（最好1至2個）擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述芳基團；及

呋喃基團中之基團以作為取代基。其特定實例包括1-吡啶基團、3-吡啶基團、4-吡啶基團、1-甲基-5-吡啶基團、1-乙基-5-吡啶基團、3-正丙基-5-吡啶基團、4-正丁基-5-吡啶基團、1-第三丁基-4-吡啶基團、1-正戊基-4-吡啶基團、3-正己基-4-吡啶基團、3-苯基-5-吡啶基團、1-(2-萘基)-3-吡啶基團、4-(2-甲苯基)-3-吡啶基團、5-(3-乙苯基)-3-吡啶基團、1-(4-正丙苯基)-4-吡啶基團、3-(2-正丁苯基)-4-吡啶基團、5-(3-正戊苯基)-4-吡啶基團、1-(4-正己苯基)-5-吡啶基團、3-(2-異丁苯基)-5-吡啶基團、4-(3-第三丁苯基)-5-吡啶基團、3-(2-氯苯基)-1-吡啶基團、4-(3-氟苯基)-1-吡啶基團、5-(4-溴苯基)-1-吡啶基團、1-(2-胺苯基)-3-吡啶基團、4-(2,3-二甲苯基)-3-吡啶基團、5-(3,4,5-三甲苯基)-3-吡啶基團、1-(2,3-二胺苯基)-4-吡啶基團、3-

(89)

( 2-呋喃基 ) -5-吡唑基團、1,3-二甲基-5-吡唑基團、1,3,4-三乙基-5-吡唑基團、1,3,5-三甲基-4-吡唑基團、及1-甲基-3-苯基-5-吡唑基團。

噻二唑基團之實例包括 1,2,3-噻二唑基團、1,2,4-噻二唑基團、1,2,5-噻二唑基團、及 1,3,4-噻二唑基團。

噻二唑基團（其可具有低級烷基團）之實例包括如上所述之噻二唑基團，其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括 4-或 5-（1,2,3-噻二唑）基團、3-或 5-（1,2,4-噻二唑）基團、3-（1,2,5-噻二唑）基團、2-（1,3,4-噻二唑）基團、5-甲基-1,3,4-噻二唑-2-基團、4-乙基-1,2,3-噻二唑-5-基團、5-正丙基-1,2,4-噻二唑-3-基團、5-正丁基-1,3,4-噻二唑-2-基團、4-第三丁基-1,2,3-噻二唑-5-基團、5-正戊基-1,2,4-噻二唑-3-基團、及 5-正己基-1,3,4-噻二唑-2-基團。

異噁唑基團（其可具有低級烷基團）之實例包括如上所述之異噁唑基團，其可具有 1 至 2 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括 3-異噁唑基團、4-異噁唑基團、5-異噁唑基團、3-甲基-5-異噁唑基團、4-乙基-5-異噁唑基團、4-正丙基-3-異噁唑基團、5-甲基-3-異噁唑基團、5-正丁基-3-異噁唑基團、3-第三丁基-4-異噁唑基團、5-正戊基-4-異噁唑基團、3-正己基-5-異噁唑基團、及 3,4-二甲基-5-異噁唑基團。

(90)

吡啶基團之實例包括（1-，3-，4-，5-，6-，或7-）吡啶基團。

四氫苯並噻啶基團之實例包括（2-，4-，5-，6-，或7-）（4,5,6,7-四氫苯並噻啶基）團。

四氫喹啉基團之實例包括（1-，2-，4-，5-，6-，或8-）（1,2,3,4-四氫喹啉基）團。

四氫喹啉基團（其可具有擇自低級烷基團、低級烷氧基團、鹵素原子及酮基團中之基團以作為取代基）之實例包括

如上所述四氫喹啉基團，其可具有1至3個（最好1至2個）擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述低級烷氧基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷氧基團）；鹵素原子；及酮基團中之基團以作為取代基。其特定實例包括1-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、2-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、3-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、4-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、5-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、6-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、7-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、8-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、2-甲基-3-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、3-乙基-2-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、4-正丙基-2-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、5-正丁基-3-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、6-第三丁基-3-（1,2,3,4-四氫喹啉基）團、7-正戊基-2-（1,2,3,4-四氫喹

(91)

啉基) 團、8-正己基-2-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、2-甲氧基-4-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、3-乙氧基-4-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、4-丙氧基-5-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、5-丁氧基-6-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、6-戊氧基-7-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、7-己氧基-8-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、4-酮基-3-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、2-酮基-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, -7, 或 8-) -(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、2-酮基-8-甲基-(3-, 4-, 5-, 6-, 或 -7) -(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、2-酮基-8-甲氧基-3-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、2-酮基-5-甲氧基-(1-, 3-, 4-, 6-, -7, 或 8-) -(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、2-酮基-8-氟基-(3-, 4-, 5-, 6-, 或 -7) -(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團、及 2-酮基-6,8-二甲基-3-(1,2,3,4-四氫喹啉基) 團。

喹啉基團之實例包括 2-喹啉基團、3-喹啉基團、4-喹啉基團、5-喹啉基團、6-喹啉基團、7-喹啉基團、及 8-喹啉基團。喹啉基團(其可具有低級烷基團)之實例包括喹啉基團, 其可具有 1 至 2 個如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, -7, 或 8-喹啉基團、2-甲基-6-喹啉基團、4-乙基-5-喹啉基團、4-正丙基-3-喹啉基團、5-甲基-3-喹啉基團、5-正丁基-3-喹啉基團、3-第三丁基-4-喹啉基團、5-正戊基-4-喹啉基團、3-正己基-5-喹啉基團及 3,4-二甲基-5-喹啉基團。

苯並二噁茂基低級烷基團之實例包括具有 1 至 2 個

(92)

(最好 1 個) 苯並二噁茂基團之如上所述低級烷基團。其特定實例包括 2-，4-，或 5- (1,3-苯並二噁茂基) 甲基團、2- (2-，4-，或 5) (1,3-苯並二噁茂基) 乙基團、及 3- (2-，4-，或 5) (1,3-苯並二噁茂基) 丙基團。

芳基團 (其可具有擇自鹵素原子；低級烷基團；低級烷氧基團；經鹵素取代之低級烷基團；經鹵素取代之低級烷氧基團；低級烯基團；胺基團 (其可具有擇自低級烷磺醯基團，低級烷基團，及芳基團中之基團)；胺基磺醯基團；低級烷硫基團；低級烷醯基團；低級烷氧羰基團；吡咯基團；低級炔基團；氰基團；硝基團；芳氧基團；芳基低級烷氧基團；羥基團；羥基低級烷基團；胺基甲醯基團 (其可具有擇自低級烷基團及芳基團中之基團)；吡啶基團；吡咯啉基團 (其可具有酮團)；噁唑基團；咪唑基團 (其可具有低級烷基團)；二氫呋喃基團 (其可具有酮基團)；噻唑啉基低級烷基團 (其可具有酮基團)；咪唑基低級烷醯基團；及六氫吡啶羰基團中之基團)之實例包括如上所述芳基團，其可具有 1 至 7 個，最好 1 至 5 個，尤其 1 至 2 個擇自

如上所述鹵素原子；

如上所述低級烷基團 (最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)；

如上所述低級烷氧基團 (最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團)；

如上所述經鹵素取代之低級烷基團 (最好為經 1 至 7

(93)

個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)；

如上所述經鹵素取代之低級烷氧基團(最好為經 1 至 7 個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團)；

如上所述低級烯基團(最好為具 1 至 3 個雙鍵及 2 至 6 個碳原子之直或支鏈烯基團(反式及順式構型均包括在內))；

胺基團，其具有如上所述低級烷醯基團，如上所述低級烷基團，及如上所述低級芳基團；

胺基磺醯基團；

低級烷硫基團且彼之低級烷基部分為如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)；

如上所述低級烷醯基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團)；

如上所述低級烷氧羰基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團)；吡咯基團；如上所述炔基團；氰基團；硝基團；芳氧基團且彼之芳基部分乃如上所述；芳基低級烷氧基團且彼之芳基部分及低級烷氧基部分乃如上所述；羥基低級烷基團且彼之低級烷基部分乃如上所述；胺基甲醯基團，其可具有 1 至 2 個擇自如上所述低級烷基團及如上所述芳基團中之基團；吡唑基團；吡咯啉基團，其可具有 1 至 2 個(最好 1 個)酮基團；噁唑基團；咪唑基團，其可具有 1 至 3 個(最好 1 至 2 個)如上



(94)

所述低級烷基團；二氫呋喃基團，其具有 1 至 2 個（最好 1 個）酮基團；具有如上所述低級烷基團之噻唑啉基團，其可具有 1 至 2 個（最好 1 個）酮基團；咪唑基低級烷醯基團且彼之烷醯基部分乃如上所述；及六氫吡啶羰基中之取代基。其特定實例包括苯基團、1-萘基團、2-萘基團、（2-，3-，或 4-）聯苯基團、（2-，3-，或 4-）氯苯基團、（2-，3-，或 4-）氟苯基團、（2-，3-，或 4-）溴苯基團、（2-，3-，或 4-）甲苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）乙基-1-萘基團、（2-，3-，或 4-）正丙苯基團、（2-，3-，或 4-）正丁苯基團、（2-，3-，或 4-）正戊苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）正己基-1-萘基團、（2-，3-，或 4-）異丁苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）第三丁基-1-萘基團、（2-，3-，或 4-）甲氧基苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）乙氧基-1-萘基團、（2-，3-，或 4-）正丙氧基苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）異丙氧基-1-萘基團、（2-，3-，或 4-）正丁氧基苯基團、（1-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）異丁氧基-2-萘基團、（2-，3-，或 4-）第三丁氧基苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）另丁氧基-1-萘基團、（2-，3-，或 4-）正戊氧基苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）異戊氧基-1-萘基團、（2-，3-，或 4-）新戊氧基苯基團、（1-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）正己氧基-2-萘基團、（2-，3-，或 4-）異己氧基苯基團、（2-，3-，4-，5-，6-，-7，或 8-）（3-

(95)

甲基戊氧基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 氯甲基苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 三氟甲基苯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, -7, 或 8-) 氟乙基-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-溴丙基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (4-氯丁基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (5-氟戊基) 苯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, -7, 或 8-) (6-溴己基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (1,1-二甲基-2-氯乙基) 苯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, -7, 或 8-) (2-甲基-3-氟丙基)-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 氯甲氧基苯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, -7, 或 8-) (2-氟乙氧基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-溴丙氧基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (4-氯丁氧基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (5-氟戊氧基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 三氟甲氧基苯基團、4-(6-溴己氧基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (1,1-二甲基-2-氯乙氧基) 苯基團、7-(2-甲基-3-氟丙氧基)-2-萘基團、2-乙烯基苯基團、2-(1-甲基乙烯基) 苯基團、2-(1-丙烯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-甲基-1-丙烯基) 苯基團、3-(2-甲基-1-丙烯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-丙烯基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-丙烯基) 苯基團、4-(2-丁烯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-丁烯基) 苯基團、5-(3-丁烯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-戊烯基) 苯基團、6-(1-戊烯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-戊烯基) 苯基團、7-(4-戊烯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (1,3-丁二烯基) 苯

(96)

基團、8-(1,3-戊二烯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-)  
 (2-戊烯-4-炔基)苯基團、1-(2-己烯基)-2-萘基團、4-  
 (1-己烯基)苯基團、3-(5-己烯基)-2-萘基團、(2-,  
 3-, 或 4-)(3-己烯基)團、4-(4-己烯基)-2-萘基團、  
 (2-, 3-, 或 4-)(3,3-二甲基-1-丙烯基)苯基團、5-  
 (2-乙基-1-丙烯基)-2-萘基團、4-(1,3,5-己三烯基)苯  
 基團、6-(1,3-己二烯基)-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-)  
 (1,4-己二烯基)苯基團、(2-, 3-, 或 4-)(N-甲醯  
 胺基)苯基團、(2-, 3-, 或 4-)(N-乙醯胺基)苯基  
 團、7-(N-乙醯胺基)-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-)(N-  
 丙醯胺基)苯基團、8-(N-丁醯胺基)-2-萘基團、(2-,  
 3-, 或 4-)(N-丁醯胺基)苯基團、2-(N-戊醯胺基)-1-  
 萘基團、(2-, 3-, 或 4-)(N-第三丁羰基胺基)苯基  
 團、3-(N-己醯胺基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-)  
 (N,N-二甲醯胺基)苯基團、4-(N,N-二乙醯胺基)-1-萘  
 基團、(2-, 3-, 或 4-)(N,N-二甲胺基)苯基團、(2-  
 , 3-, 或 4-)(N-苯胺基)苯基團、(2-, 3-, 或 4-)胺  
 基磺醯基苯基團、5-胺基磺醯基-1-萘基團、(2-, 3-, 或  
 4-)甲硫基苯基團、6-乙硫基-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-)  
 )正丙硫基苯基團、7-異丙硫基-1-萘基團、(2-, 3-, 或  
 4-)正丁硫基苯基團、8-第三丁硫基-1-萘基團、(2-, 3-  
 , 或 4-)正戊硫基苯基團、1-正己硫基-2-萘基團、(2-,  
 3-, 或 4-)(N-甲基(磺醯基胺基))苯基團、(2-, 3-  
 , 或 4-)甲醯基苯基團、(2-, 3-, 或 4-)乙醯基苯基

(97)

團、(2-, 3-, 或 4-) 丁醯基苯基團、3-乙醯基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 丙醯基苯基團、4-丁醯基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 異丁醯基苯基團、5-戊醯基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 氰苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 甲氧羰基苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 第三丁羰基苯基團、6-己醯基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙氧羰基苯基團、7-乙氧羰基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 正丙氧羰基苯基團、8-異丙氧羰基-2-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 正丁氧羰基苯基團、2-異丁氧羰基-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 第三丁氧羰基苯基團、3-另丁氧羰基-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 正戊氧羰基苯基團、4-新戊氧羰基-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) 正己氧羰基苯基團、5-異己氧羰基-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-甲基戊氧羰基) 苯基團、6-(1-吡咯基)-1-萘基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-吡咯基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙炔基苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (N-甲基胺基甲醯) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (N-苯基胺基甲醯) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-羥乙基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 苯氧基苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 硝苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 苄氧基苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 羥苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-酮基-2,5-二氫呋喃-4-基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-咪唑基乙醯基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (2,4-二酮基噻唑啉-5-基甲基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶羰基] 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) [(1-, 3-, 4-, 或

(98)

5-) 吡啶基]苯基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-酮基-(1-, 或 3-) 吡咯啉基]苯基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 4, 或 5-) 噁唑基]苯基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-乙基-4-甲基咪唑-1-基) 苯基團、(2-, 3-, 或 4-) 聯苯基團、2,3-二甲氧基苯基團、2,4-二甲氧基苯基團、2,5-二甲氧基苯基團、2,6-二甲氧基苯基團、3,4-二甲氧基苯基團、3,5-二甲氧基苯基團、2,3-二氯苯基團、2,4-二氯苯基團、3,4-二氯苯基團、2-甲氧基-5-氯苯基團、2-甲氧基-5-甲苯基團、2-甲氧基-5-乙醯胺基苯基團、2-乙烯基-4-甲苯基團、2-乙烯基-5-乙苯基團、2,6-二胺基磺醯基苯基團、2,4,6-三甲氧基苯基團、3,4,5-三乙氧基苯基團、2-乙烯基-3,4,5-三乙基苯基團、五甲氧基苯基團、2-乙烯基萘基團、2,3-二甲氧基-1-萘基團、3,4-二乙氧基苯基團、2-甲氧基-5-甲氧羰基苯基團、3,5-二甲氧羰基苯基團、3-氯基-4-羥苯基團、2-氯基-5-(N-乙醯胺基) 苯基團、2-氯基-5-氰苯基團、2-氯基-5-胺基甲醯基苯基團、2-甲氧基-5-(N-乙醯胺基) 苯基團、2-氯基-5-乙氧羰基苯基團、3,5,7-三乙氧基-1-萘基團、3,4,5,7-四甲基-1-萘基團、2,3,4,5-四甲基-7-(N-五乙醯胺基)-1-萘基團、2,3,4,5,6,7-六乙氧基-1-萘基團、及七甲氧基-1-萘基團。

氰基低級烷基團之實例包括具有單一氰基團之如上所述低級烷基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括氰甲基團、2-氰乙基團、1-氰乙基團、3-氰丙基團、4-氰丁基團、1,1-二甲基-2-氰乙基

(99)

團、5-氟戊基團、6-氟己基團、1-氟異丙基團、及2-甲基-3-氟丙基團。

低級烷醯胺基低級烷基團之實例包括具有1至3個（最好1個）胺基團（其具有1至2個如上所述低級烷醯基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷醯基團））之如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括2-（N-甲醯胺基）乙基團、2-（N-乙醯胺基）乙基團、2-（N-丙醯胺基）乙基團、2-（N-丁醯胺基）乙基團、2-（N-異丁醯胺基）乙基團、2-（N-戊醯胺基）乙基團、2-（N-第三丁羰基胺基）乙基團、2-（N-己醯胺基）乙基團、N-乙醯胺基甲基團、1-（N-乙醯胺基）乙基團、3-（N-乙醯胺基）丙基團、4-（N-乙醯胺基）丁基團、5-（N-乙醯胺基）戊基團、6-（N-乙醯胺基）己基團、1,1-二甲基-2-（N-乙醯胺基）乙基團、2-甲基-3-（N-乙醯胺基）丙基團、及2-（N,N-二乙醯胺基）乙基團。

經鹵素取代之低級烷胺基團之實例包括胺基團，其具有1至2個如上所述經鹵素取代之低級烷基團（最好為具有1至7個，尤其1至3個鹵素原子之具1至6個碳原子之直或支鏈經鹵素取代烷基團）。其特定實例包括N-氟基甲胺基團、N-二氟基甲胺基團、N-三氟基甲胺基團、N-氯基甲胺基團、N-二氯基甲胺基團、N-三氯基甲胺基團、N-溴基甲胺基團、N-二溴基甲胺基團、N-二氯基氟基甲胺基團、N-2,2,2-三氟基乙胺基團、N-五氟基乙胺基團、N-

(100)

2-氨基乙胺基團、N-3,3,3-三氟基丙胺基團、N-七氟基丙胺基團、N-七氟基異丙胺基團、N-3-氨基丙胺基團、N-2-氨基丙胺基團、N-3-溴基丙胺基團、N-4,4,4-三氟基丁胺基團、N-4,4,4,3,3-五氟基丁胺基團、N-4-氨基丁胺基團、N-4-溴基丁胺基團、N-2-氨基丁胺基團、N-5,5,5-三氟基戊胺基團、N-5-氨基戊胺基團、N-6,6,6-三氟基己胺基團、N-6-氨基己胺基團、N-(1,1-二甲基-2-氯乙基)胺基團、N-(2-甲基-3-氟丙基)胺基團、及N,N-二(氟甲基)胺基團。

低級烷硫基低級烷基團之實例包括具有1至3個低級烷硫基團(彼之烷基部分乃如上所述(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團))之如上所述低級烷基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括2-甲硫基乙基團、2-乙硫基乙基團、2-正丙硫基乙基團、2-正丁硫基乙基團、2-第三丁硫基乙基團、2-正戊硫基乙基團、2-正己硫基乙基團、甲硫基甲基團、1-甲硫基乙基團、3-甲硫基丙基團、4-甲硫基丁基團、5-甲硫基戊基團、6-甲硫基己基團、1,1-二甲基-2-甲硫基乙基團、2-甲基-3-甲硫基丙基團、2,2-二乙硫基乙基團、及2,2,2-三乙硫基乙基團。

脒基團(其可具有低級烷基團)之實例包括脒基團,其可具有1至2個如上所述低級烷基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括脒基團、N-甲基脒基團、N-乙基脒基團、N-正丙基脒基團、N-

(101)

正丁基脒基團、N-正戊基脒基團、N-正己基脒基團、N-異丙基脒基團、N-第三丁基脒基團、N,N-二甲基脒基團、N,N'-二甲基脒基團、及 N-甲基-N'-乙基-脒基團。

脒基低級烷基團之實例包括具有 1 至 3 個脒基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括脒甲基團、2-脒乙基團、3-脒丙基團、4-脒丁基團、5-脒戊基團、6-脒己基團、1-脒乙基團、1,1-二甲基-2-脒乙基團、2-甲基-3-脒丙基團、2,2-二脒基乙基團、及 2,2,2-三脒基乙基團。

低級烯氧基團之實例包括低級烯氧基團且彼之低級烯基部分為如上所述者（最好為具有 1 至 3 個雙鍵及 2 至 6 個碳原子之直或支鏈烯氧基團）。其特定實例包括乙烯氧基團、1-丙烯氧基團、1-甲基-1-丙烯氧基團、2-甲基-1-丙烯氧基團、2-丙烯氧基團、2-丁烯氧基團、1-丁烯氧基團、3-丁烯氧基團、2-戊烯氧基團、1-戊烯氧基團、3-戊烯氧基團、4-戊烯氧基團、1,3-丁二烯氧基團、1,3-戊二烯氧基團、2-戊烯-4-炔氧基團、2-己烯氧基團、1-己烯氧基團、5-己烯氧基團、3-己烯氧基團、4-己烯氧基團、3,3-二甲基-1-丙烯氧基團、2-乙基-1-丙烯氧基團、1,3,5-己三烯氧基團、1,3-己二烯氧基團、及 1,4-己二烯氧基團。

低級烯氧基低級烷基團之實例包括具有 1 至 3 個低級烯氧基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團），且彼之低級烯氧基部分為如上



(102)

所述之低級烯氧基團（最好為具有 2 至 6 個碳原子及 1 至 3 個雙鍵之直或支鏈烯氧基團）。其特定實例包括乙烯氧基甲基團、2-乙烯氧基乙基團、2-（1-丙烯氧基）乙基團、2-（1-甲基-1-丙烯氧基）乙基團、2-（2-甲基-1-丙烯氧基）乙基團、2-（2-丙烯氧基）乙基團、2-（2-丁烯氧基）乙基團、2-（1-丁烯氧基）乙基團、2-（3-丁烯氧基）乙基團、2-（2-戊烯氧基）乙基團、2-（1-戊烯氧基）乙基團、2-（3-戊烯氧基）乙基團、2-（4-戊烯氧基）乙基團、2-（1,3-丁二烯氧基）乙基團、2-（1,3-戊二烯氧基）乙基團、2-（2-戊烯-4-炔氧基）乙基團、2-（2-己烯氧基）乙基團、2-（1-己烯氧基）乙基團、2-（5-己烯氧基）乙基團、2-（3-己烯氧基）乙基團、2-（4-己烯氧基）乙基團、2-（3,3-二甲基-1-丙烯氧基）乙基團、2-（2-乙基-1-丙烯氧基）乙基團、2-（1,3,5-己三烯氧基）乙基團、2-（1,3-己二烯氧基）乙基團、2-（1,4-己二烯氧基）乙基團、3-乙烯氧基丙基團、4-乙烯氧基丁基團、5-乙烯氧基丙基團、6-乙烯氧基己基團、1-乙烯氧基乙基團、1,1-二甲基-2-乙烯氧基乙基團、2-甲基-3-乙烯氧基丙基團、2,2-二乙烯氧基乙基團、及 2,2,2-三乙烯氧基乙基團。

芳胺基團（其可於芳基團上具有擇自低級烷基團，低級烷氧基團，經鹵素取代之低級烷基團，及經鹵素取代之烷氧基團中之取代基）之實例包括具有 1 至 2 個如上所述芳基團之胺基團，其可於芳基團上具有 1 至 7 個，最好 1

(103)

至 5 個，尤其 1 至 2 個擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述低級烷氧基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）；

如上所述經鹵素取代之低級烷基團（最好為經 1 至 7 個，尤其 1 至 3 個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述經鹵素取代之低級烷氧基團（最好為經 1 至 7 個，尤其 1 至 3 個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）中之取代基。其特定實例包括 N-苯基胺基團、N-2-萘基胺基團、N-（2-甲苯基）胺基團、N-（3-乙基-1-萘基）胺基團、N-（4-正丙苯基）胺基團、N-（2-正丁基-1-苯基）胺基團、N-（3-正戊苯基）胺基團、N-（4-正己基-1-萘基）胺基團、N-（2-異丁苯基）胺基團、N-（3-第三丁基-1-萘基）胺基團、N-（2-甲氧基苯基）胺基團、N-（3-乙氧基-1-萘基）胺基團、N-（4-正丙氧基苯基）胺基團、N-（3-異丙氧基-1-萘基）胺基團、N-（正丁氧基苯基）胺基團、N-（1-異丁氧基-2-萘基）胺基團、N-（第三丁氧基苯基）胺基團、N-（5-另丁氧基-1-萘基）胺基團、N-（正戊氧基苯基）胺基團、N-（5-異戊氧基-1-萘基）胺基團、N-（1-新戊氧基苯基）胺基團、N-（6-正己氧基-2-萘基）胺基團、N-（異己氧基苯基）胺基團、N-（3-甲基戊氧基-1-萘基）胺基團、N-（2-三氟甲苯

(104)

基) 胺基團、N-(4-三氟甲苯基) 胺基團、N-(2-氯甲基苯基) 胺基團、N-[3-(2-氟乙基)-1-萘基]胺基團、N-[4-(3-溴丙基) 苯基] 胺基團、N-[2-(4-氯丁基)-1-苯基] 胺基團、N-[3-(5-氟戊基) 苯基]胺基團、N-[4-(6-溴己基)-1-萘基]胺基團、N-[2-(1,1-二甲基-2-氯乙基) 苯基] 胺基團、N-[7-(2-甲基-3-氟丙基)-2-萘基]胺基團、N-(2-氯甲氧基苯基) 胺基團、N-(4-三氟甲氧基苯基) 胺基團、N-(3-(2-氟乙氧基)-1-萘基) 胺基團、N-[4-(3-溴丙氧基) 苯基] 胺基團、N-[2-(4-氯丁氧基)-1-苯基] 胺基團、N-[3-(5-氟戊氧基) 苯基]胺基團、N-[4-(6-溴己氧基)-1-萘基]胺基團、N-[2-(1,1-二甲基-2-氯乙氧基) 苯基]胺基團、N-[7-(2-甲基-3-氟丙氧基)-2-萘基] 胺基團、N-(2-氯甲氧基苯基) 胺基團、N-(3-(2-氟乙氧基)-1-萘基) 胺基團、N-[4-(3-溴丙氧基) 苯基] 胺基團、N-[2-(4-氯丁氧基)-1-苯基]胺基團、N-[3-(5-氟戊氧基) 苯基]胺基團、N-[4-(6-溴己氧基)-1-萘基]胺基團、N-[2-(1,1-二甲基-2-氯乙氧基) 苯基]胺基團、N-[7-(2-甲基-3-氟丙氧基)-2-萘基]胺基團、及 N,N-二苯基胺基團。

芳基低級烯基團之實例包括具有如上所述芳基團之如上所述烯基團(最好為具有1至3個芳基團及1至6個碳原子之直或支鏈烯基團)。其特定實例包括2-苯基乙烯基團、3-苯基-2-丙烯基團、3-[(1-或2-)萘基]-2-丙烯基團、4-[(2-, 3-, 或4-)甲苯基]-2-丁烯基團、4-[(2-,

(105)

3-，或 4-) 乙苯基]-3-丁烯基團、4-[(2-，3-，或 4-) 正丙苯基]-1,3-丁二烯基團、5-[(2-，3-，或 4-) 正丁苯基]-1,3,5-己三烯基團、5-[(2-，3-，或 4-) 正戊苯基]-2,4-己二烯基團、5-[(2-，3-，或 4-) 正己苯基]-3-戊烯基團、3-[(2-，3-，或 4-) 異丁苯基]-2-丙三烯基團、2-[(2-，3-，或 4-) 第三丁苯基]苯基團、3-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 甲基-1-萘基]-2-丙烯基團、4-[(1-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 甲基-2-萘基]-2-丁烯基團、4-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 乙基-1-萘基]-3-丁烯基團、4-[(1-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 乙基-2-萘基]-1,3-丁二烯基團、5-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正丙基-1-萘基]-1,3,5-己三烯基團、5-[(1-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正丙基-2-萘基]-2,4-己二烯基團、5-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正丁基-1-萘基]-3-戊烯基團、3-[(1-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正丁基-2-萘基]-2-丙烯基團、2-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正戊基-1-萘基]乙烯基團、3-[(1-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正戊基-2-萘基]-2-丙烯基團、4-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正己基-1-萘基]-2-丁烯基團、4-[(1-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 正己基-2-萘基]-3-丁烯基團、4-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 異丁基-1-萘基]-1,3-丁二烯基團、5-[(1-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 異丁基-2-萘基]-1,3,5-己三烯基團、5-[(2-，3-，4-，5-，6-，7-，或 8-) 第三丁基-1-萘基]-2,4-己二烯基

(106)

團、5-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 第三丁基 -2-萘基 ]-1,3,5-己三烯基團、5-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 氟苯基團、 ( 2- , 3- , 或 4- ) 氟苯基 ]-2,4-己二烯基團、5-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 溴苯基 ]-3-戊烯基團、3-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -1-萘基 ]-2-丙烯基團、2-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -2-萘基 ]乙烯基團、3-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -1-萘基 ]-2-丙烯基團、4-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 氟基 -2-萘基 ]-2-丁烯基團、4-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 溴基 -1-萘基 ]-3-丁烯基團、4-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 溴基 -2-萘基 ]-1,3-丁二烯基團、5-[ ( 2- , 3- , 或 4- ) 胺苯基 ]-1,3,5-己三烯基團、5-[ ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 胺基 -1-萘基 ]-2,4-己二烯基團、5-[ ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 胺基 -2-萘基 ]-3-戊烯基團、3- ( 2,3-二甲苯基 ) -2-丙烯基團、2- ( 3,4-二甲苯基 ) 乙烯基團、3- ( 2,4-二甲苯基 ) -2-丙烯基團、4- ( 2,5-二甲苯基 ) -2-丁烯基團、4- ( 2,6-二甲苯基 ) -3-丁烯基團、4- ( 2,4,6-三甲苯基 ) -1,3-丁二烯基團、5- ( 3,4,5-三甲苯基 ) -1,3,5-己三烯基團、5- ( 2,3,4,5-四乙苯基 ) -2,4-己二烯基團、5- ( 五甲苯基 ) -3-丙烯基團、3- ( 2-甲萘基 ) -2-丙烯基團、2- ( 2,3-二甲萘基 ) 乙烯基團、3- ( 3,4-二甲苯基 ) -2-丙烯基團、4- ( 3,5,7-三乙萘基 ) -2-丁烯基團、4- ( 3,4,5,7-四甲萘基 ) -3-丁烯基團、4- ( 2,3,4,5,7-五甲萘基 ) -1,3-丁二烯基團、5- ( 2,3,4,5,6,7-六乙萘基 ) -1,3,5-

(107)

己三烯基團、5-(七甲萘基)-2,4-己二烯基團、5-(2,3-二胺苯基)-3-丙烯基團、3-(2,4,6-三胺苯基)-2-丙烯基團、及2-(2-甲基-5-氯萘基)乙烯基團。

吡啶基胺基團(其可具有低級烷基團)之實例為吡啶基胺基團,其可於吡啶基團及/或胺基團上具有1至3個,最好1至2個如上所述低級烷基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括N-(2-, 3-, 或4-)吡啶基胺基團、N-3-甲基-2-吡啶基胺基團、N-(4-甲基-2-吡啶基)胺基團、N-(5-甲基-2-吡啶基)胺基團、N-(6-甲基-2-吡啶基)胺基團、N-(2-甲基-3-吡啶基)胺基團、N-(4-甲基-3-吡啶基)胺基團、N-(5-甲基-3-吡啶基)胺基團、N-(6-甲基-3-吡啶基)胺基團、N-(2-甲基-4-吡啶基)胺基團、N-(3-甲基-4-吡啶基)胺基團、N-(3-乙基-2-吡啶基)胺基團、N-(4-正丙基-2-吡啶基)胺基團、N-(5-正丙基-2-吡啶基)胺基團、N-(2-正丁基-3-吡啶基)胺基團、N-(4-正戊基-3-吡啶基)胺基團、N-(5-正己基-3-吡啶基)胺基團、N-(2-異丙基-4-吡啶基)胺基團、N-(3-第三丁基-4-吡啶基)胺基團、N-(3-甲基-2-吡啶基)-N-甲基-胺基團、及N-(2,4-二乙基-3-吡啶基)-N-甲基-胺基團。

芳基低級烷基團(其可於芳基團及/或低級烷基團上具有擇自鹵素原子,低級烷基團,經鹵素取代之烷基團,經鹵素取代之低級烷氧基團,低級烷氧基團,胺基甲醯基團,及低級烷氧羰基團中之基團以作為取代基)之實例包

(108)

括具有 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述芳基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）。值得注意的是，其可於芳基團及/或烷基部分上具有 1 至 7 個，最好 1 至 5 個，尤其 1 至 2 個擇自

如上所述鹵素原子；

如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述經鹵素取代之低級烷基團（最好為經 1 至 7 個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述經鹵素取代之低級烷氧基團（最好為經 1 至 7 個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）；

如上所述低級烷氧基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）；

胺基甲醯基團；及

如上所述低級烷氧羰基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團）中之取代基。芳基低級烷基團（其可於芳基團及/或低級烷基團上具有擇自鹵素原子，低級烷基團，經鹵素取代之烷基團，經鹵素取代之低級烷氧基團，低級烷氧基團，胺基甲醯基團，及低級烷氧羰基團中之取代基）之特定實例包括苄基團、1-苯基乙基團、2-苯基乙基團、1-甲基-1-苯基乙基團、1,1-二甲基-2-苯基乙基團、1,1-二甲基-3-苯基丙基團、（2-，3-，或 4-）氟

(109)

基苄基團、2-[ (2-, 3-, 或 4-) 氟苯基 ]乙基團、1-[ (2-, 3-, 或 4-) 氟苯基 ]乙基團、1-[ (2-, 3-, 或 4-) 氟苯基 ]丙基團、2-[ (2,6-, 或 3,5-) 二氟苯基 ]乙基團、1-(3,5-二氟苯基)乙基團、1-(3,5-二氟苯基)丙基團、(2-, 3-, 或 4-) 氯基苄基團、2-[ (2-, 3-, 或 4-) 氯苯基 ]乙基團、2-(3,4-二氯苯基)乙基團、1-(3-氯苯基)丁基團、1-(4-氯苯基)丁基團、(2-, 3-, 或 4-) 三氟甲苯基苄基團、1-[ (2-, 3-, 或 4-) 三氟甲苯基 ]乙基團、1-[ (2-, 3-, 或 4-) 三氟甲苯基 ]丙基團、(2-, 3-, 或 4-) 甲基苄基團、2-[ (2-, 3-, 或 4-) 甲苯基 ]乙基團、(2-, 3-, 或 4-) 三氟甲氧基苄基團、1-[ (2-, 3-, 或 4-) 三氟甲苯基 ]乙基團、(2-, 3-, 或 4-) 甲氧基苄基團、2-[ (2-, 3-, 或 4-) 甲苯基 ]乙基團、1-[ (2-, 3-, 或 4-) 甲氧基苯基 ]丙基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙氧基苄基團、(3,4-或 3,5-) 二甲氧基苄基團、(3,4-或 3,5-) 二(正丁氧基)苄基團、2-[ (3,5-或 3,4-) 二甲氧基苯基 ]乙基團、2-(2-乙氧基苯基)乙基團、1-(4-甲氧基苯基)丁基團、1-苯基-1-甲氧羰基甲基團、1-胺基甲醯基-2-苯基乙基團、1-甲氧羰基-2-苯基乙基團、2-甲氧羰基-2-苯基乙基團、2-苯基-2-羥基乙基團、2-(4-羥苯基)-1-甲氧羰基乙基團、3-氯基-4-二氟甲氧基苯基甲基團、及萘甲基團。

低級炔基團之實例包括具 2 至 6 個碳原子之直或支鏈炔基團。其特定實例包括乙炔基團、2-丙炔基團、2-丁炔



(110)

基團、3-丁炔基團、1-甲基-2-丙炔基團、2-戊炔基團、及2-己炔基團。

芳氧基低級烷基團（於芳基團上可存在擇自低級烷氧基團；胺基甲醯基團（其可具有擇自低級烷氧基團及低級烷基團中之基團）；及吡咯啉基團（其可具有酮基團）中之基團）之實例包括芳基低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）且彼之芳基部分及低級烷基團乃如上所述。此處之芳基團上可存在1至5個（最好1至2個）擇自如上所述低級烷氧基團；胺基甲醯基團（其可具有1至2個擇自如上所述低級烷氧基團及如上所述低級烷基團中之基團）；及酮基中之基團以作為取代基。其特定實例包括2-[(2-, 3-, 或 4-) 甲氧基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或 4-) 胺基甲醯基苯氧基]乙基團、2-[(2-, 3-, 或 4-) (N-甲基-N-乙氧基胺基甲醯基) 苯氧基]乙基團、及2-[(2-, 3-, 或 4-) (2-酮基-1-吡咯啉基) 苯氧基]乙基團。

異噁唑啉基團（其可具有酮基團）之實例包括異噁唑基團，其可具有1至2個（最好1個）酮基團。其特定實例包括3-酮基異噁唑啉-4-或5-基團及3,5-二酮基異噁唑啉-4-基團。

二氫茚基團之實例包括(1-, 2-, 4-, 或 5-)-1,2 二氫茚基團。

芳基低級烷氧基低級烷基團之實例包括芳基低級烷氧基低級烷基團且彼之芳基部分、低級烷氧基部分及低級烷

(111)

基團部分乃如上所述。其特定實例包括苄氧基甲基團、2-苄氧基乙基團及2-苄氧基丁基團。

吡啶基團（其可具有擇自低級烷醯基團及芳醯基團中之基團）之實例包括吡啶基團，其可具有1至3個（最好1個）擇自如上所述低級烷醯基團及如上所述芳醯基團中之基團。其特定實例包括2-或3-吡啶基團、1-乙醯基-(2-或3-)吡啶基團、1-丁醯基-(2-或3-)吡啶基團、及1-苯甲醯基-(2-或3-)吡啶基團。

吡啶基低級烷基團（其可具有擇自低級烷醯基團及芳醯基團中之基團）之實例包括吡啶基低級烷基團，其可具有1至3個（最好1個）擇自如上所述低級烷醯基團及如上所述芳醯基團中之基團且具有如上所述之低級烷基部分。其特定實例包括2-或3-吡啶基甲基團、2-(2-或3-吡啶基)乙基團、1-乙醯基-(2-或3-)吡啶基甲基團、1-丁醯基-(2-或3-)吡啶基甲基團、1-苯甲醯基-(2-或3-)吡啶基甲基團、2-[1-乙醯基-(2-或3-)吡啶基]乙基團、2-[1-丁醯基-(2-或3-)吡啶基]乙基團、及2-[1-苯甲醯基-(2-或3-)吡啶基]乙基團。

四唑基團之實例包括(1-或5-)四唑基團。

吡啶基團（其可具有酮基團）之實例包括吡啶基團，其可具有1至2個（最好1個）酮基團。其特定實例包括(1-，3-，5-，6-，7-，或8-)吡啶基團、2-酮基-(1-，3-，5-，6-，7-，或8-)吡啶基團、及2,3-二酮基-(1-，5-，6-，7-，或8-)吡啶基團。

(112)

三唑基團之實例包括 1,2,4-三唑基團及 1,3,5-三唑基團。

三唑基團（其可具有擇自低級烷基團及低級烷硫基團中之基團）之實例包括如上所述之三唑基團，其可具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自如上所述低級烷基團及如上所述低級烷硫基團中之基團。其特定實例包括（1-，3-，或 5-）-1,2,4-三唑基團、（1-，2-，或 5-）-1,3,5-三唑基團，1-甲基-5-甲硫基-1,2,4-三唑-3-基團及 1-甲基-5-甲硫基-1,2,3-三唑-2-基團。

咪唑基團（其可具有胺基甲醯基團）之實例包括咪唑基團，其可具有 1 至 2 個（最好 1 個）胺基甲醯基團。其特定實例包括（1-，2-，4-或 5-）咪唑基團及 4-胺基甲醯基-（1-，2-或 5-）咪唑基團。

噁唑基團（其可具有低級烷基團）之實例包括噁唑基團，其可具有 1 至 2 個（最好 1 個）如上所述低級烷基團。其特定實例包括（2-，3-，或 4-）噁唑基團及 4-甲基-（2-或 3-）噁唑基團。

異噻唑基團（其可具有低級烷基團）之實例包括異噻唑基團，其可具有 1 至 2 個（最好 1 個）如上所述低級烷基團。其特定實例包括（3-，4-，或 5-）異噻唑基團及（3-或 4-）甲基-2-異噻唑基團。

二氫苯並噻唑基團之實例包括（1-，2-，4-，5-，6-，或 7-）2,3-二氫苯並噻唑基團。

二氫苯並噻唑基團（其可具有酮基團）之實例包括二

(113)

氫苯並噻唑基團，其可具有單一之酮基團。其特定實例包括（1-，2-，5-，6-，7-或8-）2,3-二氫苯並噻唑基團及2-酮基（1-，5-，6-，7-或8-）2,3-二氫苯並噻唑基團。

噻吩基團（其可具有低級烷氧羰基團）之實例包括噻吩基團，其可具有1至2個（最好1個）如上所述之低級烷氧羰基團。其特定實例包括（2-或3-）噻吩基團及3-甲氧羰基-2-噻吩基團。

噁唑基低級烷基團（其可具有低級烷基團）之實例包括如上所述之噁唑基低級烷基團，彼之烷基團乃如上所述，且於噁唑環上具有1至3個（最好1至2個）如上所述低級烷基團。其特定實例包括（2-，4-，或5-）噁唑基甲基團、2-（2-，4-或5-）噁唑基甲基團、[2-甲基-（4-或5-）噁唑基]甲基團及（2,5-二甲基-4-噁唑基）甲基團。

胺基低級烷基團（其可於胺基團上具有擇自低級烷基團，經鹵素取代之低級烷基團，低級烷氧羰基團，低級烷醯基團，芳基團，芳基低級烷基團，芳醯基團，及經胺基取代之烷基團（經胺基取代之烷基團中之胺基團上，可存在低級烷基團以作為取代基）中之基團）之實例包括具有1至5個，最好1至3個，尤其1個胺基團之如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）。值得注意的是，胺基團上可存在1至2個擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）；

(114)

如上所述經鹵素取代之低級烷基團（最好為經 1 至 13 個，最好 1 至 7 個，尤其 1 至 3 個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述低級烷氧羰基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團）；

如上所述低級烷醯基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團）；

如上所述芳基團；

如上所述芳基低級烷基團；

如上所述芳醯基團；及

具有 1 至 5 個，最好 1 至 3 個，尤其 1 個胺基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）（胺基團上可存在 1 至 2 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基）中之取代基。胺基低級烷基團（其可於胺基團上具有擇自低級烷基團，經鹵素取代之低級烷基團，低級烷氧羰基團，低級烷醯基團，芳基團，芳基低級烷基團，芳醯基團，及經胺基取代之烷基團（經胺基取代之烷基團中之胺基團上，可存在低級烷基團以作為取代基）中之基團）之特定實例包括 N-甲胺基甲基團、N-乙胺基甲基團、N-正丙胺基甲基團、N,N-二甲胺基甲基團、N,N-二乙胺基甲基團、N-甲基-N-正丙胺基甲基團、N-甲基-N-乙胺基甲基團、N-（2,2,2-三氟乙基）胺基甲基團、N-甲基-N-苳胺基甲基團、N-苯胺基甲基團、N-甲基-N-苯胺基甲基

(115)

團、N-甲醯胺基甲基團、N-甲基-N-乙醯胺基甲基團、N-甲基-N-丙醯胺基甲基團、N-(2-(N,N-二乙胺基)胺基甲基團、N-甲基-N-苯甲醯基胺基甲基團、N-甲胺基乙基團、N-乙胺基乙基團、N-(2,2,2-三氟乙基)胺基乙基團、N,N-二甲胺基乙基團、N,N-二乙胺基乙基團、N-甲基-N-乙醯胺基乙基團、N-甲基-N-苯甲醯基胺基乙基團、N-甲基-N-丙醯胺基乙基團、N-甲基-N-苄胺基乙基團、及N-甲基-N-第三丁氧羰基胺基乙基團。

經胺基甲醯基團取代之低級烷基團（其可具有擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團）之實例包括經1至3個（最好1個）胺基甲醯基團取代之如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團），其可具有1至2個擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）；及

如上所述經鹵素取代之低級烷基團（最好為經1至13個，最好1至7個，尤其1至3個鹵素原子取代之具1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）中之基團。其特定實例包括胺基甲醯基甲基團、2-胺基甲醯基乙基團、1-胺基甲醯基乙基團、3-胺基甲醯基丙基團、4-胺基甲醯基丁基團、5-胺基甲醯基戊基團、6-胺基甲醯基己基團、1,1-二甲基-2-胺基甲醯基乙基團、2-甲基-3-胺基甲醯基丙基團、1,2-二胺基甲醯基乙基團、2,2-二胺基甲醯基乙基團、1,2,3-三胺基甲醯基丙基團、N-甲基胺基甲醯基甲基團、N-乙基胺

(116)

基甲醯基甲基團、2-(N-正丙基胺基甲醯基)乙基團、3-(N-正丁基胺基甲醯基)丙基團、4-(N-異丁基胺基甲醯基)丁基團、5-(N-第三丁基胺基甲醯基)戊基團、6-(N-戊基胺基甲醯基)己基團、N,N-二甲基胺基甲醯基甲基團、N,N-二乙基胺基甲醯基甲基團、2-(N-2-氟乙基胺基甲醯基)乙基團、3-(N-2-氯乙基胺基甲醯基)丙基團、4-(N-2-溴乙基胺基甲醯基)丁基團、2-(N-2,2-二氯乙基胺基甲醯基)乙基團、N-2,2,2-三氟乙基胺基甲醯基甲基團、及 N-七氟丙基胺基甲醯基甲基團。

硫代胺基甲醯基團(其可具有低級烷基團)之實例包括硫代胺基甲醯基團,其可具有1至2個如上所述低級烷基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括硫代胺基甲醯基團、N-甲基-硫代胺基甲醯基團、N-乙基-硫代胺基甲醯基團、N-正丙基-硫代胺基甲醯基團、N-正丁基-硫代胺基甲醯基團、N-正戊基-硫代胺基甲醯基團、N-正己基-硫代胺基甲醯基團、N-異丁基-硫代胺基甲醯基團、N-第三丁基-硫代胺基甲醯基團、N,N-二甲基-硫代胺基甲醯基團、及 N-甲基-N-乙基-硫代胺基甲醯基團。

噁唑啉基團(其可具有酮基團)之實例包括噁唑啉基團,其可具有1至2個(最好1個)酮基團。其特定實例包括噁唑啉-3-基團、噁唑啉-4-基團、噁唑啉-5-基團、2-酮基-噁唑啉-4-基團、2-酮基-噁唑啉-3-基團、及 2-酮基-噁唑啉-5-基團。

(117)

咪唑啉基團（其可具有擇自酮基團及低級烷基團中之基團）之實例包括咪唑啉基團，其可具有 1 至 3 個，最好 1 至 2 個擇自酮基團及如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）中之基團。其特定實例包括咪唑啉-1-基團、咪唑啉-2-基團、咪唑啉-4-基團、2-酮基-咪唑啉-1-基團、4-酮基-咪唑啉-1-基團、5-酮基-咪唑啉-1-基團、4-酮基-咪唑啉-2-基團、2-酮基-咪唑啉-4-基團、2-甲基-咪唑啉-1-基團、4-乙基-咪唑啉-1-基團、5-正丙基-咪唑啉-1-基團、4-正丁基-咪唑啉-2-基團、2-正戊基-咪唑啉-4-基團、2-正己基-咪唑啉-1-基團、4-異丁基-咪唑啉-2-基團、2-第三丁基-咪唑啉-4-基團、2-酮基-3-甲基-咪唑啉-1-基團、及 2-酮基-3,4-二甲基-咪唑啉-1-基團。

吡咯啉基團（其可具有酮基團）之實例包括吡咯啉基團，其可具有 1 至 2 個（最好 1 個）酮基團。其特定實例包括（1-，2-或 3-）吡咯啉基團、（2-或 3-）酮基-1-吡咯啉基團、（3-，4-或 5-）酮基-2-吡咯啉基團、及（2-，4-或 5-）酮基-3-吡咯啉基團。

咪唑基團之實例包括（1-，2-，4-或 5-）咪唑基團。

異噁唑基團之實例包括（3-，4-或 5-）異噁唑基團。

芳磺醯基團之實例包括芳磺醯基團且彼之芳基部分為苯基、聯苯基、經取代聯苯基、經取代苯基、萘基及經取代萘基，且其可於芳基部分上具有 1 至 7 個，最好 1 至 5 個，尤其 1 至 2 個具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團。



(118)

諸如苯基、聯苯基及萘基等之取代基之實例包括具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團、鹵素原子、胺基團等。於苯基、聯苯基及萘基等環上可存在一至七個，最好 1 至 5 個，尤其 1 至 2 個這些當中之至少一種型式之取代基。芳磺醯基團（其可於芳基團上具有低級烷基團）之特定實例包括苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）聯苯磺醯基團、（1-或 2-）萘磺醯基團、（2-，3-，或 4-）甲苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）乙苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正丙苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正丁苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正戊苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）正己苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）異丁苯磺醯基團、（2-，3-，或 4-）第三丁苯磺醯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-2-聯苯磺醯基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-3-聯苯磺醯基團、（2-，3-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）甲基-4-聯苯磺醯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙基-2-聯苯磺醯基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙基-3-聯苯磺醯基團、（2-，3-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）乙基-4-聯苯磺醯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）正丙基-2-聯苯磺醯基團、（2-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）正丙基-3-聯苯磺醯基團、（2-，3-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）正丙基-4-聯苯磺醯基團、（3-，4-，5-，6-，2'-，3'-，4'-，5'-，或 6'-）正丁

(119)

基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丁基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正丁基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正戊基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正戊基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正戊基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正己基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正己基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 正己基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 異丁基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 異丁基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 異丁基-4-聯苯磺醯基團、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 第三丁基-2-聯苯磺醯基團、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 第三丁基-3-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 或 6'-) 第三丁基-4-聯苯磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 甲基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 甲基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 乙基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 乙基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丙基-1-萘磺醯

(120)

基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丙基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丁基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正丁基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正戊基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正戊基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正己基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 正己基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 異丁基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 異丁基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 第三丁基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 第三丁基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 或 4-) 氨基苯磺醯基團、(2-, 3-, 或 4-) 氟基苯磺醯基團、(2-, 3-, 或 4-) 溴基苯磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氨基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氨基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氟基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 氟基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 溴基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 溴基-2-萘磺醯基團、(2-, 3-, 或 4-) 胺基苯磺醯基團、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 胺基-1-萘磺醯基團、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) 胺基-2-萘磺醯基團、2,3-二甲基苯磺醯基團、3,4-二甲基苯磺醯基團、2,4-二甲基苯磺醯基團、2,5-二甲基苯磺醯基團、2,6-

(121)

二甲基苯磺醯基團、2,4,6-三甲基苯磺醯基團、3,4,5-三甲基苯磺醯基團、2,3,4,5-四乙基苯磺醯基團、五甲基苯磺醯基團、2-甲基萘磺醯基團、2,3-二甲基萘磺醯基團、3,4-二甲基苯磺醯基團、3,5,7-三乙基萘磺醯基團、3,4,5,7-四甲基萘磺醯基團、2,3,4,5,7-五甲基萘磺醯基團、2,3,4,5,6,7-六乙基萘磺醯基團、七甲基萘磺醯基團、2,3-二胺基苯磺醯基團、2,4,6-三胺基苯磺醯基團、及 2-甲基-5-氨基萘磺醯基團。

六氫吡啶基團（其可具有擇自低級烷基團；低級烷醯基團；芳磺醯基團；酮基團；羥基團及胺基團（其可具有擇自低級烷基團，低級烷醯基團，低級烷氧羰基團及低級烷醯胺基低級烷醯基團中之基團）中之取代基）之實例包括六氫吡啶基團，其可具有 1 至 5 個，最好 1 至 3 個，尤其 1 個擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述低級烷醯基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團）；

如上所述芳磺醯基團；酮基團；羥基團；及胺基團（其可具有擇自如上所述低級烷基團，如上所述低級烷醯基團，如上所述低級烷氧羰基團及如上所述低級烷醯胺基低級烷醯基團中之基團）中之基團。其特定實例包括（1-，2-，3-，或 4-）六氫吡啶基團、1-甲基-4-六氫吡啶基團、2-乙基-4-六氫吡啶基團、3-正丙基-4-六氫吡啶基

(122)

團、4-異丙基-4-六氫吡啶基團、2-正丁基-1-六氫吡啶基團、3-異丁基-1-六氫吡啶基團、4-第三丁基-1-六氫吡啶基團、1-另丁基-2-六氫吡啶基團、2-正戊基-2-六氫吡啶基團、3-(1-乙基丙基)-2-六氫吡啶基團、4-異戊基-2-六氫吡啶基團、5-新戊基-2-六氫吡啶基團、6-正己基-2-六氫吡啶基團、1-(1,2,2-三甲基丙基)-3-六氫吡啶基團、2-(3,3-二甲基丁基)-3-六氫吡啶基團、3-(2-乙基丁基)-3-六氫吡啶基團、4-異己基-3-六氫吡啶基團、5-(3-甲基戊基)-3-六氫吡啶基團、6-甲醯基-3-六氫吡啶基團、1-乙醯基-4-六氫吡啶基團、2-丙醯基-4-六氫吡啶基團、3-丁醯基-4-六氫吡啶基團、4-異丁醯基-4-六氫吡啶基團、2-戊醯基-1-六氫吡啶基團、3-第三丁羧基-1-六氫吡啶基團、4-己醯基-1-六氫吡啶基團、1-苯磺醯基-2-六氫吡啶基團、2-(2-聯苯磺醯基)-2-六氫吡啶基團、3-(1-萘磺醯基)-2-六氫吡啶基團、1-甲苯磺醯基-4-六氫吡啶基團、4-(4-乙苯磺醯基)-2-六氫吡啶基團、5-(2-正丙苯磺醯基)-2-六氫吡啶基團、6-(3-正丁苯磺醯基)-2-六氫吡啶基團、1-(4-正戊苯磺醯基)-3-六氫吡啶基團、2-(2-正己苯磺醯基)-3-六氫吡啶基團、3-(3-異丁苯磺醯基)-3-六氫吡啶基團、4-(4-第三丁苯磺醯基)-3-六氫吡啶基團、5-(2-氯苯磺醯基)-3-六氫吡啶基團、6-(4-氟苯磺醯基)-3-六氫吡啶基團、1-(3-溴苯磺醯基)-4-六氫吡啶基團、2-(2-胺苯磺醯基)-4-六氫吡啶基團、3-(2,3-二甲苯磺醯基)-4-六氫吡啶基團、4-

(123)

( 3,4,5-三 甲 苯 磺 醯 基 ) -4-六 氫 吡 啶 基 團 、 2- ( 2,3-二 胺 苯 磺 醯 基 ) -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-酮 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 2-酮 基 -3-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-羥 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 2-羥 基 -3-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-胺 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 2-胺 基 -4-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-甲 胺 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 2-甲 胺 基 -4-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-乙 胺 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 2-乙 胺 基 -4-六 氫 吡 啶 基 團 、 2-二 甲 胺 基 -4-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-二 乙 胺 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-甲 醯 胺 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-乙 醯 胺 基 -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 4- ( N-甲 基 -N-乙 醯 胺 基 ) -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 4- ( N-甲 基 -N-甲 氧 羰 基 胺 基 ) -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 4- ( N-甲 基 -N-第 三 丁 氧 羰 基 胺 基 ) -1-六 氫 吡 啶 基 團 、 4-[N-甲 基 -N- ( N-乙 醯 胺 基 ) 乙 醯 胺 基 ]-1-六 氫 吡 啶 基 團 。

六 氫 吡 啶 基 羰 基 團 ( 其 可 具 有 擇 自

低 級 烷 基 團 , 羥 基 團 , 羥 基 低 級 烷 基 團 , 低 級 烷 醯 基 團 , 羰 基 低 級 烷 基 團 , 低 級 烷 基 胺 基 甲 醯 基 低 級 烷 基 團 , 胺 基 甲 醯 基 團 , 低 級 烷 氧 基 團 , 羰 基 團 , 低 級 烷 氧 羰 基 團 , 胺 基 團 ( 其 上 可 存 在 1 至 2 個 擇 自 低 級 烷 基 團 , 低 級 烷 醯 基 團 , 低 級 烷 氧 羰 基 團 及 芳 醯 基 團 中 之 基 團 ) , 六 氫 吡 啶 基 團 ( 其 上 可 存 在 擇 自 低 級 烷 醯 基 團 , 低 級 烷 氧 羰 基 團 及 芳 醯 基 團 中 之 基 團 ) , 六 氫 吡 咩 基 團 ( 其 上 可 存 在 低 級 烷 基 團 以 作 為 取 代 基 ) , 1,4-二 氧 雜 -8-氮 雜 螺 [4.5]癸 基 團 , 嗎 啉 基 團 , 六 氫 -1,4-二 氮 雜 草 基 團 ( 其 上 可 存 在 低 級 烷 基 團 以 作 為 取 代 基 ) , 吡 啶 基 團 , 吡 啶 氧 基 團 , 吡 啶 基

(124)

低級烷氧基團，四氫喹啉基團（其上可存在酮基團），苯並二噁茂基團，芳基低級烷氧基團（其可於芳基團上具有擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷氧基團中之基團），芳基團（其上可存在擇自鹵素原子，低級烷氧基團及羥基團中之基團），芳氧基團（其可於芳基團上具有擇自氰基團，鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），芳基低級烷基團（其可於芳基團上具有擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），及芳醯基團（其可於芳基團上具有擇自鹵素原子及低級烷氧基團中之基團）中之基團）之實例包括

六氫吡啶基羰基團，其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

羥基團；

如上所述羥基低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子及具 1 至 3 個羥基團之直或支鏈烷基團）；

如上所述低級烷醯基團；

如上所述羰基低級烷基團，其具有如上所述低級烷基部分；

具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團且經胺基甲醯基團（具有 1 至 2 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團））取代；

(125)

胺基甲醯基團；

如上所述低級烷氧基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）；

羧基團；

如上所述低級烷氧羰基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團）；

胺基團（其上可存在 1 至 2 個擇自如上所述低級烷基團，如上所述低級烷醯基團，如上所述低級烷氧羰基團及如上所述芳醯基團中之基團）；

六氫吡啶基團（其上可存在 1 至 3 個（最好 1 個）擇自如上所述低級烷醯基團，如上所述低級烷氧羰基團及如上所述芳醯基團中之基團）；

六氫吡嗪基團（其上可存在 1 至 3 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基）；

1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基團；

嗎啉基團；

六氫-1,4-二氮雜草基團（其上可存在 1 至 3 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基）；

吡啶基團；

吡啶氧基團；

吡啶基低級烷氧基團，其具有如上所述之低級烷氧基部分；



(126)

四氫喹啉基團（其上可存在 1 至 2 個（最好 1 個）酮基團）；

苯並二噁茂基團（最好為苯並[1.3]二噁茂基團）；

芳基低級烷氧基團，其具有如上所述之芳基部分及低級烷氧基部分（其可於芳基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自如上所述鹵素原子，如上所述低級烷基團，如上所述低級烷氧基團及如上所述經鹵素取代之低級烷氧基團中之基團）；

如上所述芳基團（芳基團上可存在 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自如上所述鹵素原子，如上所述低級烷氧基團及如上所述羥基團中之基團）；

芳氧基團，其具有如上所述之芳基部分（其可於芳基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自氰基團，鹵素原子，如上所述低級烷基團，如上所述低級烷氧基團及如上所述經鹵素取代之低級烷基團中之基團）；

芳基低級烷基團，其具有如上所述之芳基部分及低級烷基部分（其可於芳基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團）；及

如上所述芳醯基團（其可於芳基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自如上所述鹵素原子及如上所述低級烷氧基團中之基團）中之基團）。其特定實例包括（1-，2-，3-，或 4-）六氫吡啶基羰基團、（1-，2-，3-，或 4-）乙基-4-六氫吡啶基羰基團、（2-，3-，或 4-）甲基-1-

(127)

六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 甲基-  
 2-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 甲  
 基-3-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 甲基-4-  
 六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 羥基-1-六氫吡啶基  
 羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 羥基-2-六氫吡啶  
 基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 羥基-3-六氫吡  
 啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 羥基-4-六氫吡啶基羰  
 基團、(2-, 3-, 或 4-) 羥甲基-1-六氫吡啶基羰基團、  
 (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 羥甲基-2-六氫吡啶基羰基  
 團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 羥甲基-3-六氫吡啶基  
 羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 羥甲基-4-六氫吡啶基羰基  
 團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) (2-羥乙基)-4-六氫吡啶基羰  
 基團、(2-, 3-, 或 4-) (N-乙基-胺基甲醯基甲基)-1-  
 六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (N-  
 乙基-胺基甲醯基甲基)-2-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-  
 , 3-, 4-, 5-, 或 6-) (N-乙基-胺基甲醯基甲基)-3-六  
 氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) N-乙基-胺基甲醯  
 基甲基-4-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 胺基甲醯  
 基-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-)   
 胺基甲醯基-2-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-  
 , 或 6-) 胺基甲醯基-3-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-  
 , 或 4-) 胺基甲醯基-4-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或  
 4-) 羧基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 羧甲  
 基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙氧羰基-1-

(128)

六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 甲氧基-1-六氫吡啶  
 基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 甲氧基-2-六氫  
 吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 甲氧基-3-  
 六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 甲氧基-4-六氫  
 吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 甲氧羰基-1-六氫吡啶基  
 羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 甲氧羰基-2-六氫  
 吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 甲氧羰基-  
 3-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 甲氧羰基-4-  
 六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙氧羰基-1-六氫吡  
 啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 乙氧羰基-2-  
 六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 乙氧  
 羰基-3-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 乙氧羰  
 基-4-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙醯胺基-1-  
 六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 乙醯  
 胺基-2-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-  
 ) 乙醯胺基-3-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 乙  
 醯胺基-4-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 第三丁  
 氧羰基胺基-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-  
 , 或 6-) 第三丁氧羰基胺基-2-六氫吡啶基羰基團、(1-  
 , 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 第三丁氧羰基胺基-3-六氫吡啶  
 基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) 第三丁氧羰基胺基-4-六  
 氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 丁醯胺基-1-六氫吡啶  
 基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 苯甲醯基胺基-1-六氫吡啶基  
 羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (N-甲基-N-乙醯胺基)-1-六

(129)

氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (N-甲基-N-丁醯胺基)-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (N-甲基-N-第三丁氧羰基胺基)-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (N-甲基-N-苯甲醯基胺基)-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-2-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-3-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-4-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [1-乙醯基-(2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [1-丁醯基-(2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [1-第三丁氧羰基-(2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [1-苯甲醯基-(2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-六氫吡啶基)-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [1-(3,4-二甲基六氫吡啶基)]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [1-(3,4-二甲基六氫吡啶基)]-2-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [1-(3,4-二甲基六氫吡啶基)]-3-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-) [1-(3,4-二甲基六氫吡啶基)]-4-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [1-(4-甲基六氫吡啶基)]-1-六氫吡啶基羰基

(130)

團、(1-, 3-, 或 4-)[1-(4-甲基六氫吡咩基)]-2-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 或 4-)[1-(4-甲基六氫吡咩基)]-3-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 或 3-)[1-(4-甲基六氫吡咩基)]-4-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)嗎啉基]-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)嗎啉基]-2-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 4-, 5-, 或 6-)[(2-, 3-, 或 4-)嗎啉基]-3-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 或 3-)[(2-, 3-, 或 4-)嗎啉基]-4-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 或 7-)(4-甲基-六氫-1,4-二氮雜草基)-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-)(4-甲基-六氫-1,4-二氮雜草基)-2-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-)(4-甲基-六氫-1,4-二氮雜草基)-3-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-)(4-甲基-六氫-1,4-二氮雜草基)-4-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基)-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-)(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基)-2-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-)(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基)-3-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 或 4-)(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基)-4-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 4-, 或 5-)苯並[1.3]二噁茂基]-1-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[2-酮基-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-)-1,2,3,4-四氫喹啉基]-1-六氫吡

(131)

啖基羰基團、4-[2-酮基-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-  
 )-1,2,3,4-四氫喹啉基]-(2-或 3-甲基)-1-六氫吡啖基羰  
 基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)吡啖基]-1-六  
 氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)吡  
 啖氧基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-,  
 3-, 或 4-)吡啖基甲氧基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-,  
 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)氟基苄氧基]-1-六氫吡啖基  
 羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)氯基苄氧  
 基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-,  
 或 4-)溴基苄氧基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或  
 4-)[(2-, 3-, 或 4-)甲基苄氧基基]-1-六氫吡啖基羰基  
 團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)三氟甲氧基苄氧  
 基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)(3,4-二氯苄  
 氧基)-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)(3,4-二  
 甲氧基苄氧基)-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)  
 (3-氯基-4-甲氧基苄氧基)-1-六氫吡啖基羰基團、(2-  
 , 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)氟基苯氧基]-1-六氫吡啖  
 基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)氯基苯氧  
 基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-,  
 或 4-)氟基苯氧基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或  
 4-)[(2-, 3-, 或 4-)甲氧基苯氧基]-1-六氫吡啖基羰基  
 團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)甲基苯氧基]-1-  
 六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或 4-)[(2-, 3-, 或 4-)  
 三氟甲氧基苯氧基]-1-六氫吡啖基羰基團、(2-, 3-, 或

(132)

4-) 苯基-1-六氫吡啶基羰基團、4-羥基-(2-, 3-, 或 4-) 苯基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 氯苯基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 甲氧基苯基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 羥基苯氧基]-1-六氫吡啶基羰基團、4-羥基-(2-, 3-, 或 4-) 苯基-1-六氫吡啶基羰基團、4-乙氧羰基-(2-, 3-, 或 4-) 苯基-1-六氫吡啶基羰基團、4-羥基-(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 氯苯基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 苄基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 氯苄基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 甲苄基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 甲氧基苄基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 三氟甲氧基苄基]-1-六氫吡啶基羰基團、4-羥基-(2-, 3-, 或 4-) 苄基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 氯基苯甲醯基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 甲氧基苯甲醯基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 氟基苯甲醯基]-1-六氫吡啶基羰基團、及 (2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 三氟甲氧基苄基]-1-六氫吡啶基羰基團。

吡咯啶基羰基團 (其可具有擇自羥基低級烷基團, 胺基甲醯基團, 羥基團, 胺基團 (其上可具有擇自低級烷基

(133)

團，低級烷醯基團及芳醯基團中之基團），嗎啉基低級烷基團，吡啶基低級烷基團，六氫吡啶基低級烷基團，六氫吡咩基低級烷基團（其上可具有低級烷基團以作為取代基），胺基低級烷基團（其上可具有低級烷基團以作為取代基），及芳氧基團（芳基團上可具有經鹵素取代之低級烷氧基團），芳氧基低級烷基團（芳基團上可存在經鹵素取代之低級烷氧基團），及四氫喹啉基團（其上可存在酮基團）中之基團）之實例包括吡咯啶基羰基團，其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自

具 1 至 3 個羥基團之如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

胺基甲醯基團；

羥基團；

胺基團（其可具有 1 至 2 個擇自如上所述低級烷基團，如上所述低級烷醯基團，及如上所述芳醯基團中之基團）；

嗎啉基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

吡咯啶基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

六氫吡啶基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

六氫吡咩基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團（六



(134)

氫吡咩基團上可存在 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基）；

胺基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團（胺基團上可存在 1 至 2 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基）；

芳氧基團，其具有如上所述之芳基部分（其可於芳基團上具有 1 至 3 個（最好 1 個）經鹵素取代之低級烷氧基團）；

芳氧基低級烷基團，其具有如上所述之芳基部分及低級烷基部分（其可於芳基團上具有 1 至 3 個（最好 1 個）經鹵素取代之低級烷氧基團）；及四氫喹啉基團（其上可存在單一之酮基團）中之基團。其特定實例包括（1-，2-，或 3-）吡咯啉基羰基團、（2-，或 3-）羥甲基-1-吡咯啉基羰基團、（1-，2-，3-，4-，或 5-）羥甲基-2-吡咯啉基羰基團、（1-，2-，3-，4-，或 5-）羥甲基-3-吡咯啉基羰基團、（2-，或 3-）胺基甲醯基-1-吡咯啉基羰基團、（1-，2-，3-，4-，或 5-）胺基甲醯基-2-吡咯啉基羰基團、（1-，2-，3-，4-，或 5-）胺基甲醯基-3-吡咯啉基羰基團、（2-，或 3-）羥基-1-吡咯啉基羰基團、（1-，2-，3-，4-，或 5-）羥基-2-吡咯啉基羰基團、（1-，2-，3-，4-，或 5-）羥基-3-吡咯啉基羰基團、（2-，或 3-）胺基-1-吡咯啉基羰基團、（2-，或 3-）乙醯胺基-1-吡咯啉基羰

(135)

基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) 乙醯胺基-2-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) 乙醯胺基-3-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) 丁醯胺基-3-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) (N-甲基-N-乙醯胺基)-3-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) (N-甲基-N-丁醯胺基)-3-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) 苯甲醯基胺基-3-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) (N-甲基-N-苯甲醯基胺基)-3-吡咯啉基羰基團、(2-, 或 3-) [(2-, 3-, 或 4-) 嗎啉基甲基]-1-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) [(2-, 3-, 或 4-) 嗎啉基甲基]-2-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) [(2-, 3-, 或 4-) 嗎啉基甲基]-3-吡咯啉基羰基團、(2-, 或 3-) [(1-, 2-, 或 3-) 吡咯啉基甲基]-1-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) [(1-, 2-, 或 3-) 吡咯啉基甲基]-2-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) [(1-, 2-, 或 3-) 吡咯啉基甲基]-3-吡咯啉基羰基團、(2-, 或 3-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基甲基]-1-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基甲基]-2-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) [(1-, 2-, 3-, 或 4-) 六氫吡啶基甲基]-3-吡咯啉基羰基團、(2-, 或 3-) (4-甲基-1-六氫吡啶基甲基)-1-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) (4-甲基-1-六氫吡啶基甲基)-2-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) (4-甲基-1-六氫吡啶基甲

(136)

基) -3-吡咯啉基羰基團、(2-, 或 3-) N,N-二甲胺基甲基 -1-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) N,N-二甲胺基甲基 -2-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) N,N-二甲胺基甲基 -3-吡咯啉基羰基團、(2-, 或 3-) N,N-二乙胺基甲基 -1-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) N,N-二乙胺基甲基 -2-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) N,N-二乙胺基甲基 -3-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) (4-三氟甲氧基苯氧基甲基) -3-吡咯啉基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 或 5-) (4-三氟甲氧基苯氧基) -3-吡咯啉基羰基團、及(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 或 8-) (2-氧基-1,2,3,4-四氫喹啉基) -3-吡咯啉基羰基團。

六氫吡嗪基羰基團(其可具有擇自低級烷基團, 環C3-C8 烷基團, 低級烷醯基團, 羥基低級烷基團, 低級烷氧基低級烷基團, 低級烷氧羰基團, 胺基低級烷基團(胺基團上可存在低級烷基團以作為取代基), 六氫吡啶基低級烷基團(六氫吡啶基團上可存在低級烷基團以作為取代基), 嗎啉基低級烷基團, 吡咯啉基低級烷基團, 1,3-二噁茂烷基低級烷基團, 四氫呋喃基低級烷基團, 吡啶基低級烷基團(低級烷基團上可存在苯基團以作為取代基), 咪唑基低級烷基團, 呋喃基低級烷基團, 吡咯啉基羰基低級烷基團, 六氫吡啶基團(其可具有低級烷基團以作為取代基), 吡啶基團(吡啶基團上可存在擇自低級烷基團, 氰基團, 及經鹵素取代之低級烷基團中之基團以作為取代

(137)

基)，噻吩並[2,3-*c*]吡啶基團，芳基團（其上可存在擇自鹵素原子及低級烷基團中之基團），芳醯基團，呋喃基低級烷基團，芳基低級烷氧羰基團及酮基團中之基團）之實例包括六氫吡啶基羰基團，其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自

如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述環 C3-C8 烷基團；

如上所述低級烷醯基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷醯基團）；

如上所述羥基低級烷基團（最好為含 1 至 3 個羥基團之具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述低級烷氧基低級烷基團（最好為含 1 至 3 個如上所述低級烷氧基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團）之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）；

如上所述低級烷氧羰基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧羰基團）；

胺基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團（胺基團上可存在 1 至 2 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基）；

六氫吡啶基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團（六

(138)

氫吡啶基團上可存在 1 至 3 個如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）以作為取代基）；

嗎啉基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

吡咯啶基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

1,3-二噁茂烷基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

四氫呋喃基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

吡啶基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團（烷基團上可存在 1 至 3 個苯基團以作為取代基）；

咪唑基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

呋喃基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

吡咯啶基羰基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述者，最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團；

六氫吡啶基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團））；

(139)

吡啶基團（吡啶基團上可存在 1 至 3 個（最好 1 個）擇自如上所述低級烷基團（最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團），氰基團，及如上所述經鹵素取代之低級烷基團（最好為經 1 至 7 個鹵素原子取代之具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團）中之基團）；

噻吩並 [2,3-*c*] 吡啶基團；

如上所述芳基團（芳基團上可存在 1 至 3 個（最好 1 個）擇自鹵素原子及低級烷基團中之基團）；

如上所述芳醯基團；

呋喃基低級烷基團，其具有如上所述之低級烷基部分；

芳基低級烷氧羰基團，其具有如上所述之芳基部分及低級烷氧羰基部分；

及酮基團中之取代基。其特定實例包括（1-或 2-）六氫吡嗪基羰基團、（2-，3-，或 4-）甲基-1-六氫吡嗪基羰基團、（1-，2-，3-，4-，5-，或 6-）甲基-2-六氫吡嗪基羰基團、（2-，3-，或 4-）乙基-1-六氫吡嗪基羰基團、（1-，2-，3-，4-，5-，或 6-）乙基-2-六氫吡嗪基羰基團、（2-，3-，或 4-）正丙基-1-六氫吡嗪基羰基團、（1-，2-，3-，4-，5-，或 6-）正丙基-2-六氫吡嗪基羰基團、（2-，3-，或 4-）正丁基-1-六氫吡嗪基羰基團、（1-，2-，3-，4-，5-，或 6-）正丁基-2-六氫吡嗪基羰基團、（2-，3-，或 4-）[（1-乙基-正丙基）]-1-六氫吡嗪基羰基團、（1-，2-，3-，4-，5-，或 6-）[（1-乙基-正丙基）]-

(140)

2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 異丙基-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 異丙基-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 第三丁基-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 第三丁基-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 正己基-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 正己基-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 環戊基-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 環戊基-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 環庚基-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 環庚基-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙醯基-1-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 丁醯基-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 乙醯基-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-羥乙基)-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (2-羥乙基)-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-甲氧基乙基)-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (2-甲氧基乙基)-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-甲氧基丙基)-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (3-甲氧基丙基)-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (4-甲氧基丁基)-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (4-甲氧基丁基)-2-六氫吡咻基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 乙氧羰基-1-六氫吡咻基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 乙氧羰基-2-六氫吡咻基羰

(141)

基團、(2-, 3-, 或 4-) 第三丁氧羰基-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 第三丁氧羰基-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) 甲氧羰基-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) 甲氧羰基-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [3-(N,N-二甲胺基)丙基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [3-(N,N-二甲胺基)丙基]-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(N,N-二甲胺基)乙基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(N,N-二甲胺基)乙基]-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(1-六氫吡啶基)乙基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(1-六氫吡啶基)乙基]-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(1-甲基-3-六氫吡啶基)甲基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [(1-甲基-3-六氫吡啶基)甲基]-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(1-甲基-4-六氫吡啶基)甲基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [(1-甲基-4-六氫吡啶基)甲基]-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(4-嗎啉基)乙基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(4-嗎啉基)乙基]-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(1-吡咯啶基)乙基]-1-六氫吡啶基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(1-吡咯啶基)乙基]-2-六氫吡啶基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(1,3-二噁茂烷基)甲基]-1-六氫吡啶基羰基



(142)

團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(1,3-二噁茂烷基) 甲基]-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) {2-[2-(1,3-二噁茂烷基)] 乙基}-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) {2-[2-(1,3-二噁茂烷基)] 乙基}-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-四氫呋喃基甲基)-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (2-四氫呋喃基甲基)-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (2-吡啶基甲基)-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (2-吡啶基甲基)-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-吡啶基甲基)-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (3-吡啶基甲基)-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (4-吡啶基甲基)-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (4-吡啶基甲基)-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(4-吡啶基) 乙基]-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(4-吡啶基) 乙基]-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(2-吡啶基) 乙基]-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(2-吡啶基) 乙基]-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-苯基-2-(4-吡啶基) 乙基]-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-苯基-2-(4-吡啶基) 乙基]-2-六氫吡咩基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [2-(1-咪唑基) 乙基]-1-六氫吡咩基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [2-(1-咪唑基) 乙基]-2-六氫吡

(143)

吡基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-呋喃基甲基) -1-六氫  
 吡基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (3-呋喃  
 基甲基) -2-六氫吡基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-吡  
 咯啉基羰基甲基) -1-六氫吡基羰基團、(1-, 2-, 3-,  
 4-, 5-, 或 6-) (1-吡咯啉基羰基甲基) -2-六氫吡基羰  
 基團、(2-, 3-, 或 4-) (1-甲基-4-六氫吡啉基) -1-六  
 氫吡基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (1-甲  
 基-4-六氫吡啉基) -2-六氫吡基羰基團、(2-, 3-, 或  
 4-) [(2-, 3-, 或 4-) 吡啉基] -1-六氫吡基羰基團、  
 (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [(2-, 3-, 或 4-) 吡啉  
 基] -2-六氫吡基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-氰基-2-  
 吡啉基) -1-六氫吡基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-,  
 或 6-) (3-氰基-2-吡啉基) -2-六氫吡基羰基團、(2-  
 , 3-, 或 4-) {4-甲基-2-吡啉基} -1-六氫吡基羰基團、  
 (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (4-甲基-2-吡啉基) -2-六  
 氫吡基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) (3-甲基-2-吡啉  
 基) -1-六氫吡基羰基團、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-  
 ) (3-甲基-2-吡啉基) -2-六氫吡基羰基團、(2-, 3-,  
 或 4-) (3-三氟甲基-2-吡啉基) -1-六氫吡基羰基團、  
 (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) (3-三氟甲基-2-吡啉基) -  
 2-六氫吡基羰基團、(2-, 3-, 或 4-) [(2-, 3-, 4-,  
 5-, 或 6-) 噻吩並[2,3-c]吡啉基] -1-六氫吡基羰基團、  
 (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-) [(2-, 3-, 4-, 5-, 或 6-  
 ) 噻吩並[2,3-c]吡啉基] -2-六氫吡基羰基團、(2-, 3-

(144)

，或 4-) 苯基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-，3-，或 4-)  
 [(2-，3-，或 4-) 氯苯基]-1-六氫吡啶基羰基團、(2-，  
 3-，或 4-)[(2-，3-，或 4-) 甲苯基]-1-六氫吡啶基羰基  
 團、3-酮基-(2-或 4-) 苯基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-  
 ，3-，或 4-) 苯甲醯基-1-六氫吡啶基羰基團、(2-，3-，  
 或 4-)[(2-，或 3-) 呋喃羰基]-1-六氫吡啶基羰基團、及  
 (2-，3-，或 4-) 苄氧羰基-1-六氫吡啶基羰基團。

六氫氮雜草基羰基團之實例包括(1-，2-，3-，或 4-  
 ) 六氫氮雜草基羰基團。

六氫-1,4-二氮雜草基羰基團(其可具有擇自低級烷基  
 團及吡啶基團中之取代基)之實例包括六氫-1,4-二氮雜草  
 基羰基團，其可具有 1 至 3 個，最好 1 個，擇自如上所述  
 低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基  
 團)及吡啶基團中之取代基。其特定實例包括(六氫-1,4-  
 二氮雜草-(1-，2-，5-，或 6-) 基)羰基團、(4-甲基-  
 六氫-1,4-二氮雜草-1-基)羰基團、及(4-(4-吡啶基)-  
 甲基-六氫-1,4-二氮雜草-1-基)羰基團。

二氫吡咯基羰基團之實例包括 2,3-二氫吡咯基羰基團  
 及 2,5-二氫吡咯基羰基團。

二氫吡咯基羰基團(其可具有低級烷基團)之實例包  
 括如上所述二氫吡咯基羰基團，其可具有 1 至 4 個，最好  
 1 至 2 個如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原  
 子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括(1-，2-，或 3-  
 )(2,5-二氫吡咯基羰基)團、2,5-二甲基-1-(2,5-二氫

(145)

吡咯基羰基)團、及 2,5-二甲基-1-(2,3-二氫吡咯基羰基)團。

硫代嗎啉基羰基團之實例包括(2-, 3-, 或 4-)硫代嗎啉基羰基團。

嗎啉基羰基團(其可具有擇自低級烷基團、六氫吡啶基低級烷基團、及芳基團中之基團)之實例包括嗎啉基羰基團,其可具有 1 至 5 個,最好 1 至 2 個擇自如上所述低級烷基團(最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團)(其上可存在 1 至 3 個(最好 1 個)六氫吡啶基團以作為取代基)及如上所述芳基團中之基團。其特定實例包括(2-, 3-, 或 4-)嗎啉基羰基團、2,6-二甲基-4-嗎啉基羰基團、2-(1-六氫吡啶基甲基)-4-嗎啉基羰基團、及 2-苯基-4-嗎啉基羰基團。

噻唑啶基羰基團之實例包括(2-, 3-, 4-, 或 5-)噻唑啶基羰基團。

噻唑啶基羰基團(其可具有芳基團且芳基團可具有擇自低級烷氧基團及氰基團中之基團)之實例包括噻唑啶基羰基團,其可具有 1 至 3 個(最好 1 個)芳基團且芳基團可具有 1 至 3 個(最好 1 個)擇自如上所述低級烷氧基團及氰基團中之基團。其特定實例包括(2-, 3-, 4-, 或 5-)噻唑啶基羰基團、(2-, 4-, 或 5-)[(2-, 3-, 或 4-)甲氧基苯基]-3-噻唑啶基羰基團及(2-, 4-, 或 5-)[(2-, 3-, 或 4-)氰苯基]-3-噻唑啶基羰基團。

氮雜二環[3.2.2]壬基羰基團之實例包括 1-氮雜二環

(146)

[3.2.2]壬 - ( 2- , 3- , 5- , 或 6- ) 基 羰 基 團 、 2-氮 雜 二 環  
 [3.2.2]壬 - ( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 或 7- ) 基 羰 基 團 、  
 3-氮 雜 二 環 [3.2.2]壬 - ( 1- , 2- , 3- , 或 6- ) 基 羰 基 團 、 及  
 6-氮 雜 二 環 [3.2.2]壬 - ( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 8-  
 或 9- ) 基 羰 基 團 。

氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 基 羰 基 團 ( 其 可 具 有 經 鹵 素 取 代 或  
 未 經 取 代 之 芳 氧 基 團 ) 之 實 例 包 括 氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 基 羰  
 基 團 , 其 可 具 有 1 至 2 個 ( 最 好 1 個 ) 如 上 所 述 經 鹵 素 取  
 代 之 芳 基 團 ( 最 好 為 可 經 1 至 3 個 , 最 好 1 個 鹵 素 原 子 取  
 代 芳 基 團 ) , 或 者 包 括 氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 基 羰 基 團 , 其 可  
 具 有 1 至 2 個 ( 最 好 1 個 ) 如 上 所 述 未 經 取 代 之 芳 基 團 。  
 其 特 定 實 例 包 括 1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 - ( 2- , 3- , 4- , 5- ,  
 6- , 7- , 或 8- ) 基 羰 基 團 、 2-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 - ( 1- , 2-  
 , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 基 羰 基 團 、 3-氮 雜 二 環  
 [3.2.1]辛 - ( 1- , 2- , 3- , 6- , 或 8- ) 基 羰 基 團 、 6-氮 雜 二  
 環 [3.2.1]辛 - ( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) 基 羰  
 基 團 、 8-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 - ( 1- , 2- , 3- , 6- , 或 8- )  
 基 羰 基 團 、 3- ( 苯 氧 基 ) -1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 -2-基 羰 基  
 團 、 3- ( 2-聯 苯 氧 基 ) - 1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 -3-基 羰 基  
 團 、 3- ( 1-萘 氧 基 ) - 1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 -4-基 羰 基 團 、  
 3- ( 3-甲 基 苯 氧 基 ) -1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 -5-基 羰 基 團 、 3-  
 ( 4-乙 基 苯 氧 基 ) -1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 -6-基 羰 基 團 、 3-  
 ( 2-正 丙 基 苯 氧 基 ) -1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 -7-基 羰 基 團 、 3-  
 ( 3-正 丁 基 苯 氧 基 ) -1-氮 雜 二 環 [3.2.1]辛 -8-基 羰 基 團 、 3-

(147)

( 4-正戊基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -1-基羰基團、 3-( 2-正己基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -2-基羰基團、 3-( 3-異丁基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -3-基羰基團、 3-( 4-第三丁基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -4-基羰基團、 3-( 2-氯基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -5-基羰基團、 3-( 3-氟基苯氧基 ) -8-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -8-基羰基團、 3-( 3-溴基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -6-基羰基團、 3-( 2-胺基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -7-基羰基團、 3-( 2,3-二甲基苯氧基 ) -2-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -8-基羰基團、 3-( 3,4,5-三甲基苯氧基 ) -8-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -1-基羰基團、及 3-( 2,3-二胺基苯氧基 ) -8-氮雜二環 [3.2.1] 辛 -2-基羰基團。

吡啶基羰基團之實例包括 ( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 或 7- ) 吡啶基羰基團。

四氫吡啶並 [3.4-b] 吡啶基羰基團之實例包括 ( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 8- , 或 9- ) ( 2-,3-,4-,9-四氫吡啶並 [3.4-b] 吡啶基羰基 ) 團。

六氫吡啶基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有低級烷基團 ) 之實例包括六氫吡啶基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述之低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 且六氫吡啶基團上可存在 1 至 7 個，最好 1 至 5 個，尤其 1 個如上所述之低級烷基團 ( 最好為具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團 ) 。其特定實例包括 ( 1-或 2- ) 六氫吡啶基甲基團、 2-[ ( 1-或 2-

(148)

) 六氫吡咩基]乙基團、1-[ (1-或2-) 六氫吡咩基]乙基團、3-[ (1-或2-) 六氫吡咩基]丙基團、4-[ (1-或2-) 六氫吡咩基]丁基團、5-[ (1-或2-) 六氫吡咩基]戊基團、6-[ (1-或2-) 六氫吡咩基]己基團、1,1-二甲基-2-[ (1-或2-) 六氫吡咩基]乙基團、2-甲基-3-[ (1-或2-) 六氫吡咩基]丙基團、4-甲基-1-六氫吡咩基甲基團、2-(4-甲基-2-六氫吡咩基)乙基團、3-(2-乙基-1-六氫吡咩基)丙基團、4-(3-正丙基-1-六氫吡咩基)丁基團、5-(4-正丁基-1-六氫吡咩基)戊基團、6-(1-正戊基-2-六氫吡咩基)己基團、2-正己基-2-六氫吡咩基甲基團、2-(3-異丁基-2-六氫吡咩基)乙基團、及3-(4-第三丁基-2-六氫吡咩基)丙基團。

嗎啉基羰基低級烷基團之實例包括嗎啉基羰基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述之低級烷基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團)。其特定實例包括2-嗎啉基羰基甲基團、3-嗎啉基羰基甲基團、4-嗎啉基羰基甲基團、2-(2-嗎啉基羰基)乙基團、2-(3-嗎啉基羰基)乙基團、2-(4-嗎啉基羰基)乙基團、1-(2-嗎啉基羰基)乙基團、1-(3-嗎啉基羰基)乙基團、1-(4-嗎啉基羰基)乙基團、3-(2-嗎啉基羰基)丙基團、3-(3-嗎啉基羰基)丙基團、3-(4-嗎啉基羰基)丙基團、4-(2-嗎啉基羰基)丁基團、4-(3-嗎啉基羰基)丁基團、4-(4-嗎啉基羰基)丁基團、5-(2-嗎啉基羰基)戊基團、5-(3-嗎啉基羰基)戊基團、5-(4-嗎啉基羰基)

(149)

戊基團、6-(2-嗎啉基羰基)己基團、6-(3-嗎啉基羰基)己基團、6-(4-嗎啉基羰基)己基團、3-甲基-3-(2-嗎啉基羰基)丙基團、3-甲基-3-(3-嗎啉基羰基)丙基團、3-甲基-3-(4-嗎啉基羰基)丙基團、1,1-二甲基-2-(2-嗎啉基羰基)乙基團、1,1-二甲基-2-(3-嗎啉基羰基)乙基團、1,1-二甲基-2-(4-嗎啉基羰基)乙基團。

六氫吡啶基羰基低級烷基團（其可於六氫吡啶基團上具有低級烷基團）之實例包括六氫吡啶基羰基低級烷基團且彼之低級烷基部分為如上所述之低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）且其可具有於六氫吡啶基團上具有1至7個，最好1至5個，尤其1個如上所述之低級烷基團（最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷基團）。其特定實例包括（1-或2-）六氫吡啶基羰基甲基團、2-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]乙基團、1-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]乙基團、3-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]丙基團、4-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]丁基團、5-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]戊基團、6-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]己基團、1,1-二甲基-2-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]乙基團、2-甲基-3-[(1-或2-)六氫吡啶基羰基]丙基團、4-甲基-1-六氫吡啶基羰基甲基團、2-(4-甲基-2-六氫吡啶基羰基)乙基團、3-(2-乙基-1-六氫吡啶基羰基)丙基團、4-(3-正丙基-1-六氫吡啶基羰基)丁基團、5-(4-正丁基-1-六氫吡啶基羰基)戊基團、6-(1-正戊基-2-六氫吡啶基羰基)己基團、2-正己基-2-六氫吡啶基羰基



(150)

甲基團、2-(3-異丁基-2-六氫吡咩基羰基)乙基團、及3-(4-第三丁基-2-六氫吡咩基羰基)丙基團。

胺基低級烷氧基團(於胺基團上可存在低級烷基團)包括具有1至5個(最好1個)胺基團之如上所述之低級烷氧基團(最好為具有1至6個碳原子之直或支鏈烷氧基團)且胺基團上可具有1至2個如上所述低級烷基團。其特定實例包括胺基甲氧基團、2-胺基乙氧基團、1-胺基乙氧基團、3-胺基丙氧基團、4-胺基丁氧基團、5-胺基戊氧基團、6-胺基乙氧基團、1,1-二甲基-2-胺基乙氧基團、N,N-二甲胺基甲氧基團、N-甲基-N-乙胺基甲氧基團、N-甲胺基甲氧基團、2-(N-甲胺基)乙氧基團、2-(N,N,-二甲胺基)乙氧基團、2-(N,N,-二乙胺基)乙氧基團、2-(N,N,-二異丙胺基)乙氧基團、及3-(N,N,-二甲胺基)丙氧基團。

低級烷氧基低級烷氧基團之實例包括具有如上所述低級烷氧基部分之低級烷氧基低級烷氧基團。其特定實例包括甲氧基甲基團、2-甲氧基乙基團、1-乙氧基乙氧基團、2-乙氧基乙氧基團、2-異丁氧基乙氧基團、2,2-二甲氧基乙氧基團及2-甲氧基-1-甲基乙氧基團。

六氫吡咩基團(其可具有擇自酮基團、低級烷基團、低級烷醯基團及低級烷氧羰基團中之基團)之實例包括六氫吡咩基團,其可具有1至3個(1至2個)擇自酮基團、酮基團、如上所述低級烷基團、如上所述低級烷醯基團及如上所述低級烷氧羰基團中之基團。其特定實例包括

(151)

( 1-或 2- ) 六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 甲基 -1-六氫吡咩基團、( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 或 6- ) 甲基 -2-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 乙基 -1-六氫吡咩基團、( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 或 6- ) 乙基 -2-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 正丙基 -1-六氫吡咩基團、( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 或 6- ) 正丙基 -2-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 甲醯基 -1-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 乙醯基 -1-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 丙醯基 -1-六氫吡咩基團、( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 或 6- ) 丙醯基 -2-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 丁醯基 -1-六氫吡咩基團、( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 或 6- ) 丁醯基 -2-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 甲氧羰基 -1-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 乙氧羰基 -1-六氫吡咩基團、( 2- , 3- , 或 4- ) 第三丁氧羰基 -1-六氫吡咩基團、( 2- , 或 3- ) 酮基 -1-六氫吡咩基團、2-酮基 - ( 3- , 4- , 5-或 6- ) 乙醯基 -1-六氫吡咩基團、2-酮基 - ( 3- , 4- , 5-或 6- ) 丁醯基 -1-六氫吡咩基團、2-酮基 - ( 3- , 4- , 5-或 6- ) 甲氧羰基 -1-六氫吡咩基團、及 2-酮基 - ( 3- , 4- , 5-或 6- ) 甲氧羰基 -1-六氫吡咩基團。

1,3,8-三氮雜螺[4.5]癸基羰基團 ( 其可具有擇自酮基團及芳基團中之基團 ) 之實例包括 1,3,8-三氮雜螺[4.5]癸基羰基團，其可具有 1 至 3 個 ( 1 至 2 個 ) 擇自酮基團及如上所述芳基團中之基團。其特定實例包括 1,3,8-三氮雜螺[4.5]癸基 - ( 1- , 2- , 3- , 4- , 或 8- ) 基羰基團、1-苯基 -1,3,8-三氮雜螺[4.5]癸基 -8-基羰基團、及 1-苯基 -4-酮

(152)

基 -1,3,8-三氮雜螺[4.5]癸基 -8-基羰基團。

四氫吡啶基團之實例包括 ( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 或 6- ) -1,2,3,4-四氫吡啶基團及 ( 1- , 2- , 3- , 4- , 5- , 或 6- ) -1,2,3,6-四氫吡啶基團。

四氫吡啶基羰基團 ( 其可具有吡啶基團 ) 之實例包括如上所述四氫吡啶基羰基團, 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 吡啶基團。其特定實例包括 ( 2- , 3- , 或 4- ) 吡啶基 -1,2,3,6-四氫吡啶基 -1-基羰基團。

咪唑啶基羰基團 ( 其可具有硫酮基團 ) 之實例包括咪唑啶基羰基團, 其可具有 1 至 2 個 ( 最好 1 個 ) 硫酮基團。其特定實例包括 2-硫酮基 -1-咪唑啶基羰基團。

四氫萘基團之實例包括 ( 1-或 2- ) -1,2,3,4-四氫萘基團。

具有 1 至 4 個擇自氮原子, 氧原子及硫原子中之雜原子之飽和或不飽和雜單環型基團之實例包括下列 ( 1 ) 至 ( 9 ) 所代表之雜單環型基團。

( 1 ) 具有 1 至 4 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 氮原子之飽和 3 至 8 ( 最好 5 至 6 ) 節雜單環型基團 ( 例如吡咯啶基團、咪唑啶基團、六氫吡啶基團、六氫嘧啶基團、六氫吡嗪基團、氮雜環庚烷基團及氮雜環辛烷基團 ) 。

( 2 ) 具有 1 至 4 個 ( 最好 1 至 3 個 ) 氮原子之不飽和 3 至 8 ( 最好 5 至 6 ) 節雜單環型基團, 例如吡咯基團、二氫吡咯基團諸如 1H-2,5-二氫吡咯基團、咪唑基團 ( 諸如 1H-咪唑基團 ) 、二氫咪唑基團 ( 諸如 1H-2,3-二

(153)

氫咪唑基團)、三唑基團(諸如 4H-1,2,4-三唑基團、1H-1,2,3-三唑基團、及 2H-1,2,3-三唑基團)、二氫三唑基團(諸如 1H-4,5-二氫-1,2,4-三唑基團)、吡唑基團、吡啶基團、二氫吡啶基團(諸如 1,2-二氫吡啶基團)、嘧啶基團、二氫嘧啶基團(諸如 1,6-二氫嘧啶基團)、吡嗪基團、二氫吡嗪基團(諸如 1,2-二氫吡嗪基團)、噻嗪基團、及四唑基團(諸如 1H-四唑基團及 2H-四唑基團)；

(3) 具有 1 至 2 個(最好 1 個)氧原子及 1 至 3 個(最好 1 至 2 個)氮原子之不飽和 3 至 8(最好 5 至 6)節雜單環型基團，例如噁唑基團、異噁唑基團、噁二唑基團(諸如 1,2,4-噁二唑基團、1,3,4-噁二唑基團、及 1,2,5-噁二唑基團)及具有 1 至 2 個(最好 1 個)氧原子及 1 至 3 個(最好 1 至 2 個)氮原子之飽和 3 至 8(最好 5 至 6)節雜單環型基團，例如噁唑啶基團、異噁唑啶基團及嗎啉基團；

(4) 具有 1 至 2 個硫原子及 1 至 3 個氮原子之不飽和 3 至 8(最好 5)節雜單環型基團，例如噻唑基團、二氫噻唑基團(諸如 2,3-二氫噻唑基團)、異噻唑基團、噻二唑基團(諸如 1,2,3-噻二唑基團、1,2,4-噻二唑基團、1,3,4-噻二唑基團、及 1,2,5-噻二唑基團)及二氫噻嗪基團。

(5) 具有 1 至 2 個硫原子及 1 至 3 個氮原子之飽和 3 至 8(最好 5 至 6)節雜單環型基團，例如噻唑啶基團；

(6) 具有 1 至 2 個氧原子之飽和 3 至 8(最好 5 至

(154)

6) 節雜單環型基團，例如四氫呋喃基團及四氫哌喃基團；

(7) 具有 1 至 2 個氧原子之不飽和 3 至 8 (最好 5 至 6) 節雜單環型基團，例如哌喃基團 (諸如 2H-哌喃基團)；

(8) 具有 1 至 2 個硫原子之飽和 3 至 8 (最好 5 至 6) 節雜單環型基團，例如四氫硫代呋喃基團及四氫噻喃基團；及

(9) 具有 1 至 2 個硫原子之不飽和 3 至 8 (最好 5 至 6) 節雜單環型基團，例如噻吩基團及噻喃基團 (諸如 2H-噻喃基團)；

其中之理想者為具有 1 至 2 個擇自氮原子，氧原子及硫原子中之雜原子之飽和或不飽和雜單環型基團且擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡啶基團、吡啶基團、嘧啶基團、吡嗪基團、異噁唑基團、噻唑基團、哌喃基團及噻吩基團；且進一步之理想者為具有 1 至 2 個氮原子之飽和或不飽和雜單環型基團且擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡啶基團、嘧啶基團及噻唑基團。

四氫喹噁啉基團之實例包括 (1-, 2-, 5-, 或 6-) - 1,2,3,4-四氫喹噁啉基團及 (1-, 2-, 5-, 或 6-) - 5,6,7,8-四氫喹噁啉基團。

四氫喹啉基團之實例包括 (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-或 8-) - 1,2,3,4-四氫喹啉基團及 (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-或 8-) - 5,6,7,8-四氫喹啉基團。

(155)

二氫喹啉基團之實例包括（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-或8-）-3,4-二氫喹啉基團及（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-或8-）-1,2-二氫喹啉基團。

二氫苯並咪唑基團之實例包括（1-，2-，4-，或5-）-2,3-二氫-1H-苯並咪唑基團。

四氫苯並氮雜草基團之實例包括（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-，8-或9-）-2,3,4,5-四氫-1H-苯並[b]氮雜草基團及（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-，8-或9-）-2,3,4,5-四氫-1H-苯並[c]氮雜草基團。

四氫苯並二氮雜草基團之實例包括（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-，8-或9-）-2,3,4,5-四氫-1H-苯並[b][1,4]二氮雜草基團及（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-，8-或9-）-2,3,4,5-四氫-1H-苯並[e]1,4]二氮雜草基團。

六氫苯並吡辛因基團之實例包括（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-，8-，9-或10-）-1,2,3,4,5,6-六氫苯並[b]吡辛因基團及（1-，2-，3-，4-，5-，6-，7-，8-，9-或10-）-1,2,3,4,5,6-六氫苯並[c]吡辛因基團。

二氫苯並噁吡基團之實例包括（2-，3-，4-，5-，6-，7-，或8-）-3,4-二氫-2H-苯並[b][1,4]噁吡基團及（1-，2-，4-，5-，6-，7-，或8-）-2,4-二氫-1H-苯並[d][1,3]噁吡基團。

二氫苯並噁唑基團之實例包括（2-，3-，4-，5-，6-，或7-）-2,3-二氫苯並噁唑基團。

苯並異噁唑基團之實例包括（3-，4-，5-，6-，或7-

(156)

) - 苯並 [d]-異噁唑基團及 ( 3- , 4- , 5- , 6- , 或 7- ) - 苯並 [c]-異噁唑基團。

苯並噁二唑基團之實例包括 ( 4-或 5- ) - 苯並 [c][1,2,5] 噁二唑基團。

四苯並氧氮雜草基團之實例包括 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 8- , 或 9- ) - 2,3,4,5-四氫苯並 [b][1,4]氧氮雜草基團、 ( 1- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 8- , 或 9- ) - 1,3,4,5-四氫苯並 [e][1,3]氧氮雜草基團、及 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 8- , 或 9- ) - 2,3,4,5-四氫苯並 [f][1,4]氧氮雜草基團。

二氫苯並噻吡基團之實例包括 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) - 3,4-二氫-2H-苯並 [b][1,4]噻吡基團及 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 7- , 或 8- ) - 3,4-二氫-2H-苯並 [e][1,3]噻吡基團。

苯並噁噻基團之實例包括 ( 2- , 4- , 5- , 6- , 或 7- ) - 苯並 [d][1.3]噁噻基團、 ( 3- , 4- , 5- , 6- , 或 7- ) - 3H-苯並 [c][1.2]噁噻基團、及 ( 3- , 4- , 5- , 6- , 或 7- ) - 3H-苯並 [d][1.2]噁噻基團。

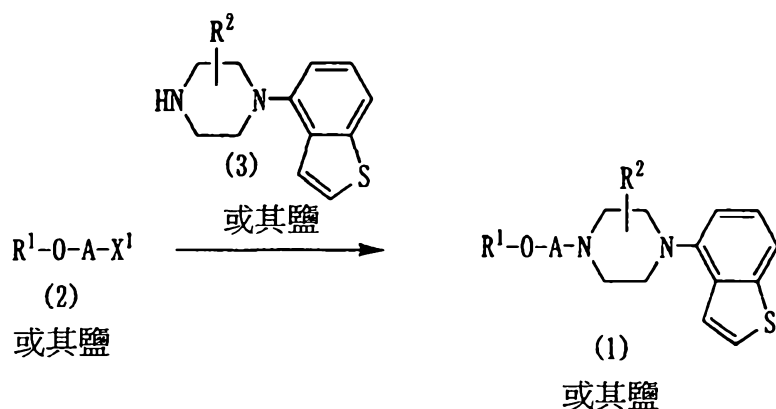
二氫苯並呋喃基團之實例包括 ( 2- , 3- , 4- , 5- , 6- , 或 7- ) - 2,3-二氫苯並呋喃基團。

通式 ( 1 ) 所代表之雜環型化合物 ( 其後稱之為化合物 ( 1 ) ) 可藉各種不同種類之方法例如下列反應式 -1 或反應式 2 中所示之方法製得。

(157)

[式 4]

反應式 - 1



其中  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$  及  $\text{A}$  乃如上所定義；且  $\text{X}^1$  為鹵素原子或為促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團。

促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團之實例包括低級烷磺醯氧基團、芳磺醯氧基團及芳烷磺醯氧基團。

通式 (2) 中之  $\text{X}^1$  所代表之鹵素原子為氟原子、氯原子、溴原子及碘原子。

$\text{X}^1$  所代表之低級烷磺醯氧基團之特定實例包括具有 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷磺醯氧基團諸如甲磺醯氧基團、乙磺醯氧基團、異丙磺醯氧基團、正丙磺醯氧基團、正丁磺醯氧基團、第三丁磺醯氧基團、正戊磺醯氧基團、及正己磺醯氧基團。

$\text{X}^1$  所代表之芳磺醯氧基團之特定實例包括苯磺醯氧基團及萘磺醯氧基團，其可於苯基環上具有 1 至 3 個擇自具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷基團、具 1 至 6 個碳原子之直或支鏈烷氧基團、硝基團、及鹵素原子中之取代基。可具有取代基之苯磺醯氧基團之特定實例包括苯磺醯氧基



(158)

團、4-甲基苯磺醯氧基團、2-甲基苯磺醯氧基團、4-硝基苯磺醯氧基團、4-甲氧基苯磺醯氧基團、2-硝基苯磺醯氧基團、及3-氯基苯磺醯氧基團。萘磺醯氧基團之特定實例包括 $\alpha$ -萘磺醯氧基團及 $\beta$ -萘磺醯氧基團。

$X^1$  所代表之芳烷磺醯氧基團之特定實例包括具有1至6個碳原子且經苯基團取代之直或支鏈烷磺醯氧基團；及具有1至6個碳原子且經萘基團取代之直或支鏈烷磺醯氧基團；此二者均可於苯基環上具有1至3個擇自具1至6個碳原子之直或支鏈烷基團、具1至6個碳原子之直或支鏈烷氧基團、硝基團、及鹵素原子中之取代基。如上所述經苯基團取代之烷磺醯氧基團之特定實例包括苄磺醯氧基團、2-苯乙基磺醯氧基團、4-苯丁基磺醯氧基團、2-甲苄基磺醯氧基團、4-甲氧基苄基磺醯氧基團、4-硝苄基磺醯氧基團、及3-氯苄基磺醯氧基團。經萘基團取代之烷磺醯氧基團之特定實例包括 $\alpha$ -萘甲基磺醯氧基團及 $\beta$ -萘甲基磺醯氧基團。

化合物(1)可藉令通式(2)所代表之化合物(其後稱之為化合物(2))與通式(3)所代表之化合物(其後稱之為化合物(3))起反應而製得。

此反應通常於不會負面影響反應之慣用溶劑諸如水；以醇為基底之溶劑諸如甲醇、乙醇、異丙醇、正丁醇、三氟乙醇、及乙二醇；以酮為基底之溶劑諸如丙酮及甲基乙基酮；以醚為基底之溶劑諸如四氫呋喃、二噁烷、乙醚及二乙二醇二甲基醚；以酯為基底之溶劑諸如乙酸甲酯及乙

(159)

酸乙酯；非質子性極性溶劑諸如乙腈、N,N-二甲基甲醯胺及二甲亞砜；以鹵化之烴為基底之溶劑諸如二氯甲烷及二氯乙烷；或其它有機溶劑中進行。此外，反應可於這些慣用溶劑之混合溶液中進行。反應通常於無機鹼諸如鹼金屬（例如鈉及鉀），鹼金屬碳酸氫鹽（例如碳酸氫鋰、碳酸氫鈉、及碳酸氫鉀），鹼金屬氫氧化物（例如氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀、及氫氧化銻），鹼金屬碳酸鹽（例如碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀、及碳酸銻），鹼金屬低級醇化物（例如甲醇鈉及乙醇鈉），及氫化物（例如氫化鈉及氫化鉀）；或於有機鹼諸如三烷胺（例如三甲胺、三乙胺、N-乙基二異丙胺），吡啶，喹啉，六氫吡啶，咪唑，皮考啉，二甲胺基吡啶，二甲基苯胺，N-甲基嗎啉，1,5-二氮雜二環[4.3.0]壬-5-烯（DBN），1,4-二氮雜二環[2.2.2]辛烷（DABCO），及1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳烯-7（DBU）中進行。當這些鹼採用液體形式時，則彼等可用以作為溶劑。

這些鹼性化合物可單獨使用或以二或多種型式之混合物使用。

鹼性化合物可以佔化合物（2）之通常 0.5 至 10 倍，最好 0.5 至 6 倍之莫耳量使用。

如有需要，上述反應可添加鹼金屬碘化物諸如碘化鉀及碘化鈉作為促進劑來進行。

反應式-1-中所用之化合物（2）與化合物（3）之莫耳比至少約 0.5 倍，最好約 0.5-5 倍。

(160)

反應溫度並未特別限制且通常於冷或加熱狀況下進行，且最好於幾近室溫至約 150℃之溫度下進行 1 至 30 小時。

供根據本發明之化合物用之作爲原材料之化合物（2）包括新穎化合物且可藉各種方法，例如藉下列反應式-3 所代表之方法製得。

供根據本發明之化合物用之作爲原材料之化合物（3）爲已知化合物或爲可由已知化合物中輕易製得之化合物。

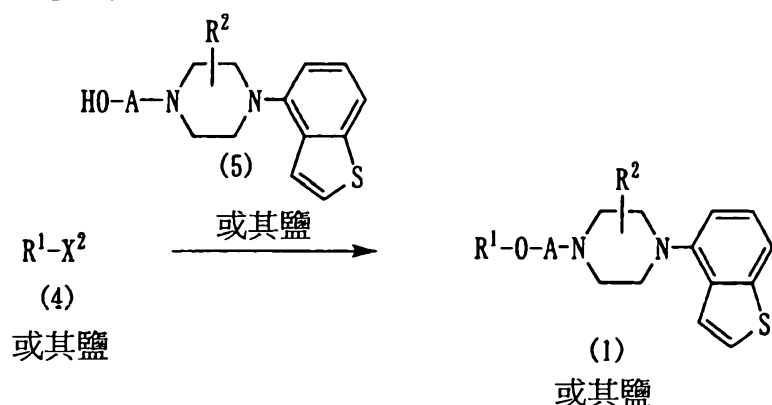
可使用化合物（2）之鹽來替代化合物（2）及使用化合物（3）之鹽來替代化合物（3）。化合物（2）及（3）之鹽包括酸加成鹽。這些酸加成鹽可藉令藥學上可接受之酸與化合物（2）或（3）起反應而製得。此處所用之酸之實例包括無機酸諸如硫酸，硝酸，氫氯酸，磷酸，及氫溴酸；磺酸諸如對位-甲苯磺酸，甲磺酸，及乙磺酸；及有機酸諸如乙酸，草酸，馬來酸，富馬酸，蘋果酸，酒石酸，檸檬酸，琥珀酸，及苯甲酸。

化合物（2）中，具有酸性基團之化合物可藉與藥學上可接受之鹼性化合物起反應而輕易製得鹽。此鹼性化合物之實例包括金屬氫氧化物諸如氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化鋰、及氫氧化鈣；鹼金屬碳酸鹽或碳酸氫鹽諸如碳酸鈉、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀；及鹼金屬醇化物諸如甲醇鈉及乙醇鉀。

(161)

[式 5]

反應式 -2



其中  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$  及  $\text{A}$  乃如上所定義；且  $\text{X}^2$  為羥基團、鹵素原子或為促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團。

$\text{X}^2$  所代表之鹵素原子或與通式 (4) 有關之促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團乃如上所述。

化合物 (1) 可藉令通式 (4) 所代表之化合物 (其後稱之為化合物 (4)) 與通式 (5) 所代表之化合物 (其後稱之為化合物 (5)) 起反應而製得。

反應可於與反應式 -1 類同之狀況下進行。

如果化合物 (4) 中之  $\text{X}^2$  為羥基團，則反應可於適當之溶劑中、於適當縮合劑之存在下進行。

此反應通常於不會負面影響反應之慣用溶劑諸如水；以醇為基底之溶劑諸如甲醇、乙醇、異丙醇、正丁醇、三氟乙醇、及乙二醇；以酮為基底之溶劑諸如丙酮及甲基乙基酮；以醚為基底之溶劑諸如四氫呋喃、二噁烷、乙醚及二乙二醇二甲基醚；以酯為基底之溶劑諸如乙酸甲酯及乙酸乙酯；非質子性極性溶劑諸如乙腈、 $\text{N,N}$ -二甲基甲醯胺

(162)

及二甲亞砷；以鹵化之烴爲基底之溶劑諸如二氯甲烷及二氯乙烷；或其它有機溶劑中進行。此外，亦可使用這些慣用溶劑之混合溶液作爲溶劑。

縮合劑方面，可使用偶氮羧酸酯諸如偶氮二羧酸二乙酯及磷化合物諸如三苯磷之混合物。

此處所用之縮合劑之量通常至少等莫耳，最好等莫耳至二倍於化合物（4）之量。

反應式-2中所用之化合物（4）與化合物（5）之莫耳比通常爲至少等莫耳，至少約2倍莫耳量。

反應溫度並未特別限制且通常於冷或加熱狀況下進行，且最好於0℃至約150℃之溫度下進行1至10小時。

供根據本發明之化合物用之充作原材料之化合物（4）爲已知化合物或爲可由已知化合物中輕易製得之化合物。

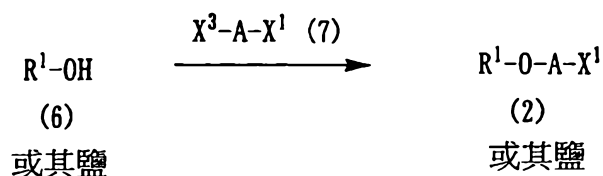
供根據本發明之化合物用之充作原材料之化合物（5）包括新穎化合物以及可藉各種方法，例如藉下列反應式-4或-5所代表之方法製得之化合物。

可使用化合物（4）之鹽來替代化合物（4）及使用化合物（5）之鹽來替代化合物（5）。化合物（4）之理想鹽與化合物（2）中所示之鹽相同。化合物（5）之理想鹽與化合物（3）中所示之鹽相同。

(163)

[式 6]

反應式 - 3



其中  $\text{R}^1$ 、 $\text{X}^1$  及  $\text{A}$  乃如上所定義；且  $\text{X}^3$  為鹵素原子或為促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團。

$\text{X}^3$  所代表之鹵素原子或與通式 (7) 有關之促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團乃如上所述。

化合物 (2) 可藉令通式 (6) 所代表之化合物 (其後稱之為化合物 (6)) 與通式 (7) 所代表之化合物 (其後稱之為化合物 (7)) 起反應而製得。

反應可於與反應式 -1 類同之狀況下進行。

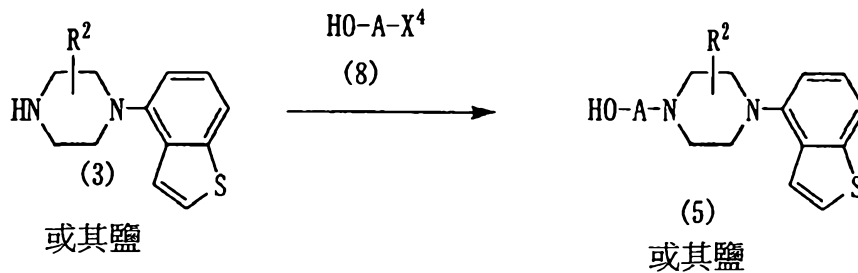
供根據本發明之化合物用之充作原材料之化合物 (6) 及 (7) 為已知化合物或為可由已知化合物中輕易製得之化合物。

可使用化合物 (6) 之鹽來替代化合物 (6)。化合物 (6) 之理想鹽與化合物 (2) 中所示之鹽相同。

(164)

[式 7]

反應式 - 4



其中  $R^2$  及  $A$  乃如上所定義；且  $X^4$  為鹵素原子或為促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團。

$X^4$  所代表之鹵素原子或與通式 (8) 有關之促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團乃如上所述。

化合物 (5) 可藉令化合物 (3) 與通式 (8) 所代表之化合物 (其後稱之為化合物 (8)) 起反應而製得。

反應可於與反應式 -1 類同之狀況下進行。

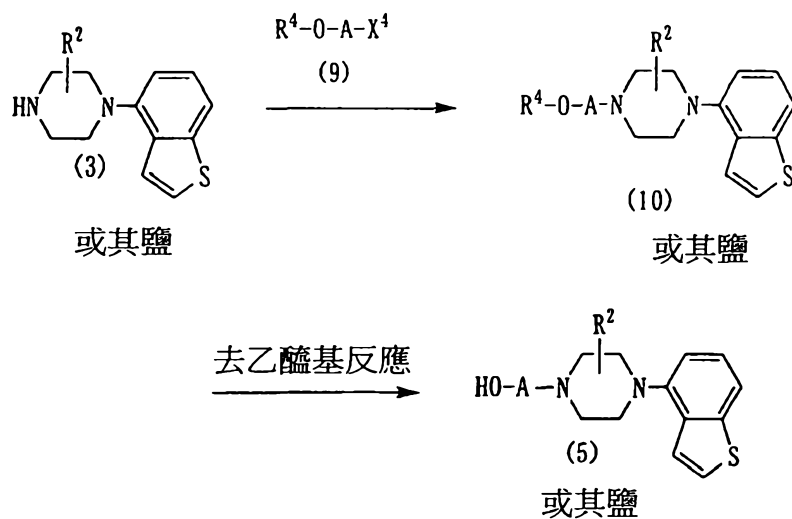
供根據本發明之化合物用之充作原材料之化合物 (8) 為已知化合物或為可由已知化合物中輕易製得之化合物。

可使用化合物 (3) 之鹽來替代化合物 (3)。化合物 (3) 之理想鹽與上述者相同。

(165)

[式 8]

反應式 - 5



其中  $R^2$  及  $A$  乃如上所定義； $R^4$  為低級烷醯基團；且  $X^4$  為鹵素原子或為促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團。

通式 (9) 及 (10) 中之  $R^4$  所代表之低級烷醯基團乃如上所述。

此外， $X^4$  所代表之鹵素原子或與通式 (9) 有關之促成與鹵素原子中之取代反應相同之基團乃如上所述。

通式 (10) 所代表之化合物（其後稱之為化合物 (10)）可藉令化合物 (3) 與化合物 (9) 起反應而製得。

反應可於與反應式 -1 類同之狀況下進行。

供根據本發明之化合物用之充作原材料之化合物 (9) 為已知化合物或為可由已知化合物中輕易製得之化合物。

可使用化合物 (3) 之鹽來替代化合物 (3)。化合物



(166)

(3) 之理想鹽與上述者相同。

其後令化合物 (10) 接受反應以供移除醯基團，即製得化合物 (5)。

理想之反應方法方面，可採用慣用之反應諸如水解反應。水解反應最好可於鹼或酸包括路易斯酸之存在下進行。理想鹼之實例包括無機鹽諸如鹼金屬（例如鈉及鉀），鹼金屬碳酸氫鹽（例如碳酸氫鋰、碳酸氫鈉、及碳酸氫鉀），鹼金屬氫氧化物（例如氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀、及氫氧化銻），鹼金屬碳酸鹽（例如碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀、及碳酸銻），鹼金屬低級醇化物（例如甲醇鈉及乙醇鈉），及氫化物（例如氫化鈉及氫化鉀）；及有機鹼諸如三烷胺（例如三甲胺、三乙胺、N-乙基二異丙胺），吡啶，喹啉，六氫吡啶，咪唑，皮考啉，二甲胺基吡啶，二甲基苯胺，N-甲基嗎啉，1,5-二氮雜二環[4.3.0]壬-5-烯（DBN），1,4-二氮雜二環[2.2.2]辛烷（DABCO），及1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳烯-7（DBU）。理想之酸可為有機酸（諸如甲酸、乙酸、丙酸、三氯乙酸、三氟乙酸）及無機酸（諸如氫氯酸、氫溴酸、硫酸、氯化氫、及溴化氫）。使用路易斯酸諸如三鹵乙酸（例如三氯乙酸及三氟乙酸）進行之移除反應最好可在陽離子-截留劑（例如茴香醚及酚）之存在下進行。

此反應通常於不會負面影響反應之慣用溶劑諸如水；以醇為基底之溶劑諸如甲醇、乙醇、異丙醇、正丁醇、三氟乙醇、及乙二醇；以酮為基底之溶劑諸如丙酮及甲基乙

(167)

基酮；以醚為基底之溶劑諸如四氫呋喃、二噁烷、乙醚及二乙二醇二甲基醚；以酯為基底之溶劑諸如乙酸甲酯及乙酸乙酯；非質子性極性溶劑諸如乙腈、N,N-二甲基甲醯胺及二甲亞砜；以鹵化之烴為基底之溶劑諸如二氯甲烷及二氯乙烷；或其它有機溶劑中進行。此外，亦可於這些慣用溶劑之混合溶液中進行。其中以乙醇較為理想。反應溫度並未特別限制且通常於冷或加熱狀況下進行，且最好於幾近室溫至幾近所用溶劑沸點下進行 0.5 至 75 小時。

可使用化合物 (10) 之鹽來替代化合物 (10)。化合物 (10) 之理想鹽與化合物 (3) 中所示之鹽相同。

此外，化合物 (5) 且其中 A 代表  $-\text{CH}_2-\text{A}''-$  且其中  $\text{A}''$  代表 C1 至 C5 烷撐基團者（其後稱之為化合物 (5a)）可藉下列反應式 -6 所代表之方法製得。

[式 9]

反應式 -6



其中  $\text{R}^2$  乃如上所定義；且  $\text{R}^3$  為低級烷氧基團。 $\text{A}''$  代表 C1 至 C5 烷撐基團。通式 (11) 中之  $\text{R}^3$  所代表之低級烷氧基團乃如上所定義。

通式 (11) 及 (5a) 中之  $\text{A}''$  所代表之 C1 至 C5 烷撐

(168)

基團之實例包括具有 1 至 5 個碳原子之直或支鏈烷撐基團諸如甲撐、乙撐、甲基甲撐、三甲撐、四甲撐、1-甲基三甲撐、2-甲基三甲撐、3-甲基四甲撐、五甲撐及 2,2-二甲基三甲撐。

化合物 (5a) 可藉令通式 (11) 所代表之化合物 (其後稱之為化合物 (11)) 進行還原反應而製得。

反應可藉參考實例 6 中所示之方法或其類同之方法製得。反應亦可藉慣用方法使用還原劑製得。

理想之還原劑為氫化物 (諸如氫化鋰鋁、氫硼化鈉、氫硼化鋰、乙硼烷、及氰基氫硼化鈉)。

此反應通常於不會負面影響反應之慣用溶劑諸如以醇為基底之溶劑諸如甲醇、乙醇、異丙醇、正丁醇、三氟乙醇、及乙二醇；以酮為基底之溶劑諸如丙酮及甲基乙基酮；以醚為基底之溶劑諸如四氫呋喃、二噁烷、乙醚及二乙二醇二甲基醚；以酯為基底之溶劑諸如乙酸甲酯及乙酸乙酯；非質子性極性溶劑諸如乙腈、N,N-二甲基甲醯胺及二甲亞砷；以鹵化之烴為基底之溶劑諸如二氯甲烷及二氯乙烷；或其它有機溶劑中進行。此外，亦可於這些慣用溶劑之混合溶液中進行。反應溫度並未特別限制且通常於冷或加熱狀況下進行，且最好於幾近室溫至幾近所用溶劑沸點下進行 0.5 至 75 小時。

供根據本發明之化合物用之充作原材料之化合物 (11) 為已知化合物或為可由已知化合物中輕易製得之化合物。

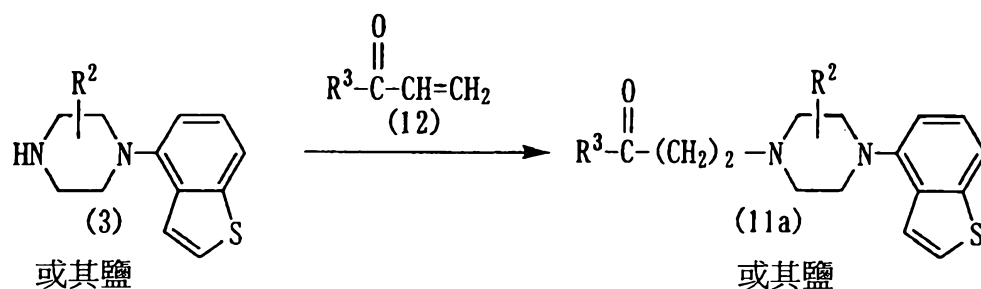
(169)

可使用化合物 (11) 之鹽來替代化合物 (11)。化合物 (11) 之理想鹽與化合物 (2) 中所示之鹽相同。

此外，化合物 (11) 且其中 A'' 代表 "-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-" 者 (其後稱之為化合物 (11a)) 可藉下列反應式 -7 所代表之方法製得。

[式 10]

反應式 -7



其中 R<sup>2</sup> 及 R<sup>3</sup> 乃如上所定義。

化合物 (11a) 可藉令化合物 (3) 與通式 (12) 所代表之化合物 (其後稱之為化合物 (12)) 起反應而製得。

反應可藉參考實例 5 中所示之方法或其類同之方法製得。此反應通常於不會負面影響反應之慣用溶劑諸如水；以醇為基底之溶劑諸如甲醇、乙醇、異丙醇、正丁醇、三氟乙醇、及乙二醇；以酮為基底之溶劑諸如丙酮及甲基乙基酮；以醚為基底之溶劑諸如四氫呋喃、二噁烷、乙醚及二乙二醇二甲基醚；以酯為基底之溶劑諸如乙酸甲酯及乙酸乙酯；非質子性極性溶劑諸如乙腈、N,N-二甲基甲醯胺及二甲亞砜；以鹵化之烴為基底之溶劑諸如二氯甲烷及二

(170)

氯乙烷；或其它有機溶劑中進行。此外，亦可於這些慣用溶劑之混合溶液中進行。反應溫度並未特別限制且通常於冷或加熱狀況下進行，且最好於幾近室溫至幾近所用溶劑沸點下進行 0.5 至 75 小時。

供根據本發明之化合物用之充作原材料之化合物（12）為已知化合物或為可由已知化合物中輕易製得之化合物。

可使用化合物（3）之鹽來替代化合物（3）及使用化合物（12）之鹽來替代化合物（12）。化合物（3）之理想鹽與上示之鹽相同。化合物（12）之理想鹽與化合物（2）中所示之鹽相同。

藉由以上每一反應式所得之目標化合物可形成適當之鹽。此適當之鹽包括以下所例示之化合物（1）之理想鹽類。

式（1）化合物之理想鹽類為藥學上可接受之鹽類，其實例包括金屬鹽諸如鹼金屬鹽（例如鈉鹽、鉀鹽等），鹼土金屬鹽（例如鈣鹽、鎂鹽等），無機鹼之鹽類諸如鉍鹽，鹼金屬碳酸鹽（例如碳酸鋰、碳酸鉀、碳酸鈉、碳酸鉀等），鹼金屬碳酸氫鹽（例如碳酸氫鋰、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等），鹼金屬氫氧化物（例如氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化鉀等）；例如，有機鹼之鹽類諸如三（低級）烷胺（例如三甲胺、三乙胺、N-乙基二異丙胺），吡啶，喹啉，六氫吡啶，咪唑，皮考啉，二甲胺基吡啶，二甲基苯胺，N-（低級）烷基嗎啉（例如 N-甲基

(171)

嗎啉)，1,5-二氮雜二環[4.3.0]壬-5-烯（DBN），1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳烯-7（DBU），1,4-二氮雜二環[2.2.2]辛烷（DABCO）；無機酸之鹽類諸如氫氯酸鹽、氫溴酸鹽、氫碘酸鹽、硫酸鹽、硝酸鹽、磷酸鹽；有機酸之鹽類諸如甲酸鹽、乙酸鹽、丙酸鹽、草酸鹽、丙二酸鹽、琥珀酸鹽、富馬酸鹽、馬來酸鹽、乳酸鹽、蘋果酸鹽、檸檬酸鹽、酒石酸鹽、碳酸鹽、苦味酸鹽、甲磺酸鹽、乙磺酸鹽、對位-甲苯磺酸鹽、谷胺酸鹽等。

此外，將溶劑化物（例如水合物、乙醇化物等）加至每一反應式所示之原材料化合物及目標化合物所得之形式之化合物乃包括於每一通式中。理想之溶劑化物可為水合物。

藉由每一通式所得之每一目標化合物可由反應混合物中予以離析及純化，例如藉令反應混合物接受離析操作諸如過濾法、濃縮法及冷卻後萃取法以分離出粗製之反應產物，其後接受慣用之純化操作諸如管柱層析法或再結晶法而成。

本發明通式（1）所代表之化合物自然涵蓋異構體諸如幾何異構體、立體異構體及對映體。

通式（1）所代表之化合物及其鹽可以一般之藥學製劑形式使用。製劑可使用稀釋劑或賦形劑諸如填料、延展劑、結合劑、保濕劑、崩解劑、表面活性劑、及潤滑劑等而製得。藥學製劑方面，可依醫療目的而使用各種不同之形式。其典型形式包括片劑、丸劑、粉末、液體、懸浮

(172)

液、乳膠、顆粒、膠囊、坐藥及注射劑（液體、懸浮液）。

形成片劑方面，可使用廣泛各種型式之技藝中慣例已知之載體。可予使用之載體實例包括賦形劑諸如乳糖、蔗糖、氯化鈉、葡萄糖、尿素、澱粉、碳酸鈣、高嶺土、晶狀纖維素、及矽酸鹽；結合劑諸如水、乙醇、丙醇、單糖漿、葡萄糖溶液、澱粉溶液、凝膠溶液、羧甲基纖維素、蟲膠、甲基纖維素、磷酸鉀、及聚乙炔基吡咯啉；崩解劑諸如乾化澱粉、藻酸鈉、粉狀瓊脂、粉狀昆布糖、碳酸氫鈉、碳酸鈣、聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯、月桂基硫酸鈉、硬脂酸單甘油酯、澱粉、及乳糖；崩解作用抑制劑諸如蔗糖、三硬脂酸甘油酯、椰子油、及氫化油；吸收劑諸如四級銨鹼及月桂基硫酸鈉；保濕劑諸如甘油及澱粉；吸附劑諸如澱粉、乳糖、高嶺土、膨潤土、及膠態矽石；及潤滑劑諸如精製滑石、硬脂酸酯、粉狀硼酸、及聚乙二醇。此外，如有需要，則片劑可包覆上一般之薄膜。此包衣片劑之實例包括糖衣片劑、包覆凝膠膠囊之片劑、腸溶片劑、薄膜衣片劑或雙層片劑、及多層片劑。

形成丸劑方面，可使用廣泛各種型式之技藝中慣例已知之載體。可予使用之載體實例包括賦形劑諸如葡萄糖、乳糖、澱粉、椰子油、硬化植物油、高嶺土及滑石；結合劑諸如粉狀阿拉伯膠、粉狀黃蓍膠、凝膠及乙醇；及崩解劑諸如昆布糖及瓊脂。

形成坐藥方面，可使用廣泛各種型式之技藝中慣例已

(173)

知之載體。可予使用之載體實例包括聚乙二醇、椰子油、高級醇、高級醇之酯類、凝膠、及半合成之甘油酯。

膠囊通常係藉將有效成分化合物與上述之載體根據慣用之方法混合，再將混合物填入硬凝膠膠囊或軟凝膠膠囊中而製得。

製備注射劑方面，液態劑、乳膠及懸浮液最好予以殺菌並與血液成等張。當彼等製成注射劑時，任何稀釋劑均可使用，只要其為技藝中慣用之稀釋劑即可。可予使用之稀釋劑實例包括水、乙醇、聚乙二醇、丙二醇、乙氧基化之異硬脂醇、聚氧化之異硬脂醇、聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯。

要注意的是，此狀況下，藥學製劑可含有足量之鹽、葡萄糖或甘油以製得等張溶液。另外，一般之輔助溶解劑、緩衝劑、舒緩劑可予加入。此外，如有需要，則可將色素、防腐劑、芳香劑、香料、甜化劑及其它醫藥物質加至藥學製劑中。

根據本發明之藥學製劑中所含之通式（1）化合物及其鹽之量並未特別限定且可由廣泛範圍中加以適當選擇；然而通常佔製劑組成物之約 1 至 70 重量 %，，最好約 1 至 30 重量 %。

根據本發明之藥學製劑之投服方法並未限定且可藉由根據製劑形式，病患之年齡、性別及其它狀況，及疾病之嚴重度而採用之方法投服。例如，如果為片劑、丸劑、液態劑、懸浮液、乳膠、顆粒及膠囊，則經口投服。此外，



(174)

如果為注射劑，則可本身或藉與一般補充劑諸如葡萄糖及胺基酸混合而由靜脈內投服，且，如有需要，則由肌內、皮內、皮下或腹膜內單獨投服。如為坐藥，則投服至直腸內。

根據本發明之藥學製劑之劑量乃依劑量攝服法（使用指引），病患之年齡、性別及其它狀況，及疾病之嚴重度等而加以適當選擇；然而，有效成分化合物之劑量通常且最好設在每日約 0.1 至 10 毫克/體重（公斤）。理想者，每劑量單位所含之有效成分化合物在約 1 至 200 毫克之範圍內。

#### [本發明之優點]

根據本發明之化合物具有  $D_2$  受體部分激動劑效應， $5-HT_{2A}$  受體拮抗劑效應及血清素吸收抑制效應。

$D_2$  受體部分激動劑效應意指當其增強時，具有可減緩多巴胺激導性（DA）神經傳導之作用，而當其降低時，則可加速多巴胺激導性（DA）神經傳導。依此方式，則  $D_2$  受體部分激動劑可充作多巴胺系統安定劑，其可將多巴胺激導性（DA）神經傳導安定化至正常狀態。有鑒於此效應，本發明化合物可對異常多巴胺激導性（DA）神經傳導（加速或減緩）所致之症狀產生優良之臨床改善效應。優良之臨床改善效應可指正面及負面症狀、認知損害及抑鬱症狀之改善效應（參見 Michio Toru, Psychiatry, Vol. 46, page 855-864 (2004); Tetsuro Kikuchi and Hirose

(175)

Takeshi, Brain Science, vol. 25, page 579-583 (2004); and Harrison, T. S. and Perry, C. M.: Drugs 64: 1715-1736, 2004)。

5-HT<sub>2A</sub> 受體拮抗劑效應意指可降低錐體外副作用並發展優良臨床反應之作用，且更尤其有效作用以改善負面症狀、認知損害、抑鬱症狀、及失眠（參見 Jun Ishigooka and Ken Inada: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 4, page 1653- 1664 (2001); Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 1, page 5-22 (1998), and Meltzer, H. Y. et al.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1159- 1172, 2003)。

血清素再吸收抑制效應乃（例如）有效以改善抑鬱症狀（參見 Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 1, page 5-22 (1988))。

本發明化合物在這三種效應方面均優良，或者其中有一或二種效應顯著地優良。

此外，除了上述效應外，根據本發明之一些化合物亦具有  $\alpha_1$  受體拮抗劑效應。 $\alpha_1$  受體拮抗劑效應乃有效以改善精神分裂症之正面症狀（參見 Svensson, T. H.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1145- 1158, 2003）

因此，本發明化合物具有廣效性以治療精神分裂症及其它中樞神經系統病症且具有優良之臨床反應。

(176)

因此，本發明化合物極有效以改善各種不同種類之中樞神經系統病症諸如精神分裂症；執拗性、頑固性或慢性精神分裂症；情緒性障礙；精神性病症；情感性病症；雙相病症（例如，第 I 型躁鬱症及第 II 型躁鬱症）；抑鬱症；內源性抑鬱症；重症抑鬱症；憂鬱症及執拗性抑鬱症；情緒不良病症；循環性情感精神病症；焦慮症（例如，恐慌發作，恐慌症，廣場恐怖症，社交恐懼症，強迫症，外傷後壓力症，全身性焦慮症，及急性壓力症）；軀體形式病症（例如，歇斯底里症，軀體症狀病症，轉化性病症，疼痛病症，及疑病症）；捏造性病症；分裂性病症；性功能病症（例如，性功能障礙，性慾病症，性喚醒病症，及勃起功能障礙）；飲食病症（例如，厭食症及飽食症）；睡眠症；適應病症；物質-相關病症（例如，酒精濫用，酒精中毒，藥物成癮，興奮劑中毒，及麻醉劑中毒）；快感缺乏（例如，醫師原性快感缺乏，精神或心理原因之快感缺乏，與抑鬱症有關之快感缺乏，及與精神分裂症有關之快感缺乏）；譫妄；認知損害；與阿滋海默症有關之認知損害；帕金森氏症及其它神經變性病症；因阿滋海默症，帕金森氏症及相關之神經變性病症所致之認知損害；精神分裂症之認知損害；因執拗性、頑固性或慢性精神分裂症所致之認知損害；嘔吐；動暈症；肥胖症；偏頭痛；疼痛；精神障礙；自閉症；妥瑞氏症；抽搐症；注意力缺乏/過動症；行為障礙；及唐氏症。

此外，本發明化合物僅具有少許副作用，且具有優良

(177)

之耐受性及安全性。

上示每一反應式中所用之原材料化合物可為適當之鹽，藉每一反應所得之目標化合物可形成適當之鹽。此適當之鹽類包括下列所例示式（1）化合物之理想鹽類。

式（1）化合物之理想鹽類為藥學上可接受之鹽類，其實例包括金屬鹽諸如鹼金屬鹽（例如鈉鹽、鉀鹽等），鹼土金屬鹽（例如鈣鹽、鎂鹽等），無機鹼之鹽類諸如鉍鹽，鹼金屬碳酸鹽（例如碳酸鋰、碳酸鉀、碳酸鈉、碳酸鉀等），鹼金屬碳酸氫鹽（例如碳酸氫鋰、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等），鹼金屬氫氧化物（例如氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化鉀等）；例如，有機鹼之鹽類諸如三（低級）烷胺（例如三甲胺、三乙胺、N-乙基二異丙胺），吡啶，喹啉，六氫吡啶，咪唑，皮考啉，二甲胺基吡啶，二甲基苯胺，N-（低級）烷基嗎啉（例如N-甲基嗎啉），1,5-二氮雜二環[4.3.0]壬-5-烯（DBN），1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳烯-7（DBU），1,4-二氮雜二環[2.2.2]辛烷（DABCO）；無機酸之鹽類諸如氫氟酸鹽、氫溴酸鹽、氫碘酸鹽、硫酸鹽、硝酸鹽、磷酸鹽；有機酸之鹽類諸如甲酸鹽、乙酸鹽、丙酸鹽、草酸鹽、丙二酸鹽、琥珀酸鹽、富馬酸鹽、馬來酸鹽、乳酸鹽、蘋果酸鹽、檸檬酸鹽、酒石酸鹽、碳酸鹽、苦味酸鹽、甲磺酸鹽、乙磺酸鹽、對位-甲苯磺酸鹽、谷胺酸鹽等。

此外，將溶劑化物（例如水合物、乙醇化物等）加至每一反應式所示之原材料化合物及目標化合物中所得之形

(178)

式之化合物乃包括於每一通式中。理想之溶劑化物可為水合物。

藉由每一通式所得之每一目標化合物可由反應混合物中予以離析及純化，例如藉令反應混合物接受離析操作諸如過濾法、濃縮法及冷卻後萃取法以分離出粗製之反應產物，其後接受慣用之純化操作諸如管柱層析法或再結晶法而成。

本發明通式（1）所代表之化合物自然涵蓋異構體諸如幾何異構體、立體異構體及對映體。

通式（1）所代表之化合物及其鹽可以一般之藥學製劑形式使用。藥學製劑係藉使用常用之稀釋劑或賦形劑諸如填料、延展劑、結合劑、保濕劑、崩解劑、表面活性劑、及潤滑劑等而製得。此藥學製劑方面，可依治療目的而使用各種不同之形式，典型形式包括片劑、丸劑、粉末、溶液、懸浮液、乳膠、顆粒、膠囊、坐藥及注射劑（溶液、懸浮液）。

供定形成片劑方面，可廣泛使用各種型式之技藝中慣例詳知為載體之材料。例如可使用賦形劑諸如乳糖、蔗糖、氯化鈉、葡萄糖、尿素、澱粉、碳酸鈣、高嶺土、晶狀纖維素、及矽酸鹽；結合劑諸如水、乙醇、丙醇、單糖漿、葡萄糖溶液、澱粉溶液、凝膠溶液、羧甲基纖維素、蟲膠、甲基纖維素、磷酸鉀、及聚乙烯基吡咯啉；崩解劑諸如乾化澱粉、藻酸鈉、瓊脂粉、昆布糖粉、碳酸氫鈉、碳酸鈣、聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯、月桂基硫酸

(179)

鈉、硬脂酸單甘油酯、澱粉、及乳糖；崩解作用預防劑諸如蔗糖、三硬脂酸甘油酯、椰子油、及氫化油；吸收劑諸如四級銨鹼及月桂基硫酸鈉；保濕劑諸如甘油及澱粉；吸附劑諸如澱粉、乳糖、高嶺土、膨潤土、及膠態矽石；及潤滑劑諸如純化滑石、硬脂酸酯、硼酸粉、及聚乙二醇。此外，片劑可依所需而包覆上慣用之包衣，例如糖衣片劑、包覆凝膠膠囊之片劑、腸溶片劑、薄膜衣片劑或雙層片劑、及多層片劑。

供定形成丸劑方面，可廣泛使用各種型式之技藝中慣例詳知為載體之材料。例如可使用賦形劑諸如葡萄糖、乳糖、澱粉、椰子油、氫化植物油、高嶺土及滑石；結合劑諸如粉狀阿拉伯膠、粉狀黃蓍膠、凝膠及乙醇；及崩解劑諸如昆布糖及瓊脂。

供定形成坐藥方面，可廣泛使用各種型式之技藝中慣例詳知為載體之材料。其實例包括聚乙二醇、椰子油、高級醇、高級醇之酯類、凝膠、及半合成之甘油酯。

膠囊通常係根據慣用之方法藉將有效成分化合物與上文所例示之各種不同載體混合，再將其填入硬凝膠膠囊或軟凝膠膠囊中而製得。

當製備注射劑時，溶液、乳膠及懸浮液最好予以殺菌並與血液成等張，供形成這些型式方面，技藝中慣用之任何稀釋劑均可使用，例如可使用水、乙醇、聚乙二醇、丙二醇、乙氧基化之異硬脂醇、聚氧化之異硬脂醇、聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯等。

(180)

此狀況下，藥學製劑可含有足量之食鹽、葡萄糖或甘油以製得等張溶液，且慣用之溶解劑、緩衝劑、舒緩劑可予加入。此外，亦可依所需而含有色素、防腐劑、芳香劑、香料、甜化劑及其它藥學劑。

本發明藥學製劑中所含之通式（1）化合物或其鹽之量並未特別限定，通常以佔藥學組成物之 1 至 70 重量 % 較為適當，且以約 1 至 30 重量 % 更佳。

本發明藥學製劑之投服方式並未特別限定且可藉由根據製劑特定形式，病患之年齡、性別及其它狀況，及疾病之嚴重度等而採用之方法投服。例如，如果為片劑、丸劑、溶液、懸浮液、乳膠、顆粒及膠囊，則經口投服。如果為注射劑，可單獨或與慣用之替代流體諸如葡萄糖及胺基酸混合而由靜脈內投服，且，如有需要，則製劑亦可由肌內、皮內、皮下或腹膜內單獨投服。如為坐藥，則投服於直腸內。

本發明藥學製劑之施用劑量乃依劑量攝服法，病患之年齡、性別及其它狀況，及疾病之嚴重度等而加以適當選擇；但適當者，有效成分化合物之量通常每日每 1 公斤體重約 0.1 至 10 毫克。此外又以每劑量單位形式之製劑中所含之有效成分化合物在約 1 至 200 毫克之範圍內更理想。

本發明之化合物具有  $D_2$  受體部分激動劑效應， $5-HT_{2A}$  受體拮抗劑效應及血清素吸收抑制效應（或血清素再吸收抑制效應）。

(181)

D<sub>2</sub> 受體部分激動劑效應意指當其增強時，可抑制多巴胺激導性（DA）神經傳導作用，而當其降低時，則可加速多巴胺激導性（DA）神經傳導，因而具有將多巴胺激導性（DA）神經傳導作用安定化至正常狀態的功能（多巴胺系統安定劑）。根據此功能，故可對異常多巴胺激導性（DA）神經傳導（增強或降低）所致之病況發展出優良之臨床改善效應，例如對正面及負面症狀之改善效應、對認知損害之改善效應及對抑鬱症狀之改善效應，而不發展副作用（參見 Michio Toru: *Seishin-Igaku (Psychiatry)*, Vol. 46, pp. 855-864 (2004), Tetsuro Kikuchi and Tsuyoshi Hirose: *Nou-no-Kagaku (Brain Science)*, Vol. 25, pp. 579-583 (2003) and Harrison, T. S. and Perry, C. M.: *Drugs* 64: 1715-1736, 2004)。

5-HT<sub>2A</sub> 受體拮抗劑效應可降低錐體外副作用並發展優良臨床反應，且有效以改善負面症狀、改善認知損害、改善抑鬱狀況、改善失眠，例如（參見 Jun Ishigooka and Ken Inada: *Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology)*, Vol. 4, pp. 1653- 1664 (2001), Mitsukuni Murasaki: *Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology)*, Vol. 1, pp. 5-22 (1998), Puller, I. A. et al., *Eur. J. Pharmacol.*, 407: 39-46, 2000, and Meltzer, H. Y. et al, *Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry* 27: 1159- 1172, 2003)。



(182)

血清素吸收抑制效應（或血清素再吸收抑制效應）乃有效以改善抑鬱症狀，例如（參見 Mitsukuni Murasaki: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 1, pp. 5-22 (1998)）。

本發明化合物在這三種效應方面均優良，或者其中有一或二種效應顯著地優良。

此外，除了上述效應外，本發明之一些化合物亦具有  $\alpha_1$  受體拮抗劑效應。 $\alpha_1$  受體拮抗劑效應乃有效以改善精神分裂症之正面症狀（參見 Svensson, T. H.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Bol. Psychiatry 27: 1145- 1158, 2003）。

因此，本發明化合物具有廣效性以治療精神分裂症及其它中樞神經系統病症且具有優良之臨床反應。

因此，本發明化合物極有效以治療或預防中樞神經系統病症包括精神分裂症；執拗性、頑固性或慢性精神分裂症；情緒性障礙；精神性病症；情感性病症；雙相病症（例如，第 I 型躁鬱症及第 II 型躁鬱症）；抑鬱症；內源性抑鬱症；重症抑鬱症；憂鬱症及執拗性抑鬱症；情緒不良病症；循環性情感精神病症；焦慮症（例如，恐慌發作，恐慌症，廣場恐怖症，社交恐懼症，強迫症，外傷後壓力症，全身性焦慮症，及急性壓力症等）；軀體形式病症（例如，歇斯底里症，軀體症狀病症，轉化性病症，疼痛病症，疑病症等）；捏造性病症；分裂性病症；性功能病症（例如，性功能障礙，性慾病症，性喚醒病症，勃起

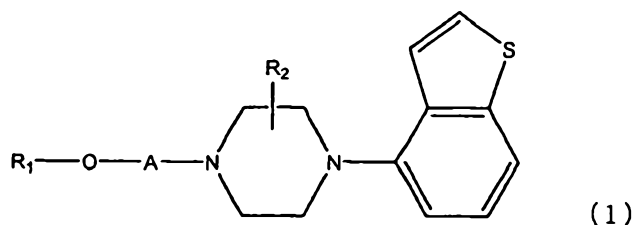
(183)

功能障礙等)；飲食病症(例如，厭食症、飽食症等)；睡眠症；適應病症；物質-相關病症(例如，酒精濫用，酒精中毒，藥物成癮，興奮劑中毒，麻醉劑中毒等)；快感缺乏(例如，醫師原性快感缺乏，精神或心理原因之快感缺乏，與抑鬱症有關之快感缺乏，與精神分裂症有關之快感缺乏等)；譫妄；認知損害；與阿滋海默症有關之認知損害；帕金森氏症及其它神經變性病症；因阿滋海默症，帕金森氏症及相關之神經變性病症所致之認知損害；精神分裂症之認知損害；因執拗性、頑固性或慢性精神分裂症所致之認知損害；嘔吐；動暈症；肥胖症；偏頭痛；疼痛；精神障礙；自閉症；妥瑞氏症；抽搐症；注意力缺乏/過動症；行為障礙；及唐氏症。

此外，本發明化合物僅具有少許或不具副作用，且具有優良之耐受性及安全性。

期望化合物(1)之理想實例如下：

[式 1]



其中  $R^2$  代表氫原子或低級烷基團；

A 代表低級烷撐基團或低級烯撐基團(最好為低級烷撐基團)；且

(184)

$R^1$  代表擇自下列 (I) 至 (IV) 之環 C3-C8 烷基團、芳族基團或雜環型基團：

(I) 環 C3-C8 烷基團 (更理想者為環己基團)；

(II) 擇自苯基團、萘基團、二氫茚基團及四氫萘基團中之芳族基團 (更理想者為苯基團)；

(III) 具有 1 至 4 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中之雜原子之飽和或不飽和雜單環型基團，且其擇自吡咯啉基團、咪唑啉基團、六氫吡啶基團、六氫嘧啶基團、六氫吡嗪基團、氮雜環庚烷基團、氮雜環辛烷基團、吡咯基團、二氫吡咯基團、咪唑基團、二氫咪唑基團、三唑基團、二氫三唑基團、吡唑基團、吡啶基團、二氫吡啶基團、嘧啶基團、二氫嘧啶基團、吡嗪基團、二氫吡嗪基團、噻吩基團、四唑基團、噁唑基團、異噁唑基團、噁二唑基團、噁唑啉基團、異噁唑啉基團、嗎啉基團、噻唑基團、二氫噻唑基團、異噻唑基團、噻二唑基團、二氫噻吩基團、噻唑啉基團、四氫呋喃基團、四氫哌喃基團、哌喃基團、四氫硫代呋喃基團、四氫噻喃基團、噻吩基團及噻喃基團，更理想者為具有 1 至 2 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中之雜原子之飽和或不飽和雜單環型基團，且其擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡唑基團、吡啶基團、嘧啶基團、吡嗪基團、異噁唑基團、噻唑基團、哌喃基團及噻吩基團；尤更理想者為具有 1 至 2 個氮原子之飽和或不飽和雜單環型基團，且其擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡唑基團、吡啶基團、嘧啶基團、及噻唑基團；及

(185)

(IV) 具有 1 至 4 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中之雜原子之苯稠合性雜環型基團，其擇自 (1) 四氫喹啉基團，(2) 四氫喹啉基團，(3) 二氫喹啉基團，(4) 吲哚基團，(5) 吲哚基團，(6) 異吲哚基團，(7) 苯並咪唑基團，(8) 二氫苯並咪唑基團，(9) 四氫苯並氮雜草基團，(10) 四氫苯並二氮雜草基團，(11) 六氫苯並吡啶基團，(12) 二氫苯並噁吡基團，(13) 二氫苯並噁唑基團，(14) 苯並異噁唑基團，(15) 苯並噁二唑基團，(16) 四氫苯並氧氮雜草基團，(17) 二氫苯並噻吡基團，(18) 苯並噻唑基團，(19) 苯並噻嗪基團，(20) 吡嗪基團，(21) 二氫苯並呋喃基團，(22) 呋喃基團，(23) 二苯並呋喃基團及 (24) 喹啉基團。

其中，於  $R^1$  所代表之環 C3-C8 烷基團、芳族基團及雜環型基團上，可存在 1 至 5 個（最好 1 至 3 個）擇自下列 (1) 至 (66) 中之基團以作為取代基：

- (1) 低級烷基團，
- (2) 低級烯基團，
- (3) 經鹵素取代之低級烷基團，
- (4) 低級烷氧基團，
- (5) 苯氧基團，
- (6) 低級烷硫基團，
- (7) 經鹵素取代之低級烷氧基團，
- (8) 羥基團，

(186)

( 9 ) 苯基低級烷基氧基團，

( 10 ) 羥基低級烷基團，

( 11 ) 低級烷基氧基低級烷基團，

( 12 ) 鹵素原子，

( 13 ) 氰基團，

( 14 ) 苯基芳基團，

( 15 ) 硝基團，

( 16 ) 胺基團，

( 17 ) 胺基團 ( 其具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團、低級烷磺醯基團、胺基甲醯基團、低級烷基胺基甲醯基團、胺基低級烷醯基團、低級烷醯胺基低級烷醯基團及低級烷氧基羰胺基低級烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ( 更理想者為 N-低級烷胺基團、N,N-二低級烷胺基團、N-低級烷醯胺基團、N-低級烷氧基羰胺基團、N-低級烷磺醯胺基團、N-低級烷基-N-低級烷醯胺基團、N-低級烷基-N-低級烷氧基羰胺基團、N-[胺基甲醯基]胺基團、N-[N-低級烷基胺基甲醯基]胺基團、N-[N,N-二低級烷基胺基甲醯基]胺基團、N-[胺基低級烷醯基]胺基團、N-[N-[低級烷醯胺基]低級烷醯基]胺基團、或 N-[N-[低級烷氧基羰胺基]低級烷醯基]胺基團 ) ；

( 18 ) 低級烷醯基團，

( 19 ) 苯磺醯基團 ( 其可於苯基團上具有低級烷基團 ) ( 更理想者為低級烷基苯磺醯基團 ) ，

( 20 ) 羧基團，

(187)

( 21 ) 低級烷氧羰基團，

( 22 ) 羧基低級烷基團，

( 23 ) 低級烷氧羰基低級烷基團，

( 24 ) 低級烷醯胺基低級烷醯基團，

( 25 ) 羧基低級烯基團，

( 26 ) 低級烷氧羰基低級烯基團，

( 27 ) 胺基甲醯基低級烯基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團及經 1 至 3 個鹵素原子取代之低級烷基團中之基團以作為取代基 ) ( 更理想者為胺基甲醯基低級烯基團、N-低級烷基胺基甲醯基低級烯基團、N,N-二低級烷基胺基甲醯基低級烯基團、或 N-[經 1 至 3 個鹵素原子取代之低級烷基]胺基甲醯基低級烯基團 )，

( 28 ) 胺基甲醯基團，其可具有 1 至 2 個擇自下列 ( i ) 至 ( lxxviii ) 中之基團以作為取代基：

( i ) 低級烷基團，

( ii ) 低級烷氧基團，

( iii ) 羥基低級烷基團，

( iv ) 低級烷氧基低級烷基團，

( v ) 苯氧基低級烷基團，

( vi ) 經鹵素取代之低級烷基團，

( vii ) 胺基低級烷基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、苯甲醯基團及胺基甲醯基團中之基團 ) ( 更理想者為 N,N-二低級烷胺基低級烷基團、N-低級烷醯胺基低級烷基團、N-低級烷基-N-低級烷醯胺基

(188)

低級烷基團、N-低級烷基-N-苯甲醯基胺基低級烷基團、或N-胺基甲醯基胺基低級烷基團)，

(viii) 環 C3-C8 烷基團（其可具有 1 至 3 個，最好 1 至 2 個，尤其 1 個擇自低級烷基團、羥基團、低級烷氧羰基團及苯基低級烷氧基團中之基團以作為取代基），

(ix) 經環 C3-C8 烷基取代之低級烷基團，

(x) 低級烯基團，

(xi) 具 1 至 2 個胺基甲醯基團之低級烷基團（其可具有 1 至 2 個，最好 1 個擇自低級烷基團、苯基團（可具有單一之低級烷基團）及苯基團（可具有單一之低級烷氧基團）中之基團以作為取代基）（更理想者為胺基甲醯基低級烷基團、二胺基甲醯基低級烷基團、N-低級烷基胺基甲醯基低級烷基團、N,N-二低級烷基胺基甲醯基低級烷基團、N-[低級烷苯基]胺基甲醯基低級烷基團、或 N-[低級烷氧基苯基]胺基甲醯基低級烷基團），

(xii) 具有 1 至 2 個低級烷氧羰基團之低級烷基團，

(xiii) 呋喃基低級烷基團（其可於呋喃基團上具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），

(xiv) 四氫呋喃基低級烷基團，

(xv) 1,3-二噁茂烷基低級烷基團，

(xvi) 四氫吡喃基低級烷基團，

(xvii) 吡咯基低級烷基團（其可於吡咯基團上具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），

(xviii) 二氫吡啶基低級烷基團（其可具有單一之酮

(189)

基團) ,

( xix ) 吡啶基低級烷基團 ( 其可於吡啶基團上具有 1 至 3 個低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xx ) 咪啶基低級烷基團 ,

( xxi ) 吡啶基低級烷基團 ,

( xxii ) 吡啶基低級烷基團 ( 其可於吡啶基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xxiii ) 吡咯啶基低級烷基團 ( 其可於吡咯啶基團上具有 1 至 2 個擇自酮基團及低級烷基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxiv ) 六氫吡啶基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自苯甲醯基團及低級烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxv ) 六氫吡啶基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xxvi ) 嗎啉基低級烷基團 ,

( xxvii ) 噻吩基低級烷基團 ( 其可於噻吩基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷基團以作為取代基 ) ,

( xxviii ) 噻啶基低級烷基團 ,

( xxix ) 二氫苯並呋喃基低級烷基團 ,

( xxx ) 苯並呋喃基低級烷基團 ( 其可於苯並呋喃基團上具有單一之酮基團以作為取代基 ) ,

( xxxi ) 苯並咪啶基低級烷基團 ,



(190)

( xxxii ) 吡啶基低級烷基團 ( 其可於低級烷基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷氧羰基團 ) ,

( xxxiii ) 咪唑基低級烷基團 ( 其可於低級烷基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自胺基甲醯基團及低級烷氧羰基團中之取代基 ) ,

( xxxiv ) 吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷基團、低級烷氧基團及低級烷硫基低級烷基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxxv ) 吡咯啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷基團、低級烷氧羰基團、低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxxvi ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷基團、低級烷氧羰基團、低級烷醯基團及苯甲醯基團 ( 其可於苯基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷基團及鹵素原子中之基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ,

( xxxvii ) 四氫呋喃基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( xxxviii ) 六氫氮雜草基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( xxxix ) 吡唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷基團、苯基團及呋喃基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xl ) 噻唑基團 ,

(191)

( xli) 噻二唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷基團 ) ,

( xlii) 異噻唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 低級烷基團 ) ,

( xliii) 吡唑基團 ,

( xliv) 吡啶基團 ,

( xlv) 四氫苯並噻唑基團 ,

( xlvi) 四氫喹啉基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 擇自低級烷基團、低級烷氧基團、鹵素原子及酮基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xlvii) 喹啉基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷基團 ) ,

( xlviii) 苯並二噁茂基低級烷基團 ,

( xlix) 苯基團或萘基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自

鹵素原子 ; 低級烷基團 ; 低級烷氧基團 ; 經鹵素取代之低級烷基團 ; 經鹵素取代之低級烷氧基團 ; 低級烯基團 ; 胺基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自低級烷醯基團 , 低級烷磺醯基團 , 低級烷基團及芳基團中之基團 ) ; 胺基磺醯基團 ; 低級烷硫基團 ; 低級烷醯基團 ; 低級烷氧羰基團 ; 吡咯基團 ; 低級炔基團 ; 氰基團 ; 硝基團 ; 苯氧基團 ; 苯基低級烷氧基團 ; 羥基團 ; 羥基低級烷基團 ; 胺基甲醯基團 ( 其可具有擇自低級烷基及苯基團中之基團 ) ; 吡唑基團 ; 吡咯啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ; 噁唑基團 ; 咪唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 低級烷基

(192)

團)；二氫呋喃基團(其可具有單一之酮基團)；噻唑啉基低級烷基團(其可具有兩個酮基團)；咪唑基低級烷醯基團及六氫吡啶羰基團中之取代基)，

(1) 氰基低級烷基團，

(li) 二氫喹啉基團(其可具有1至3個(最好1至2個)擇自低級烷基團及酮基團中之基團)，

(lii) 經鹵素取代之低級烷基胺基團，

(liii) 低級烷硫基低級烷基團，

(liv) 脒基團(其可具有1至2個低級烷基團)，

(lv) 脒基低級烷基團，

(lvi) 低級烯氧基低級烷基團，

(lvii) 苯胺基團(其可於苯基團上具有1至3個(最好1個)擇自低級烷基團，低級烷氧基團，經鹵素取代之低級烷基團及經鹵素取代之低級烷氧基團中之取代基)，

(lviii) 苯基低級烯基團，

(lix) 吡啶基胺基團(其可具有1至3個(最好1至2個)低級烷基團)(更理想者為N-低級烷基-N-[低級烷基吡啶基]胺基團)，

(lx) 苯基低級烷基團(其可於苯基團及/或低級烷基團上具有1至3個(最好1至2個)擇自鹵素原子，低級烷基團，經鹵素取代之烷基團，經鹵素取代之低級烷氧基團，低級烷氧基團，胺基甲醯基團，及低級烷氧羰基團中之基團以作為取代基)，

(193)

( lxi ) 低級炔基團，

( lxii ) 苯氧基低級烷基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自低級烷氧基團，N-低級烷氧基-N-低級烷基胺基甲醯基團，及酮基吡咯啉基團中之基團以作為取代基），

( lxiii ) 異噁唑啉基團（其可具有單一之酮基團），

( lxiv ) 二氫茛基團，

( lxv ) 苯基低級烷氧基低級烷基團，

( lxvi ) 四氫哌喃基團，

( lxvii ) 吡啶基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團），

( lxviii ) 吡啶基低級烷基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團），

( lxix ) 四唑基團，

( lxx ) 吡啶基團（其可具有單一之酮基團），

( lxxi ) 三唑基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自低級烷基團及低級烷硫基團中之基團），

( lxxii ) 咪唑基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）胺基甲醯基團），

( lxxiii ) 噁唑基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）低級烷基團），

( lxxiv ) 異噻唑基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）低級烷基團），

(194)

( lxxv ) 苯並咪唑基團，

( lxxvi ) 二氫苯並噻唑基團（其可具有單一之酮基團），

( lxxvii ) 噻吩基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）低級烷氧羰基團），

( lxxviii ) 噁唑基低級烷基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）低級烷基團），

( 29 ) 胺基低級烷基團（其可於胺基團上具有 1 至 2 個擇自低級烷基團，經鹵素取代之低級烷基團，低級烷氧羰基團，低級烷醯基團，苯基團，苯基低級烷基團，苯甲醯基團，及經胺基取代之烷基團（胺基團上可具有 1 至 2 個（最好 2 個）低級烷基團以作為取代基）中之基團），

( 30 ) 經單一之胺基甲醯基團取代之低級烷基團（其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），

( 31 ) 硫代胺基甲醯基團（其可具有 1 至 2 個（最好 1 個）低級烷基團），

( 32 ) 胺基磺醯基團，

( 33 ) 噁唑啉基團（其可具有單一之酮基團）（更理想者為經單一酮基團取代之噁唑啉基團），

( 34 ) 咪唑啉基團（其可具有 1 至 2 個擇自酮基團及低級烷基團中之基團），

( 35 ) 吡咯啉基團（其可具有單一之酮基團），

( 36 ) 咪唑基團，

(195)

( 37 ) 三唑基團，

( 38 ) 異噁唑基團，

( 39 ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個，最好 1 至 2 個，尤其 1 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷基苯磺醯基團、酮基團、羥基團及胺基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團及低級烷醯胺基低級烷醯基團中之基團 ) 中之取代基 ) ( 更理想者為六氫吡啶基團，其可具有 1 至 3 個，最好 1 至 2 個，尤其 1 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷基苯磺醯基團、酮基團、羥基團、胺基團、N-低級烷胺基團、N,N-二低級烷胺基團、N-低級烷醯胺基團、N-低級烷基-N-低級烷氧基羰胺基團、N-低級烷基-N-低級烷醯胺基團、及 N-低級烷醯胺基低級烷醯胺基團中之基團 )，

( 40 ) 六氫吡啶基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 擇自低級烷基團，羥基團，羥基低級烷基團，低級烷醯基團，羰基低級烷基團，低級烷基胺基甲醯基低級烷基團，胺基甲醯基團，低級烷氧基團，羰基團，低級烷氧羰基團，胺基團 ( 其上可存在 1 至 2 個擇自低級烷基團，低級烷醯基團，低級烷氧羰基團及苯甲醯基團中之基團 )，六氫吡啶基團 ( 其上可存在 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷醯基團，低級烷氧羰基團及苯甲醯基團中之基團 )，六氫吡啶基團 ( 其上可存在 1 至 3 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 低級烷基團以作為取代基 )，1,4-二氧雜-8-氮雜螺 [4.5]癸基團，嗎啉基團，六氫-1,4-二氮雜草基團 ( 其上可

(196)

存在單一之低級烷基團以作為取代基)，吡啶基團，吡啶氧基團，吡啶基低級烷氧基團，四氫喹啉基團（其上可存在單一之酮基團），苯並二噁茂基團，苯基低級烷氧基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷氧基團中之基團），苯基團（其上可存在 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自鹵素原子，低級烷氧基團及羥基團中之基團），苯氧基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自氰基團，鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），苯基低級烷基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自鹵素原子，低級烷基團，低級烷氧基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團），及苯甲醯基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自鹵素原子及低級烷氧基團中之基團）中之基團），

（41）吡咯啉基羰基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自羥基低級烷基團，胺基甲醯基團，羥基團，胺基團（胺基團上可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團，低級烷醯基團及苯甲醯基團中之基團），嗎啉基低級烷基團，吡咯啉基低級烷基團，六氫吡啶基低級烷基團，六氫吡啶基低級烷基團（六氫吡啶基團上可具有單一之低級烷基團以作為取代基），胺基低級烷基團（胺基團上可具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），苯氧基團（苯基團上可具有 1 至 3 個（最好 1 個）經鹵素取代之低級烷氧基團），苯

(197)

氧基低級烷基團（苯基團上可具有 1 至 3 個（最好 1 個）經鹵素取代之低級烷氧基團），及四氫喹啉基團（其上可存在酮基團）中之基團），

（42）六氫吡咩基羰基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自低級烷基團，環 C3-C8 烷基團，低級烷醯基團，羥基低級烷基團，低級烷氧基低級烷基團，低級烷氧羰基團，胺基低級烷基團（胺基團上可具有 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基），六氫吡啶基低級烷基團（六氫吡啶基團上可具有 1 至 2 個（最好 1 個）低級烷基團以作為取代基），嗎啉基低級烷基團，吡咯啶基低級烷基團，1,3-二噁茂烷基低級烷基團，四氫呋喃基低級烷基團，吡啶基低級烷基團（低級烷基團上可具有 1 至 2 個（最好 1 個）苯基團以作為取代基），咪唑基低級烷基團，呋喃基低級烷基團，吡咯啶基羰基低級烷基團，六氫吡啶基團（其可具有 1 至 2 個（最好 1 個）低級烷基團以作為取代基），吡啶基團（吡啶基團上可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自低級烷基團，氰基團，及經鹵素取代之低級烷基團中之基團以作為取代基），噻吩並[2,3-b]吡啶基團，苯基團（其上可存在 1 至 3 個（最好 1 個）擇自鹵素原子及低級烷基團中之基團），苯甲醯基團，呋喃基羰基團，苯基低級烷氧羰基團及酮基團中之基團），

（43）六氫氮雜草基羰基團，

（44）六氫-1,4-二氮雜草基羰基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）擇自低級烷基團及吡啶基團中之取代



(198)

基 ) ,

( 45 ) 二氫吡咯基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 至 2 個 ) 低級烷基團 ) ,

( 46 ) 硫代嗎啉基羰基團 ,

( 47 ) 嗎啉基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷基團、六氫吡啶基低級烷基團、及苯基團中之基團 ) ,

( 48 ) 噻唑啶基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 苯基團且苯基團可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 擇自低級烷氧基團及氰基團中之基團 ) ,

( 49 ) 氮雜二環 [3.2.2] 壬基羰基團 ,

( 50 ) 8-氮雜二環 [3.2.1] 辛基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 經鹵素取代或未經取代之苯氧基團 ) ,

( 51 ) 吲哚啉基羰基團 ,

( 52 ) 四氫喹啉基羰基團 ,

( 53 ) 四氫吡啶並 [3.4-b] 吲哚基羰基團 ,

( 54 ) 嗎啉基低級烷基團 ,

( 55 ) 六氫吡啶基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷基團 ) ,

( 56 ) 嗎啉基羰基低級烷基團 ,

( 57 ) 六氫吡啶基羰基低級烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) 低級烷基團 ) ,

( 58 ) 酮基團 ,

( 59 ) 胺基低級烷氧基團 ( 其可於胺基團上具有 1 至

(199)

2 個（最好 2 個）低級烷基團），

（60）低級烷氧基低級烷氧基團，

（61）六氫吡咩基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自酮基團、低級烷基團、低級烷醯基團及低級烷氧羰基團中之基團）（更理想者為經一酮基團取代之六氫吡咩基團、經單一低級烷基團取代之六氫吡咩基團、經單一低級烷醯基團取代之六氫吡咩基團、經單一酮基團及單一低級烷醯基團取代之六氫吡咩基團、及經單一酮基團及單一低級烷氧羰基團取代之六氫吡咩基團），

（62）嗎啉基團，

（63）1,3,8-三氮雜螺[4.5]癸基羰基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 至 2 個）擇自酮基團及苯基團中之基團），

（64）四氫吡啶基羰基團（其可具有 1 至 3 個（最好 1 個）吡啶基團），

（65）咪唑啶基羰基團（其可具有單一之硫酮基團），

（66）1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基團。

通式（1）中，理想之  $R^1$  為環己基團、苯基團、吡咯啶基團、六氫吡啶基團、吡唑基團、吡啶基團、嘧啶基團、或噻唑基團。每一基團中之環最好經 1 至 3 個擇自下列之基團所取代：

（1）低級烷基團，

（4）低級烷氧基團，

(200)

( 10 ) 羧基低級烷基團，

( 17 ) 胺基團 ( 其具有 1 至 2 個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷氧羰基團、低級烷磺醯基團、胺基甲醯基團、低級烷基胺基甲醯基團、胺基低級烷醯基團、低級烷醯胺基低級烷醯基團及低級烷氧基羰胺基低級烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ，

( 21 ) 低級烷氧羰基團，

( 28 ) 胺基甲醯基團，其可具有 1 至 2 個擇自下列 ( i ) 、 ( ii ) 、 ( iv ) 、 ( xii ) 及 ( xxi ) 中之基團以作為取代基：

( i ) 低級烷基團，

( ii ) 低級烷氧基團，

( iv ) 低級烷氧基低級烷基團，

( xii ) 有 1 至 2 個低級烷氧羰基團之低級烷基團，

( xxi ) 吡啶基低級烷基團，

( 29 ) 胺基低級烷基團 ( 其可於胺基團上具有 1 至 2 個擇自低級烷基團，經鹵素取代之低級烷基團，低級烷氧羰基團，低級烷醯基團，苯基團，苯基低級烷基團，苯甲醯基團，及經胺基取代之烷基團 ( 胺基團上可存在 1 至 2 個低級烷基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ，

( 30 ) 經單一之胺基甲醯基團取代之低級烷基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自低級烷基團及經鹵素取代之低級烷基團中之基團 ) ，

( 33 ) 噁唑啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ，

(201)

(34) 咪唑啉基團 (其可具有 1 至 2 個擇自酮基團及低級烷基團中之基團) ,

(35) 吡咯啉基團 (其可具有單一之酮基團) ,

(36) 咪唑基團 ,

(39) 六氫吡啶基團 (其可具有單一個擇自低級烷基團、低級烷醯基團、低級烷基苯磺醯基團、酮基團、羥基團、胺基團、N-低級烷胺基團、N,N-二低級烷胺基團、N-低級烷醯胺基團、N-低級烷基-N-低級烷氧基羰胺基團、N-低級烷基-N-低級烷醯胺基團及 N-低級烷醯胺基低級烷醯胺基團中之取代基) ,

(61) 六氫吡啶基團 (其可具有 1 至 2 個擇自酮基團、低級烷基團、低級烷醯基團及低級烷氧羰基團中之基團) , 及

(62) 嗎啉基團。

## 【實施方式】

本發明將經由下列之參考實例、實例及藥學實驗實例及製備實例而更加明瞭。

### 參考實例 1

#### 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶氫氨酸鹽之合成

將含有 14.4 克 4-溴基苯並[b]噻吩, 29.8 克六氫吡啶酐, 9.3 克第三丁醇鈉, 0.65 克 (R) - (+) -2,2'-雙(二苯膦基)-1,1'-聯萘 (BINAP), 0.63 克參(二苄叉丙

(202)

酮) 二鈹 (0) 及 250 毫升甲苯之混合液於氮氣層下邊加熱邊迴流一小時。將水倒至反應溶液中，而後以乙酸乙酯萃取，以水清洗及於硫酸鎂上乾燥。繼而將溶劑於減壓下蒸發。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析 (二氯甲烷：甲醇：25 % 氨水 = 100：10：1) 予以純化，即得 9.5 克黃色油狀之 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶。

而後將 3.7 毫升濃氫氯酸加至 9.5 克 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶之甲醇溶液中，再將溶劑於減壓下蒸發。而後將乙酸乙酯加至所得餘留物中，再藉過濾法以得沉澱之結晶。由甲醇中予以再結晶後，即得無色針狀結晶之 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶氫氯酸鹽。

熔點 276-280°C

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm: 3.25-3.35 (8H, m), 6.94 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.30 (1H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, d,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 7.68 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.73 (1H, d,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 9.35 (2H, brs)。

## 參考實例 2

4-苯並[b]噻吩-4-基-3-甲基六氫吡啶-1-羧酸第三丁酯之合成

標題化合物係依與參考實例 1 相同之方法，使用 3-甲基六氫吡啶-1-羧酸第三丁酯及 4-溴基苯並[b]噻吩製得。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm: 1.85-1.95 (3H, m), 1.50

(203)

( 9H , s , 2.8-2.9 ( 1H , m ) , 3.15-3.35 ( 2H , m ) , 3.4-3.5 ( 1H , m ) , 3.5-3.65 ( 1H , m ) , 3.65-3.7 ( 1H , m ) , 3.7-3.9 ( 1H , m ) , 6.98 ( 1H , d ,  $J=7.5\text{ Hz}$  ) , 7.29 ( 1H , dd ,  $J=8\text{ Hz}$  ,  $J=8\text{ Hz}$  ) , 7.38 ( 1H , d ,  $J=5.5\text{ Hz}$  ) , 7.61 ( 1H , d ,  $J=8\text{ Hz}$  ) 。

### 參考實例 3

#### 1-苯並[b]噻吩-4-基-2-甲基六氫吡啶二氫氯酸鹽之合成

將三氟乙酸 ( 6 毫升 ) 加至 1.22 克 ( 3.7 毫莫耳 ) 4-苯並[b]噻吩-4-基-3-甲基六氫吡啶-1-羧酸第三丁酯之二氯甲烷液 ( 12 毫升 ) 中 , 再將混合物於室溫下攪拌一小時。而後將反應混合物於減壓下濃縮 , 將 5 % 水性碳酸鉀溶液加至餘留物中 , 再將所得混合物以二氯甲烷萃取。繼而將以二氯甲烷萃取之溶液於硫酸鎂上乾燥 , 其後於減壓下濃縮。將濃氫氯酸 ( 0.6 毫升 ) 及甲醇 ( 10 毫升 ) 加至所得餘留物中 , 再將所得混合物於減壓下濃縮。令所得餘留物由乙腈中予以再結晶 , 即得淡棕色粉狀之 1-苯並[b]噻吩-4-基-2-甲基六氫吡啶二氫氯酸鹽 ( 0.98 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{DMSO-d}_6$  )  $\delta$  ppm : 0.92 ( 3H , d ,  $J=6.5\text{ Hz}$  ) , 2.8-3.6 ( 6H , m ) , 3.6-4.0 ( 1H , m ) , 5.3-6.8 ( 1H , m ) , 7.20 ( 1H , br ) , 7.38 ( 1H , dd ,  $J=8\text{ Hz}$  ,  $J=8\text{ Hz}$  ) , 7.5-8.0 ( 3H , m ) , 9.4-10.1 ( 2H , m ) 。

### 參考實例 4

(204)

## 1-苯並[b]噻吩-4-基-3-甲基六氫吡咩二氫氨酸鹽之合成

標題化合物係依與參考實例 1 相同之方法，使用 2-甲基六氫吡咩及 4-溴基苯並[b]噻吩製得。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm: 1.34 (3H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ) , 2.85-2.95 (1H, m) , 3.05-3.15 (1H, m) , 3.2-3.6 (6H, m) , 6.97 (1H, d,  $J=7.5\text{Hz}$ ) , 7.31 (1H, dd,  $J=8\text{Hz}$ ,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.54 (1H, d,  $J=5.5\text{Hz}$ ) , 7.69 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.75 (1H, d,  $J=5.5\text{Hz}$ ) , 9.2-9.3 (1H, m) , 9.64 (1H, br) 。

## 參考實例 5

## 3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙酸乙酯之合成

將 5.05 克 (19.8 毫莫耳) 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩二氫氨酸鹽加至氫氧化鈉水性溶液中，再將混合物以二氯甲烷萃取。而後將萃取溶液於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。令所得餘留物溶於 50 毫升乙醇中，再將丙烯酸乙酯 (2.44 毫升, 21.8 毫莫耳) 加入，而後將反應混合物邊加熱邊迴流 4 小時。繼而將反應溶液冷卻至室溫及於減壓下濃縮。將異丙醚加至餘留物中，藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，以異丙醚清洗並予乾燥，即得白色粉狀之 3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙酸乙酯 (5.26 克)。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm: 1.28 (3H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ) , 2.50-2.63 (2H, m) , 2.67-2.87 (6H, m) , 3.11-3.24 (4H, m) , 4.17 (2H, q,  $J=7.0\text{Hz}$ ) , 6.89 (1H, d,

(205)

$J=7.8\text{ Hz}$  ) ,  $7.27$  (  $1\text{ H}$  ,  $t$  ,  $J=7.8\text{ Hz}$  ) ,  $7.37\text{-}7.42$  (  $2\text{ H}$  ,  $m$  ) ,  $7.55$  (  $1\text{ H}$  ,  $d$  ,  $J=7.8\text{ Hz}$  ) 。

#### 參考實例 6

##### 3- ( 4-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩 -1-基 ) 丙 -1-醇 之 合成

將 氫化鋰鋁 (  $1.18$  克 ,  $24.8$  毫莫耳 ) 加至於冰冷卻下之  $5.26$  克 (  $16.5$  毫莫耳 ) 3- ( 4-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩 -1-基 ) 丙酸乙酯之四氫呋喃 ( THF ) 溶液 (  $55$  毫升 ) 中 , 再將混合物於室溫下攪拌  $4$  小時。將水 (  $1.2$  毫升 ) ,  $15\%$  水性氫氧化鈉溶液 (  $1.2$  毫升 ) , 及水 (  $3.6$  毫升 ) 依此次序加至反應溶液中 , 再將混合物於室溫下攪拌。將不可溶之物質藉過濾法移除 , 將濾液於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 =  $3:2 \rightarrow$  乙酸乙酯 ) 予以純化 , 而後於減壓下濃縮至乾 , 即得白色粉狀之 3- ( 4-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩 -1-基 ) 丙 -1-醇 (  $0.23$  克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta\text{ ppm}$  :  $1.75\text{-}1.85$  (  $2\text{ H}$  ,  $m$  ) ,  $2.74$  (  $2\text{ H}$  ,  $t$  ,  $J=5.8\text{ Hz}$  ) ,  $2.75\text{-}2.85$  (  $4\text{ H}$  ,  $m$  ) ,  $3.15\text{-}3.25$  (  $4\text{ H}$  ,  $m$  ) ,  $3.85$  (  $2\text{ H}$  ,  $t$  ,  $J=5.3\text{ Hz}$  ) ,  $5.19$  (  $1\text{ H}$  ,  $\text{br s}$  ) ,  $6.88$  (  $1\text{ H}$  ,  $d$  ,  $J=7.6\text{ Hz}$  ) ,  $7.27$  (  $1\text{ H}$  ,  $dd$  ,  $J=7.9\text{ Hz}$  ,  $J=7.8\text{ Hz}$  ) ,  $7.39$  (  $2\text{ H}$  ,  $s$  ) ,  $7.56$  (  $1\text{ H}$  ,  $d$  ,  $J=8.0\text{ Hz}$  ) 。

#### 參考實例 7



(206)

乙酸 4- ( 4-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩 -1-基 ) 丁酯之合成  
 令 1.0 克 ( 3.9 毫莫耳 ) 1-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩  
 氫氨酸鹽懸浮於 20 毫升二甲基甲醯胺 ( DMF ) 中，再將  
 碳酸鉀 ( 1.3 克， 9.4 毫莫耳 ) 及乙酸 4-溴乙酯 ( 0.7 毫  
 升， 4.8 毫莫耳 ) 加入。而後將反應混合物於 80℃ 下攪拌  
 6 小時，冷卻至室溫，將水加入，並以乙酸乙酯萃取。而  
 後將有機相以水清洗，於硫酸鈉上乾燥，及於減壓下濃  
 縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析 ( 二氯甲烷：甲醇  
 =30：1 ) 予以純化，而後於減壓下濃縮至乾，即得淡黃色  
 固狀之乙酸 4- ( 4-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩 -1-基 ) 丁酯  
 ( 0.72 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 1.60-1.73 ( 4H , m ) , 2.07  
 ( 3H , s ) , 2.47 ( 2H , t ,  $J=7.2\text{Hz}$  ) , 2.60-2.72 ( 4H ,  
 m ) , 3.17-3.22 ( 4H , m ) , 4.11 ( 2H , t ,  $J=6.3\text{Hz}$  ) ,  
 6.90 ( 1H , d ,  $J=7.6\text{Hz}$  ) , 7.27 ( 1H , dd ,  $J=7.6\text{Hz}$  ,  
 $J=8.0\text{Hz}$  ) , 7.37-7.42 ( 2H , m ) , 7.55 ( 1H , d ,  
 $J=8.0\text{Hz}$  ) 。

#### 參考實例 8

4- ( 4-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩 -1-基 ) 丁 -1-醇之合成

將碳酸鉀 ( 3.87 克， 28 毫莫耳 ) 加至 7.76 克 ( 23.3  
 毫莫耳 ) 乙酸 4- ( 4-苯並 [b]噻吩 -4-基 -六氫吡 咩 -1-基 ) 丁  
 酯之 90 % 甲醇溶液 ( 150 毫升 ) 中。再將混合溶液於室溫  
 下攪拌 2 小時。而後將水加至反應溶液中，繼而以二氯甲

(207)

烷萃取。將萃取溶液於硫酸鈉上乾燥及於減壓下濃縮。再將餘留物藉矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=2：1→1：1）予以純化，而後於減壓下濃縮，即得無色油狀之 4-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丁-1-醇（6.65克）。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm: 1.60-1.74 (4H, m), 2.50-2.55 (2H, m), 2.70-2.80 (4H, m), 3.20-3.30 (4H, m), 3.60-3.63 (2H, m), 6.2 (1H, brs), 6.90 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.27 (1H, dd,  $J=7.6\text{Hz}$ ,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.39 (1H, s), 7.56 (1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ )。

#### 參考實例 9

##### 1-苯並[b]噻吩-4-基-4-（3-氯丙基）六氫吡啶之合成

令 3.56 克（12.9 毫莫耳）3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙-1-醇懸浮於 30 毫升二氯甲烷中，再將四氯化碳（30 毫升）及三苯磷（4.06 克，15.5 毫莫耳）加入。而後將混合物邊加熱邊迴流 3 小時。繼而將反應溶液冷卻至室溫，而後將甲醇及二氯甲烷加入以將混合物均質化。將矽膠（30 克）加至溶液中，再將溶劑於減壓下蒸發。繼而將所得餘留物負載於矽膠柱（300 克）上並以正己烷：乙酸乙酯=2：1 之溶劑混合液萃取。將萃取溶液於減壓下濃縮，即得無色油狀之 1-苯並[b]噻吩-4-基-4-（3-氯丙基）六氫吡啶（2.36 克）。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.60

(208)

( 2H , t ,  $J=7.2\text{Hz}$  ) , 2.65-2.75 ( 4H , m ) , 3.15-3.25 ( 4H , m ) , 3.65 ( 2H , t ,  $J=6.6\text{Hz}$  ) , 6.89 ( 1H , dd ,  $J=7.6\text{Hz}$  ,  $J=0.7\text{Hz}$  ) , 7.27 ( 1H , dd ,  $J=7.9\text{Hz}$  ,  $J=7.8\text{Hz}$  ) , 7.38 ( 1H , d ,  $J=5.6\text{Hz}$  ) , 7.41 ( 1H , d ,  $J=5.7\text{Hz}$  ) , 7.55 ( 1H , d ,  $J=8.0\text{Hz}$  ) 。

#### 參考實例 10

##### 4-羥基噻吩-2-羧酸甲酯之合成

將亞硫醯氯 ( 1.6 毫升 ) 於冰冷卻下逐滴加至 4-羥基噻吩-2-羧酸 ( 1.1 克 , 7.6 毫莫耳 ) 之甲醇溶液 ( 20 毫升 ) 中。再將混合溶液邊加熱邊迴流 5 小時。而後將反應溶液冷卻至室溫, 倒至冰水中並以乙酸乙酯萃取。將以乙酸乙酯萃取之溶液於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。再將餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 4 : 1 ) 予以純化, 而後於減壓下濃縮 / 乾燥, 即得白色粉狀之 4-羥基噻吩-2-羧酸甲酯 ( 0.7 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 3.90 ( 3H , s ) , 5.50-6.60 ( 1H , br ) , 6.64 ( 1H , d ,  $J=1.9\text{Hz}$  ) , 7.43 ( 1H , d ,  $J=1.8\text{Hz}$  ) 。

#### 參考實例 11

##### 6-羥基嘧啶-4-羧酸乙酯之合成

標題化合物係依與參考實例 10 相同之方法, 使將用 6-羥基嘧啶-4-羧酸而得。

(209)

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 1.29 ( 3H , t ,  $J=7.0\text{Hz}$  ) , 4.29 ( 2H , q ,  $J=7.0\text{Hz}$  ) , 6.87 ( 1H , d ,  $J=1.0\text{Hz}$  ) , 8.27 ( 1H , d ,  $J=1.0\text{Hz}$  ) , 10.54 ( 1H , br ) 。

### 參考實例 12

#### 5-羥基-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯之合成

將乙炔二羧酸二甲酯 ( 5.0 克 , 35 毫莫耳 ) 之乙醚溶液 ( 35 毫升 ) 以冷凍媒介 ( 鹽及冰 ) 冷卻。邊保持溫度於  $0^\circ\text{C}$  或更低 , 邊將甲胛 ( 0.63 毫升 , 35 毫莫耳 ) 之乙醚溶液 ( 15 毫升 ) 逐滴加至此溶液中。逐滴加入完全後 , 將溶液於  $0^\circ\text{C}$  下攪拌一小時。而後藉過濾法以得沉澱之不可溶物質 , 再以乙醚清洗。繼而將濾塊加熱至  $130^\circ\text{C}$  30 分鐘 , 再冷卻至室溫。將甲醇加至此濾塊中 , 其後於減壓下濃縮。將乙酸乙酯加至餘留物中 , 藉過濾法以得沉澱之不可溶物質 , 以乙酸乙酯清洗 , 並予乾燥 , 即得淡黃色粉狀之 5-羥基-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯 ( 3.26 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{DMSO}-d_6$  )  $\delta$  ppm : 3.58 ( 3H , s ) , 3.73 ( 3H , s ) , 5.77 ( 1H , s ) , 11.41 ( 1H , br ) 。

### 參考實例 13

#### 6-氨基-N-(2,2,2-三氟乙基)菸鹼鹽胺之合成

將三乙胺 ( 1.03 毫升 , 7.4 毫莫耳 ) 及氯甲酸異丁酯 ( 0.76 毫升 , 5.5 毫莫耳 ) 加至於冰冷卻下之 6-氨基菸鹼酸 ( 0.58 克 , 3.6 毫莫耳 ) 之乙腈溶液 ( 12 毫升 ) 中 , 再

(210)

將混合物於 0℃ 下攪拌 30 分鐘。而後將 2,2,2-三氟乙胺 (0.88 毫升, 11.2 毫莫耳) 加至此混合溶液中, 再將混合物於室溫下攪拌 10 分鐘。將水加至反應溶液中, 而後以乙酸乙酯萃取。將以乙酸乙酯萃取之溶液於硫酸鎂上乾燥, 及於減壓下濃縮。再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯 = 5: 1 → 1: 1) 予以純化。將純化產物於減壓下濃縮, 再將異丙醚及正己烷加入。而後藉過濾法以得沉澱之不可溶物質, 再予乾燥, 即得淡黃色粉狀之 6-氨基-N-(2,2,2-三氟乙基) 菸鹼醯胺 (0.58 克)。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm: 4.15 (2H, dq,  $J=6.5\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 6.35 (1H, br), 7.46 (1H, dd,  $J=0.7\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.11 (1H, dd,  $J=2.5\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.77 (1H, dd,  $J=0.7\text{ Hz}$ ,  $J=2.5\text{ Hz}$ )。

#### 參考實例 14

##### N-(2,2,2-三氟乙基)-4-氨基吡啶-2-甲醯胺之合成

將 1-羥基苯並三唑 (0.53 克, 3.5 毫莫耳), 1-(3-二甲氨基丙基)-3-乙基碳化二亞胺氫氨酸鹽 (WSC) (0.67 克, 3.5 毫莫耳) 及 2,2,2-三氟乙胺 (0.51 毫升, 6.35 毫莫耳) 加 4-氨基吡啶-2-羧酸 (0.5 克, 3.17 毫莫耳) 之二氯甲烷溶液 (5 毫升) 中, 再將混合物於室溫下攪拌一小時。將水加至反應溶液中, 其後以乙酸乙酯萃取。將以乙酸乙酯萃取之溶液於硫酸鎂上乾燥, 及於減壓下濃縮。再將餘留物藉矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯

(211)

=11 : 1 → 5 : 1) 予以純化。將純化產物於減壓下濃縮至乾，即得白色粉狀之 N-(2,2,2-三氟乙基)-4-氯基吡啶-2-甲醯胺 (435 毫克)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm : 4.13 (2H, dq,  $J=6.8\text{Hz}$ ,  $J=9.0\text{Hz}$ ) , 7.49 (1H, dd,  $J=2.1\text{Hz}$ ,  $J=5.3\text{Hz}$ ) , 8.22 (1H, dd,  $J=0.4\text{Hz}$ ,  $J=2.1\text{Hz}$ ) , 8.30 (1H, br) , 8.49 (1H, dd,  $J=0.4\text{Hz}$ ,  $J=5.3\text{Hz}$ ) 。

#### 參考實例 15

##### 2-氯基噻唑-4-甲醯胺之合成

將 1-羥基苯並三唑 (0.56 克, 3.7 毫莫耳), 1-(3-二甲胺基丙基)-3-乙基碳化二亞胺氫氯酸鹽 (WSC) (0.7 克, 3.7 毫莫耳) 及氨水 (28 %, 0.5 毫升) 加至 2-氯基噻唑-4-羧酸 (0.5 克, 3.06 毫莫耳) 之二氯甲烷溶液 (10 毫升) 溶液中, 再將混合物於室溫下攪拌 46 小時。將水加至反應溶液中, 其後以乙酸乙酯萃取。將以乙酸乙酯萃取之溶液於硫酸鎂上乾燥, 及於減壓下濃縮。再將餘留物藉矽膠管柱層析 (正己烷 : 乙酸乙酯 = 3 : 5 → 乙酸乙酯) 予以純化。將純化產物於減壓下濃縮至乾, 即得白色粉狀之 2-氯基噻唑-4-甲醯胺 (475 毫克)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm : 5.70 (1H, br) , 7.01 (1H, br) , 8.06 (1H, s) 。

#### 參考實例 16

(212)

## N-甲基-2-氨基噻唑-5-甲醯胺之合成

標題化合物係依與參考實例 13 相同之方法，使用 2-氨基噻唑-5-羧酸而得。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 3.00 ( 3H , d ,  $J=4.9\text{Hz}$  ) , 5.92 ( 1H , br ) , 7.84 ( 1H , br ) 。

## 參考實例 17

## 6-甲氧基-2,2-二甲基-4H-苯並[1,4]噁吡-3-酮之合成

將 5 % 鈹碳 ( 1.5 克 ) 加至 2- ( 4-甲氧基-2-硝基苯氧基 ) -2-甲基丙酸乙酯 ( 14.6 克 , 51.6 毫莫耳 ) 之乙醇溶液 ( 250 毫升 ) 中以於室溫下進行催化性還原作用。將催化劑藉過濾法移除，再將濾液於減壓下濃縮。將水加至所得餘留物中，而後以乙酸乙酯萃取。將萃取之溶液於硫酸鎂上乾燥，及於減壓下濃縮。再將餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 9 : 1 ) 予以純化。將純化產物於減壓下濃縮至乾，即得白色粉狀之 6-甲氧基-2,2-二甲基-4H-苯並[1,4]噁吡-3-酮 ( 7.0 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 1.53 ( 6H , s ) , 3.78 ( 3H , s ) , 6.40 ( 1H , d ,  $J=2.8\text{Hz}$  ) , 6.52 ( 1H , dd ,  $J=2.8\text{Hz}$  ,  $J=8.8\text{Hz}$  ) , 6.88 ( 1H , d ,  $J=8.7\text{Hz}$  ) , 8.66 ( 1H , brs ) 。

## 參考實例 18

## 6-羥基-2,2-二甲基-4H-苯並[1,4]噁吡-3-酮之合成

(213)

將 2M 三溴化硼之二氯甲烷溶液 ( 36 毫升 ) 於冰冷卻下逐滴加至 6-甲氧基-2,2-二甲基-4H-苯並[1,4]噁吡-3-酮 ( 5.0 克 , 26 毫莫耳 ) 之二氯甲烷溶液中 , 再將混合物攪拌過夜。而後將水加至反應溶液中以使過量存在之試劑分解。再將反應溶液以水清洗 , 於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。將所得餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 =2 : 1 ) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮至乾 , 即得白色粉狀之 6-羥基-2,2-二甲基-4H-苯並[1,4]噁吡-3-酮 ( 4.02 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{DMSO-d}_6$  )  $\delta$  ppm : 1.34 ( 6H , s ) , 6.25-6.40 ( 2H , m ) , 6.70 ( 1H , d ,  $J=8.5\text{Hz}$  ) , 9.09 ( 1H , s ) , 10.41 ( 1H , brs ) 。

#### 參考實例 19

##### 6-羥基-2-甲基-4H-苯並[1,4]噁吡-3-酮之合成

標題化合物係依與參考實例 18 相同之方法 , 使用 6-甲氧基-2-甲基-4H-苯並[1,4]噁吡-3-酮而得。

白色粉末

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{DMSO-d}_6$  )  $\delta$  ppm : 1.34 ( 3H , d ,  $J=6.8\text{Hz}$  ) , 4.46 ( 1H , q ,  $J=6.8\text{Hz}$  ) , 6.23-6.27 ( 1H , m ) , 6.33 ( 1H , d ,  $J=2.7\text{Hz}$  ) , 6.70 ( 1H , d ,  $J=8.6\text{Hz}$  ) , 9.11 ( 1H , s ) , 10.44 ( 1H , brs ) 。

#### 參考實例 20



(214)

4- ( 4-甲氧基苯基 ) -1- ( 甲苯-4-磺醯基 ) 六氫吡啶之合成

將對位-甲苯磺醯氯 ( 4.39 克 , 23 毫莫耳 ) 加至 4- ( 4-甲氧基苯基 ) 六氫吡啶 ( 4.0 克 , 21 毫莫耳 ) 之吡啶溶液 ( 30 毫升 ) 中 , 再將混合物於室溫下攪拌過夜。將水加至混合溶液中 , 而後以乙酸乙酯萃取。繼而將有機相以氫氯酸及水清洗 , 於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 1 : 1 ) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮至乾 , 即得白色粉狀之 4- ( 4-甲氧基苯基 ) -1- ( 甲苯-4-磺醯基 ) 六氫吡啶 ( 4.8 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 1.60-1.90 ( 4H , m ) , 2.30-2.40 ( 3H , m ) , 2.46 ( 3H , s ) , 3.78 ( 3H , s ) , 3.90-3.95 ( 2H , m ) , 6.84 ( 2H , dd ,  $J=1.9$  ,  $J=6.8\text{Hz}$  ) , 7.07 ( 2H , dd ,  $J=1.9$  ,  $J=6.8\text{Hz}$  ) , 7.35 ( 2H , d ,  $J=8.2\text{Hz}$  ) , 7.68 ( 2H , d ,  $J=8.2\text{Hz}$  ) 。

#### 參考實例 21

4- ( 4-羥苯基 ) -1- ( 甲苯-4-磺醯基 ) 六氫吡啶之合成

標題化合物係依與參考實例 18 相同之方法 , 使用 4- ( 4-甲氧基苯基 ) -1- ( 甲苯-4-磺醯基 ) 六氫吡啶而得。

棕色粉末

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 1.60-1.90 ( 4H , m ) , 2.30-2.50 ( 3H , m ) , 2.45 ( 3H , s ) , 3.90-3.95 ( 2H , m ) ,

(215)

6.67 ( 1H , brs ) , 6.80 ( 2H , dd ,  $J=1.9$  ,  $J=6.8\text{Hz}$  ) ,  
 7.02 ( 2H , dd ,  $J=1.8$  ,  $J=6.9\text{Hz}$  ) , 7.35 ( 2H , d ,  $J=$   
 $8.1\text{Hz}$  ) , 7.68 ( 2H , d ,  $J=8.1\text{Hz}$  ) 。

#### 參考實例 22

##### 4-溴基-2-羥甲基-6-甲氧基酚之合成

將氫硼化鈉 ( 0.28 克 , 6.9 毫莫耳 ) 加至於冰冷卻下之 5-溴基-2-羥基-3-甲氧基苯甲醛 ( 3.2 克 , 13.8 毫莫耳 ) 之四氫呋喃溶液 ( 30 毫升 ) 中 , 再將混合物於 0℃ 下攪拌 2 小時。將乙酸加至反應溶液中以將 pH 設為 3。繼而將 10 % 氫氯酸加至反應混合物中 , 而後以乙酸乙酯萃取。將萃取物質於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 5 : 1 → 1 : 1 ) 予以純化 , 而後於減壓下濃縮至乾 , 即得淡黃色油狀之 4-溴基-2-羥甲基-6-甲氧基酚 ( 3.23 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 3.88 ( 3H , s ) , 4.71 ( 2H , s ) , 6.94 ( 1H , d ,  $J=2.0\text{Hz}$  ) , 7.03 ( 1H , d ,  $J=2.0\text{Hz}$  ) 。

#### 參考實例 23

##### 5-溴基-3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基苯甲醛之合成

將乙基二異丙胺 ( 3.01 毫升 , 17.1 毫莫耳 ) 及甲氧基甲基氯 ( 1.5 毫升 , 15.7 毫莫耳 ) 加至於冰冷卻下之 5-溴基-2-羥基-3-甲氧基苯甲醛 ( 3.3 克 , 14.3 毫莫耳 ) 之二氯

(216)

甲烷溶液（30 毫升）中，再將混合物於室溫下攪拌 2 小時。而後將反應溶液以水清洗，於硫酸鎂上乾燥，及於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=3：1→11：9）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮至乾，即得淡黃色固狀之 5-溴基-3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基苯甲醛（4.2 克）。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 3.56 ( 3H , s ) , 3.89 ( 3H , s ) , 5.21 ( 2H , s ) , 7.23 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{Hz}$  ) , 7.56 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{Hz}$  ) , 10.39. ( 1H , s ) 。

#### 參考實例 24

3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基-5-(2-酮基-噁唑啉-3-基)苯甲醛之合成

將 2-噁唑啉酮（0.39 克，4.36 毫莫耳），參（二苄叉丙酮）二鈹（0.17 克，0.18 毫莫耳），9,9-二甲基-4,5-雙（二苯膦基）咕噸（XANTPHOS）（0.32 克，0.55 毫莫耳）及碳酸鈹（1.66 克，5.1 毫莫耳）加至 5-溴基-3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基苯甲醛（1.0 克，3.6 毫莫耳）之二噁烷溶液（20 毫升）中，再將混合物於  $100^\circ\text{C}$  下、於氬氣層下攪拌 24 小時。而後將反應溶液冷卻至室溫，再將乙酸乙酯加入。繼而將混合物藉賽力特矽藻土過濾。將濾液以水清洗，於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=4：1→1：1）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮。藉過濾法以得所

(217)

純化之不可溶物質，再予乾燥，即得白色粉狀之 3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基-5-(2-酮基-噁唑啉-3-基)苯甲醛 (0.5 克)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 3.57 (3H, s), 3.93 (3H, s), 4.06-4.12 (2H, m), 4.48-4.54 (2H, m), 5.21 (2H, s), 6.96 (1H, d,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 8.18 (1H, d,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 10.45 (1H, s)。

#### 參考實例 25

3-(3-甲氧基-4-甲氧基甲氧基-5-甲苯基)噁唑啉-2-酮之合成

令 3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基-5-(2-酮基-噁唑啉-3-基)苯甲醛 (0.5 克, 1.79 毫莫耳) 溶於乙酸 (5 毫升) 及乙醇 (5 毫升) 之溶劑混合液中，再將 10 % 鈀碳 (0.05 克) 加入以於 1 atm 下、於 50°C 下進行催化性還原作用 4 小時。將反應混合物冷卻至室溫，再藉賽力特矽藻土予以過濾。將濾液於減壓下濃縮。令餘留物溶於乙酸 (10 毫升) 中，再將 10 % 鈀碳 (0.05 克) 加入以於 1 atm 下、於 50°C 下進行催化性還原作用 6 小時。而後將溶劑於減壓下移除，即得作為粗製產物之 3-(3-甲氧基-4-甲氧基甲氧基-5-甲苯基)噁唑啉-2-酮，其乃就此進行下一反應。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 2.32 (3H, s), 3.56 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.98-4.06 (2H, m), 4.43-4.50 (2H, m), 5.05 (2H, s), 6.61 (1H, d,  $J=2.3\text{Hz}$ ),

(218)

7.36 (1H, d, J=2.3 Hz)。

#### 參考實例 26

##### 3-(4-羥基-3-甲氧基-5-甲苯基)噁唑啉-2-酮之合成

將 10 %氫氯酸 (5 毫升) 加至 3-(3-甲氧基-4-甲氧基甲氧基-5-甲苯基)噁唑啉-2-酮 (0.48 克, 1.79 毫莫耳) 之甲醇溶液 (5 毫升) 中, 再將混合物於 50℃ 下攪拌 10 分鐘。而後將水加至反應溶液中, 繼而以乙酸乙酯萃取。將萃取之物質於硫酸鎂上乾燥, 其後於減壓下濃縮至乾, 即得淡黃色粉狀之 3-(4-羥基-3-甲氧基-5-甲苯基)噁唑啉-2-酮 (434 毫克)。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm: 2.26 (3H, s), 3.90 (3H, s), 4.02 (2H, dd, J=7.0 Hz, J=8.5 Hz), 4.46 (2H, dd, J=7.0 Hz, J=8.5 Hz), 5.55 (1H, br), 6.56 (1H, d, J=2.5 Hz), 7.31 (1H, d, J=2.5 Hz)。

#### 參考實例 27

##### 1-(8-甲氧基-2,2-二甲基-4H-苯並[1,3]二噁英-6-基)吡咯啉-2-酮之合成

標題化合物係依與參考實例 25 相同之方法, 使用 6-溴基-8-甲氧基-2,2-二甲基-4H-苯並[1,3]二噁英及 2-吡咯啉而得。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm: 1.59 (6H, s), 2.09-2.21 (2H, m), 2.60 (2H, t, J=8.3 Hz), 3.82 (2H, t,

(219)

$J=7.0\text{ Hz}$  ) , 3.88 ( 3H , s ) , 4.83 ( 2H , s ) , 6.67 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) , 7.24 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) 。

#### 參考實例 28

1- ( 4-羥基-3-羥甲基-5-甲氧基苯基 ) 吡咯啉-2-酮之合成

將 10 % 氫氨酸 ( 4 毫升 ) 加至 1- ( 8-甲氧基-2,2-二甲基-4H-苯並 [1,3] 二噁英-6-基 ) 吡咯啉-2-酮 ( 0.36 克 , 1.3 毫莫耳 ) 之四氫呋喃溶液 ( 7 毫升 ) 中 , 再將混合物於室溫下攪拌 17 小時。而後將水加至反應溶液中 , 繼而以二氯甲烷萃取。將萃取之物質於硫酸鎂上乾燥 , 於減壓下濃縮 , 再藉矽膠管柱層析 ( 二氯甲烷 : 甲醇 = 300 : 1 → 30 : 1 ) 予以純化 , 即得淡棕色粉狀之 1- ( 4-羥基-3-羥甲基-5-甲氧基苯基 ) 吡咯啉-2-酮 ( 0.31 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 2.05-2.28 ( 3H , m ) , 2.26 ( 2H , t ,  $J=7.5\text{ Hz}$  ) , 3.84 ( 2H , t ,  $J=7.0\text{ Hz}$  ) , 3.91 ( 3H , s ) , 4.74 ( 2H , s ) , 5.90 ( 1H , br ) , 6.78 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) , 7.52 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) 。

#### 參考實例 29

3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基-5- ( 2-酮基吡咯啉-1-基 ) 苯甲醛之合成

標題化合物係依與參考實例 25 相同之方法 , 使用 5-溴基-3-甲氧基-2-甲氧基甲氧基苯甲醛及 2-吡咯啉而得。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 2.11-2.24 ( 2H , m ) , 2.63

(220)

( 2H , t ,  $J=8.3\text{ Hz}$  ) , 3.56 ( 3H , s ) , 3.89 ( 2H , t ,  $J=7.0\text{ Hz}$  ) , 3.92 ( 3H , s ) , 5.21 ( 2H , s ) , 7.08 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) , 8.28 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) , 10.46 ( 1H , s ) 。

### 參考實例 30

#### 1- ( 4-羥基 -3-甲氧基 -5-甲苯基 ) 吡咯啉 -2-酮之合成

令 3-甲氧基 -2-甲氧基甲氧基 -5- ( 2-酮基吡咯啉 -1-基 ) 苯甲醛 ( 0.72 克 , 2.56 毫莫耳 ) 溶於乙酸 ( 5 毫升 ) 與乙醇 ( 7 毫升 ) 之溶劑混合液中 , 其後將 10 % 鈀碳 ( 70 毫克 ) 加入以於  $50^{\circ}\text{C}$  下進行催化性還原作用 10 小時。將反應溶液冷卻至室溫 , 而後藉賽力特矽藻土過濾。將濾塊於減壓下濃縮。令所得餘留物溶於二氯甲烷 ( 15 毫升 ) 中 , 再於冰冷卻下將三氟乙酸 ( 2.0 毫升 , 25.6 毫莫耳 ) 及三乙矽烷 ( 2.0 毫升 , 12.8 毫莫耳 ) 加入。將混合物於室溫下攪拌 16 小時。而後將混合物於減壓下濃縮 , 再將餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 5 : 1  $\rightarrow$  乙酸乙酯 ) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮 , 即得淡黃色油狀之 1- ( 4-羥基 -3-甲氧基 -5-甲苯基 ) 吡咯啉 -2-酮 ( 0.41 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 2.17-2.25 ( 5H , m ) , 2.72 ( 2H , t ,  $J=8.3\text{ Hz}$  ) , 3.88 ( 2H , t ,  $J=7.0\text{ Hz}$  ) , 3.89 ( 3H , s ) , 6.66 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) , 7.15 ( 1H , d ,  $J=2.5\text{ Hz}$  ) 。

(221)

## 參考實例 31

## 3,4-二乙醯氧基-5-甲基苯甲醛之合成

將乙酸酐（1.2 毫升，12 毫莫耳）加至 3,4-二羥基-5-甲基苯甲醛（0.72 克，4.7 毫莫耳）之吡啶溶液（4 毫升）中，再將混合物於 0℃ 下攪拌一小時。將 10 % 氫氯酸加至反應溶液中，而後以乙酸乙酯萃取。繼而將有機相以水性碳酸氫鈉溶液清洗，於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯 = 5 : 1 → 3 : 1）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，即得淡黃色油狀之 3,4-二乙醯氧基-5-甲基苯甲醛（0.98 克）。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm : 2.29 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.35 (3H, s), 7.58 (1H, d, J=1.6Hz), 7.67 (1H, d, J=1.6Hz), 9.93 (1H, s)。

## 參考實例 32

## 7-羥基-1,4-二氫苯並[d][1,3]噁吡-2-酮之合成

標題化合物係依與參考實例 26 相同之方法，使用 7-甲氧基甲氧-1,4-二氫苯並[d][1,3]噁吡-2-酮而得。

白色粉末

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  ppm : 5.14 (2H, s), 6.35 (1H, d, J=2.2Hz), 6.39 (1H, dd, J= 8.1, J=2.2Hz), 6.97 (1H, d, J=8.1Hz), 9.98 (1H, br-s)。



(222)

## 參考實例 33

## 7-甲氧基-3,4-二氫-1H-喹啉-2-酮之合成

將 2-胺甲基-5-甲氧基苯胺（1.2 克，7.9 毫莫耳）及羰基二咪唑（1.53 克，9.5 毫莫耳）加至四氫呋喃（100 毫升）中，再將混合物於室溫下攪拌過夜。而後藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，以二氯甲烷及水清洗，再予乾燥，即得白色粉狀之 7-甲氧基-3,4-二氫-1H-喹啉-2-酮（1.11 克）。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm : 3.68 (3H, s), 4.23 (2H, s), 6.35 (1H, d,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 6.42 (1H, dd,  $J=8.3\text{Hz}$ ,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 6.96 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 8.90 (1H, brs)。

## 參考實例 34

## 7-羥基-3,4-二氫-1H-喹啉-2-酮之合成

標題化合物係依與參考實例 18 相同之方法，使用 7-甲氧基-3,4-二氫-1H-喹啉-2-酮而得。

淡棕色粉末

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm : 4.18 (2H, brs), 6.75-6.85 (1H, m), 7.01 (1H, dd,  $J=2.0\text{Hz}$ ,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.07 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.87 (1H, brs), 9.48 (1H, brs), 13.21 (1H, brs)。

(223)

## 參考實例 35

## 5- ( 3-氯基丙氧基 ) -1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯之合成

將碳酸鉀 ( 2.08 克 , 6.4 毫莫耳 ) 及 1-溴基-3-氯基丙烷 ( 1.6 毫升 ) 加至 5-羥基-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯 ( 0.83 克 , 5.3 毫莫耳 ) 之二甲基甲醯胺溶液 ( 5 毫升 ) 中 , 再將混合物於室溫下攪拌 21 小時。將水加至反應溶液中 , 而後以乙酸乙酯萃取。將有機相以水清洗及於硫酸鎂上乾燥。繼而將反應溶液於減壓下濃縮。再將餘留物藉矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 100 : 1 → 4 : 1 ) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮至乾 , 即得白色固狀之 5- ( 3-氯基丙氧基 ) -1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯 ( 1.17 克 ) 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 2.21-2.32 ( 2H , m ) , 3.72 ( 2H , t ,  $J=6.3\text{Hz}$  ) , 3.72 ( 2H , s ) , 3.91 ( 3H , s ) , 4.24 ( 2H , t ,  $J=5.8\text{Hz}$  ) , 6.10 ( 1H , s ) 。

## 參考實例 36

## 7- ( 3-氯基丙氧基 ) -2H-1,4-苯並噁吡-3 ( 4H ) -酮之合成

標題化合物係依與參考實例 35 相同之方法 , 使用 7-羥基-2H-1,4-苯並噁吡-3 ( 4H ) -酮及 1-溴基-3-氯基丙烷而得。

淡棕色針狀結晶 ( 乙醇-正己烷 )

熔點 : 119-120°C

(224)

下表 1 至 12 中所列之化合物係依與參考實例 1 至 36 相同之方法，使用適當之原材料物質而製得。

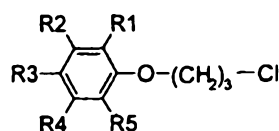
[表1]

Chemical structure showing a benzene ring with substituents R1, R2, R3, R4, and R5. A side chain  $-O-(CH_2)_3-Br$  is attached to the ring.

參考實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
37	-H	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm : 1.25(3H, t, J=7.5Hz), 2.29-2.39 (2H, m), 3.43-3.54(2H, m), 3.61 (2H, t, J = 6.3Hz), 4.15 (2H, t, J = 5.8Hz), 5.99(1H, br), 6.89-6.95 (2H, m), 7.70-7.75 (2H, m)
38	-H	-H	-CONHC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 0.99(3H, t, J=7.5Hz), 1.57-1.68(2H, m), 2.23-2.36 (2H, m), 3.37-3.45(2H, m), 3.61 (2H, t, J = 6.3Hz), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.12-4.18 (2H, m), 6.02(1H, br), 6.71-6.95 (2H, m), 7.71-7.75 (2H, m)

(225)

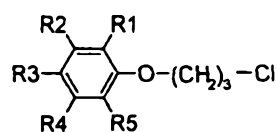
[表2]



参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
39	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-F	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.45 (2H, m), 3.70-3.80 (2H, m), 4.30-4.35 (2H, m), 7.07 (1H, dd, J=8.2, 8.9 Hz), 8.00 (1H, dd, J=2.7, 10.7 Hz), 8.07 (1H, dd, J=0.9, 9.0 Hz).
40	-H	-H	-NH <sub>2</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.14-2.24 (2H, m), 3.26 (2H, br), 3.73 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.04 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.61-6.67 (2H, m), 6.72-6.78 (2H, m)
41	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.74 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.76 (3H, s), 4.09 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.42 (1H, br), 6.85 (2H, dd, J=2.5, 6.8 Hz), 7.21-7.33 (2H, m)
42	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.07-1.14 (6H, m), 2.17-2.30 (2H, m), 3.26-3.42 (4H, m), 3.63 (2H, s), 3.74 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.09 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.83-6.88 (2H, m), 7.14-7.19 (2H, m)
43	-H	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.28-2.37 (2H, m), 3.74 (2H, t, J=6.5 Hz), 3.77 (3H, s), 4.11 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.50-6.67 (2H, m), 6.83 (1H, dd, J=1.5 Hz, 7.8 Hz), 7.16-7.22 (2H, m)
44	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.37 (3H, t, J=7.4 Hz), 2.15-2.30 (2H, m), 3.07 (2H, q, J=7.4 Hz), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.41 (1H, brs), 6.88 (2H, dt, J=8.9, 3.4 Hz), 7.19 (2H, dt, J=8.9, 3.4 Hz)
45	-H	-H	-NH <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 3.20-3.70 (2H, br), 3.75-3.95 (2H, m), 3.83 (3H, s), 4.07 (2H, t, J=3 Hz), 6.24 (1H, dd, J=2.6, 8.4 Hz), 6.33 (1H, d, J=2.7 Hz), 6.77 (1H, d, J=8.4 Hz)
46	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.77 (3H, s), 3.86 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.55 (1H, brs), 6.73 (1H, dd, J=2.4, 8.6 Hz), 6.84 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.20 (1H, brs)
47	-H	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.23 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.20-2.30 (2H, m), 3.40-3.50 (2H, m), 3.74 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.13 (1H, brs), 6.85-6.95 (2H, m), 7.70-7.75 (2H, m)
48	-H	-H	-NHCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.02 (6H, s), 3.74 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.08 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.20 (1H, brs), 6.84 (2H, dd, J=2.0, 6.8 Hz), 7.26 (2H, dd, J=2.1, 6.8 Hz)
49	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-Cl	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.39 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.27-2.37 (2H, m), 3.81 (2H, t, J=6.8 Hz), 4.25 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.36 (2H, q, J=7.0 Hz), 6.96 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.93 (1H, dd, J=2.0 Hz, 8.5 Hz), 8.06 (1H, d, J=2.0 Hz)

(226)

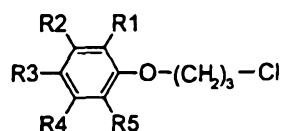
[表3]



参考实例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
50	-H	-H	$-CH_2CO_2C_2H_5$	-H	-Cl	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.26(3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.23-2.33 (2H, m), 3.52(2H, s), 3.80(2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.15(2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.90(1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.13(1H, dd, $J=2.0$ Hz, 8.3Hz), 7.30(1H, d, $J=2.0$ Hz)
51	-H	-H	$-CH_2CONHCH_3$	-H	-H	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 2.19-2.29(2H, m), 2.76(3H, d, $J=4.8$ Hz), 3.52(2H, s), 3.76(2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.12(2H, t, $J=5.8$ Hz), 5.35(1H, br), 6.86-6.92(2H, m), 7.13-7.18(2H, m)
52	-H	-H	$-CH_2CH_2NHCH_3$	-H	-H	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 2.18-2.27 (2H, m), 2.43(2H, s), 2.72-2.83(4H, m), 3.71(3H, s), 3.75(4H, t, $J=6.3$ Hz), 4.09(2H, t, $J=5.8$ Hz), 6.83-6.86(2H, m), 7.10-7.14(2H, m)
53	-H	-H	$-(CH_2)_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$	-H	-H	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.42(9H, s), 2.17-2.27 (2H, m), 2.67-2.86(5H, m), 3.35-3.41 (2H, m), 3.74(2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.09 (2H, t, $J=5.8$ Hz), 6.83(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.00-7.16(2H, m)
54	-H	-H	$-NH_2$	-H	-F	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.54 (2H, brs), 3.76 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 4.05-4.15 (2H, m), 6.35-6.40 (1H, m), 6.46 (1H, dd, $J=0.9$ , 12.6 Hz), 6.82 (1H, dd, $J=8.5$ , 8.5Hz)
55	-H	-H	$-NHCO_2CH_3$	-H	-F	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.77 (2H, t, $J=6.5$ Hz), 3.77 (3H, s), 4.10-4.20 (2H, m), 6.57 (1H, brs), 6.85-7.00 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m)
56	-H	-H	$-CH_2CO_2C_2H_5$	-H	-F	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.26(3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.21-2.30 (2H, m), 3.5382H, s), 3.77(2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.11-4.20(4H, m), 6.89-7.06(3H, m)
57	-H	-H	$-CO_2C_2H_5$	-H	-Br	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.39(3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.27-2.37 (2H, m), 3.82(2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.24(2H, t, $J=5.8$ Hz), 4.35(2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.92(1H, d, $J=8.5$ Hz), 7.98(1H, dd, $J=2.0$ Hz, 8.5Hz), 8.23(1H, d, $J=2.0$ Hz)
58	-H	-H	$-CHO$	$-OCH_3$	-H	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 2.23-2.34 (2H, m), 3.76(2H, t, $J=6.3$ Hz), 3.91(3H, s), 4.20(2H, t, $J=5.8$ Hz), 6.46(1H, d, $J=2.0$ Hz), 6.56(1H, dd, $J=2.0$ Hz, 8.3Hz), 7.81(1H, d, $J=8.3$ Hz), 10.29(1H, s)
59	-H	-H	$-CO_2C_2H_5$	-H	$-NO_2$	$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.41(3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.26-2.40(2H, m), 3.81(2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.32-4.44(4H, m), 7.15(1H, d, $J=8.8$ Hz), 8.22(1H, dd, $J=2.0$ Hz, 8.8Hz), 8.52(1H, d, $J=2.0$ Hz)

(227)

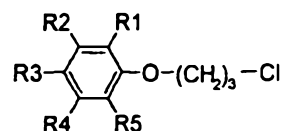
[表4]



参考实例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
60	-H	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-NO <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.26 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.25-2.35 (2H, m), 3.45-3.55 (2H, m), 3.80 (2H, t, J=6.1 Hz), 4.30-4.35 (2H, m), 6.34 (1H, brs), 7.15 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.04 (1H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 8.25 (1H, d, J=2.3 Hz).
61	-H	-H	-CONH <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.21-2.35 (2H, m), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.95 (3H, s), 4.18 (2H, t, J=5.8 Hz), 5.67 (1H, br), 6.51 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.61 (1H, dd, J=2.5 Hz, 8.8 Hz), 7.59 (1H, br), 8.18 (1H, d, J=8.8 Hz).
62	-H	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.99 (3H, d, J=5.0 Hz), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.94 (3H, s), 4.17 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.49 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.60 (1H, dd, J=2.5 Hz, 8.8 Hz), 7.70 (1H, br), 8.19 (1H, d, J=8.8 Hz).
63	-H	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.23 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.20-2.30 (2H, m), 3.43-3.54 (2H, m), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.94 (3H, s), 4.17 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.49 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.60 (1H, dd, J=2.5 Hz, 8.8 Hz), 7.70 (1H, br), 8.18 (1H, d, J=8.8 Hz).
64	-H	-H	-CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.21-2.31 (2H, m), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.98 (3H, s), 4.07-4.21 (4H, m), 6.51 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.62 (1H, dd, J=2.5 Hz, 8.8 Hz), 8.09 (1H, br), 8.18 (1H, d, J=8.8 Hz).
65	-H	-H	-CH=CHCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.33 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.20-2.30 (2H, m), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.25 (2H, q, J=7.0 Hz), 6.31 (1H, d, J=16.0 Hz), 6.88-6.93 (2H, m), 7.44-7.50 (2H, m), 7.64 (1H, d, J=16.0 Hz).
66	-F	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.40 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.25-2.34 (2H, m), 3.78 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.25 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.37 (2H, q, J=7.0 Hz), 7.08-7.15 (1H, m), 7.62-7.70 (2H, m).
67	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-CH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.21-2.31 (2H, m), 2.64 (3H, s), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.18 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.77-6.81 (2H, m), 8.06 (1H, d, J=9.5 Hz), 11.00 (1H, br).
68	-Cl	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.40 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.25-2.37 (2H, m), 3.82 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.25 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.38 (2H, q, J=7.0 Hz), 7.42 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.58-7.62 (2H, m).
69	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.39 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.24-2.34 (2H, m), 2.26 (3H, s), 3.78 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.37 (2H, q, J=7.0 Hz), 7.19 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.49 (1H, d, J=1.5 Hz), 7.57 (1H, dd, J=1.5 Hz, 7.8 Hz).

(228)

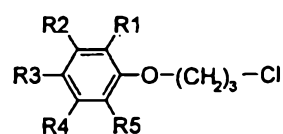
[表5]



參考實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
70	-H	-H	-CONH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.19-2.29 (2H, m), 2.51(3H, s), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.14(2H, t, J=6.3Hz), 6.53(2H, br), 6.71(2H, m), 7.45(1H, d, J=8.3Hz)
71	-H	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.18-2.28 (2H, m), 2.45(3H, s), 2.98(3H, d, J=4.9Hz), 3.74(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 5.72(1H, br), 6.68-6.75(2H, m), 7.32(1H, d, J=8.3Hz)
72	-H	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.24(3H, t, J=7.3Hz), 2.19-2.28 (2H, m), 2.45(3H, s), 3.41-3.52(2H, m), 3.74(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=6.0Hz), 5.68(1H, br), 6.68-6.75(2H, m), 7.32(1H, d, J=8.3Hz)
73	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.38(3H, t, J=7.0Hz), 2.21-2.28 (2H, m), 2.31(6H, s), 3.84(2H, t, J=6.3Hz), 3.93(2H, t, J=5.8Hz), 4.35(2H, t, J=7.0Hz), 7.72(2H, s)
74	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.39(3H, t, J=7.1Hz), 2.26-2.36 (2H, m), 3.78(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 4.36(2H, q, J=7.1Hz), 6.89(1H, d, J=8.3Hz), 7.58(1H, d, J=2.0Hz), 7.70(1H, d, J=8.3Hz)
75	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 2.13-2.23 (2H, m), 3.85(2H, t, J=6.3Hz), 3.90(6H, s), 4.17(2H, t, J=5.8Hz), 4.38(2H, q, J=7.0Hz), 7.30(2H, s)
76	-CH <sub>3</sub>	-H	-CHO	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.17-2.29 (2H, m), 2.34(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 7.31(1H, s), 9.86(1H, s)
77	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.18-2.28 (2H, m), 2.32(6H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.90(3H, s), 4.16(2H, t, J=5.8Hz), 7.50(1H, d, J=2.0Hz), 7.60(1H, d, J=2.0Hz)
78	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONH <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.17-2.27 (2H, m), 2.30(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.89(3H, s), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 5.24-6.26(2H, br), 7.15(1H, d, J=2.0Hz), 7.32(1H, d, J=2.0Hz)
79	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.17-2.26 (2H, m), 2.29(3H, s), 3.00(3H, d, J=5.0Hz), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.88(3H, s), 4.10(2H, t, J=5.8Hz), 6.06(1H, br), 7.08(1H, d, J=1.9Hz), 7.28(1H, d, J=1.9Hz)

(229)

[表6]



參考實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
80	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.25(3H, t, J=7.3Hz), 2.17-2.26 (2H, m), 2.30(3H, s), 3.43-3.54(2H, m), 3.83( 2H, t, J=6.3Hz), 3.89(3H, s), 4.10( 2H, t, J=5.8Hz), 6.02(1H, br), 7.07(1H, d, J=2.0Hz), 7.28 ( 1H, d, J=2.0Hz )
81	-CH <sub>3</sub>	-H	-NHCO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.51(9H,s), 2.14-2.26 (2H, m), 2.23(3H, s), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 3.83(3H, s), 3.99( 2H, t, J=5.8Hz), 6.34(1H, br), 6.59(1H, d, J=2.5Hz), 7.01(1H, d, J=2.5Hz)
82	-CH <sub>3</sub>	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.17-2.29 (2H, m), 2.30(3H, s), 3.83( 2H, t, J=6.3Hz), 3.89(6H, s), 4.13( 2H, t, J=5.8Hz), 7.44(1H, d, J=2.0Hz), 7.51 ( 1H, d, J=2.0Hz )
83	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 2.29 (3H, s), 3.75-3.90 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=5.9 Hz), 7.43 (1H, d, J=1.8 Hz), 7.50 (1H, d, J=1.4Hz).
84	-CH <sub>3</sub>	-H	-NH <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.14-2.22 (2H, m), 2.19(3H, s), 3.47(2H, br), 3.82(2H, t, J=5.3Hz), 3.95(2H, t, J=4.8Hz), 6.09-6.13(2H, m)
85	-CH <sub>3</sub>	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.11-2.28 (2H, m), 2.15(3H, s), 2.24(3H, s), 3.82( 2H, t, J=6.3Hz), 3.83(3H, s), 4.01( 2H, t, J=5.8Hz), 6.66(1H, d, J=2.1Hz), 7.02(1H, br), 7.23 ( 1H, d, J=2.1Hz )
86	-CH <sub>3</sub>	-H	-CHO	-H	-OCOCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.17-2.27(2H, m), 2.37(6H, s), 3.79(2H, t, J=5.6Hz), 4.11(2H, t, J=5.8Hz), 7.46(1H, d, J=2.0Hz), 7.62(1H, d, J=2.0Hz), 9.88(1H, s)
87	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-OCOCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.16-2.26(2H, m), 2.35(3H, s), 2.36(3H, s), 3.79(2H, t, J=6.3Hz), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 7.67(1H, d, J=2.0Hz), 7.84(1H, d, J=2.0Hz)
88	-OH	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.21-2.35(2H, m), 2.32(3H, s), 2.99(3H, d, J=4.9Hz), 3.85(2H, t, J=6.3Hz), 4.05(2H, t, J=5.8Hz), 5.90(1H, br), 6.02(1H, br), 7.15(1H, d, J=1.8Hz), 7.20(1H, d, J=2.0Hz)
89	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.46(3H, t, J=7.0Hz), 2.17-2.27 (2H, m), 2.28(3H, s), 2.99(3H, d, J=5.0Hz), 3.83( 2H, t, J=6.3Hz), 4.06-4.15( 4H, m), 6.04(1H, br), 7.07(1H, d, J=1.8Hz), 7.25 ( 1H, d, J=1.8Hz )
90	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-OCH <sub>3</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.22-2.32 (2H, m), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.05(3H, s), 4.21( 2H, t, J=5.8Hz), 6.55(1H, d, J=2.5Hz), 6.66(1H, d, J=8.8Hz), 8.14(1H, d, J=8.8Hz), 10.43(1H, br)

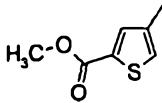
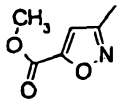
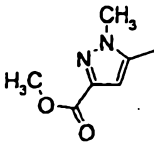
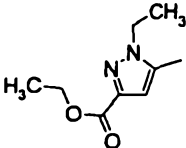
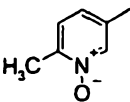
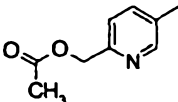
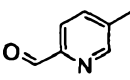
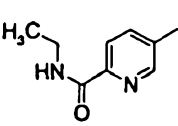
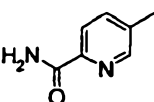
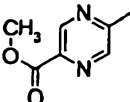




(231)

[表9]

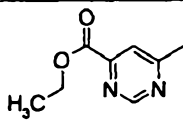
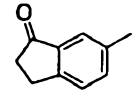
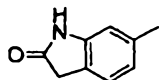
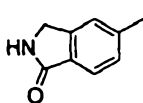
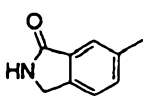
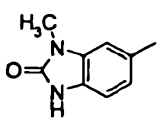
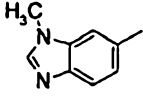
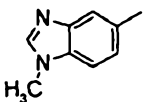
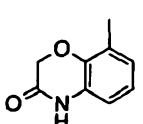
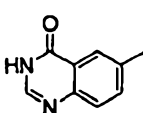
R1-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-Cl

参考實例 R1	NMR
99 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 3.72 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.87 (3H, s), 4.05-4.15 (2H, m), 6.55 (1H, d, J=1.8 Hz), 7.42 (1H, d, J=1.8 Hz).
100 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.21-2.31(2H, m), 3.70(2H, t, J=6.3Hz), 3.95(3H, s), 4.46(2H, t, J=6.0Hz), 6.54(1H, s)
101 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.21-2.32(2H, m), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 3.72(2H, s), 3.91(3H, s), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 6.10(1H, s)
102 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.39(3H, t, J=7.0Hz), 1.39(3H, t, J=7.3Hz), 2.22-2.32(2H, m), 3.71(2H, t, J=6.3Hz), 4.10(2H, q, J=7.3Hz), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 4.39(2H, q, J=7.0Hz), 6.08(1H, s)
103 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.29(2H, m), 2.46(3H, s), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 6.84(1H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.13(1H, d, J=8.8Hz), 8.07(1H, d, J=2.5Hz)
104 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.13(3H, s), 2.21-2.31(2H, m), 3.76(2H, t, J=6.3Hz), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 5.17(2H, s), 7.19-7.32(2H, m), 8.30(1H, d, J=2.5Hz)
105 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.27-2.36(2H, m), 3.77(2H, t, J=6.0Hz), 4.28(2H, t, J=5.8Hz), 7.33(1H, dd, J=2.5Hz, 8.5Hz), 7.97(1H, dd, J=2.5Hz, 8.5Hz), 8.44(1H, d, J=2.5Hz), 10.00(1H, s)
106 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.26(3H, t, J=7.3Hz), 2.24-2.34(2H, m), 3.55(2H, dq, J=6.0Hz, 7.3Hz), 3.77(2H, t, J=6.3Hz), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 7.29(1H, dd, J=2.3Hz, 8.8Hz), 7.83(1H, br), 8.18(1H, d, J=8.8Hz), 8.20(1H, d, J=2.3Hz)
107 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.25-2.34(2H, m), 3.77(2H, t, J=6.3Hz), 4.23(2H, t, J=5.8Hz), 5.48(1H, br), 7.31(1H, dd, J=2.3Hz, 8.8Hz), 7.68(1H, br), 8.16(1H, d, J=8.8Hz), 8.23(1H, d, J=2.3Hz)
108 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.24-2.34(2H, m), 3.73(2H, t, J=6.3Hz), 4.00(3H, s), 4.58(2H, t, J=6.0Hz), 8.28(1H, d, J=1.3Hz), 8.87(1H, d, J=1.3Hz)

(232)

[表10]

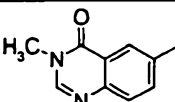
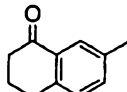
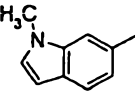
R1-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-Cl

参考實例 R1	NMR
109 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.44(3H, t, J=7.0Hz), 2.22-2.31(2H, m), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 4.48(2H, q, J=7.0Hz), 4.59(2H, t, J=6.0Hz), 7.44(1H, d, J=1.0Hz), 8.90(1H, d, J=1.0Hz)
110 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.70-2.75 (2H, m), 3.07 (2H, t, J=5.8 Hz), 3.74 (2H, t, J=6.4 Hz), 7.15-7.20 (2H, m), 7.37 (1H, d, J=8.2 Hz).
111 	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δppm : 2.1-2.2 ( 2H, m ), 3.37 ( 2H, s ), 3.78 ( 2H, t, J = 6.5Hz ), 4.04 ( 2H, t, J = 6Hz ), 6.40 ( 1H, d, J = 2.5Hz ), 6.49 ( 1H, dd, J = 2.5, 8Hz ), 7.08 ( 1H, d, J = 8Hz ), 10.33 ( 1H, bs ).
112 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.27 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.76 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.41 (2H, s), 6.96 (1H, s), 7.01 (1H, dd, J=2.2, 8.5 Hz), 7.17 (1H, brs), 7.77 (1H, d, J=8.4 Hz).
113 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.27 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.76 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.40 (2H, s), 6.50-6.60 (1H, br), 7.15 (1H, dd, J=2.3, 8.5 Hz), 7.35-7.40 (2H, m).
114 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.35 (2H, m), 3.39 (3H, s), 3.75-3.80 (2H, m), 4.05-4.15 (2H, m), 6.55-6.65 (2H, m), 6.98 (1H, d, J=7.5 Hz), 9.92 (1H, brs).
115 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.28 (2H, t, J=6.0 Hz), 3.75-3.80 (5H, m), 4.18 (2H, t, J=5.7 Hz), 6.85 (1H, d, J=2.1 Hz), 6.90-6.95 (1H, m), 7.66 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.76 (1H, s).
116 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.78 (2H, t, J=6.9 Hz), 3.82 (3H, s), 4.18 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.97 (1H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 7.25-7.30 (2H, m), 7.81 (1H, s).
117 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.20-2.35 (2H, m), 3.77 (2H, t, J=6.2 Hz), 4.19 (2H, t, J=6.0 Hz), 4.66 (2H, s), 6.47 (1H, dd, J=7.9, 1.2 Hz), 6.67 (1H, dd, J=8.3, 1.1 Hz), 6.90 (1H, dd, J=8.2, 8.1 Hz), 8.29 (1H, brs).
118 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.24 (2H, tt, J = 6.2, 6.2 Hz), 3.70(2H, t, J = 6.4 Hz), 3.77 (3H, s), 4.45 (2H, t, J = 6.1 Hz), 6.70 (1H, d, J = 8.9 Hz), 6.98 (1H, dd, J = 8.9, 3.0 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.0 Hz)

(233)



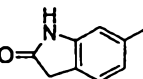
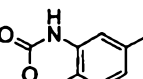
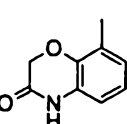
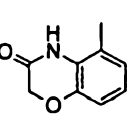
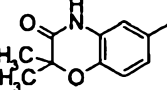
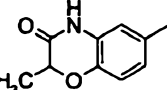
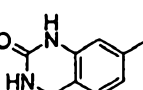
[表11]

R1-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-Cl

参考實例 R1	NMR
119 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.30 (2H, tt, J = 6.1, 6.1 Hz), 3.60(3H, s), 3.77(2H, t, J = 6.3 Hz), 4.25 (2H, t, J = 5.8 Hz), 7.34 (1H, dd, J = 8.9, 2.9 Hz), 7.65 (1H, d, J = 8.9 Hz), 7.68 (1H, d, J = 2.9 Hz), 7.96 (1H, s)
120 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.12 (2H, tt, J = 6.3, 6.3 Hz), 2.24 (2H, tt, J = 6.1, 6.1 Hz), 2.62(2H, t, J = 6.5 Hz), 2.902(2H, t, J = 6.1 Hz), 3.74(2H, t, J = 6.3 Hz), 4.15 (2H, t, J = 5.8 Hz), 7.05 (1H, dd, J = 8.4, 2.8 Hz), 7.17 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.52 (1H, d, J = 2.8 Hz)
121 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 2.25 (2H, tt, J = 6.1, 6.1 Hz), 3.76 (3H, s), 3.78(2H, t, J = 6.4 Hz), 4.15 (2H, t, J = 5.8 Hz), 6.39 (1H, t, J = 3.0 Hz), 6.88 (1H, dd, J = 8.8, 2.4 Hz), 7.02 (1H, d, J = 3.0 Hz), 7.10 (1H, d, J = 2.3 Hz), 7.21 (1H, d, J = 8.8 Hz)

[表12]

R1-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-Cl

參考實例 R1	NMR
122 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.85-2.05 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.33 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.72 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.85 (1H, dt, J=0.8, 5.1 Hz), 7.56 (1H, dt, J=2.0, 8.4 Hz), 8.14 (1H, dd, J=5.1, 1.4 Hz).
123 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.95-2.05 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.2 Hz), 4.05 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.80 (2H, dd, J=4.8, 1.6 Hz), 8.43 (2H, dd, J=4.9, 1.5 Hz).
124 	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δppm: 1.75-1.9 (4H, m), 3.36 (2H, s), 3.70 (2H, t, J = 6.5Hz), 3.96 (2H, t, J = 6Hz), 6.38 (1H, d, J = 2Hz), 6.48 (1H, dd, J = 2.5, 8Hz), 7.07 (1H, d, J = 8Hz), 10.32 (1H, bs).
125 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.91-2.00 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.2 Hz), 3.98 (2H, t, J=5.6 Hz), 5.26 (2H, s), 6.36 (1H, d, J=2.3 Hz), 6.57 (1H, dd, J=, 8.4, 2.3 Hz), 7.00 (1H, d, J=8.4 Hz), 8.08 (1H, br-s)
126 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.95-2.04 (4H, m), 3.61-3.65 (2H, m), 4.06-4.09 (2H, m), 4.66 (2H, s), 6.46 (1H, d, J=8.0 Hz), 6.63 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.89 (1H, dd, J=8.0, 8.3 Hz), 8.41 (1H, br)
127 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.80-2.00 (4H, m), 3.77 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.24 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.63(2H, s), 6.55-6.70 (2H, m), 6.90 (1H, dd, J=8.4, 8.4 Hz), 8.00 (1H, brs).
128 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.52 (6H, s), 1.90-2.10 (4H, m), 3.63 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.95 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.8 Hz), 6.50 (1H, dd, J=2.8, 8.7 Hz), 6.86 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.57 (1H, brs).
129 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δppm: 1.56 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-2.10 (4H, m), 3.61 (2H, t, J=6.2 Hz), 3.94 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.59 (1H, q, J=6.8 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.8 Hz), 6.49 (1H, dd, J=2.8, 8.7 Hz), 6.88 (1H, d, J=8.7 Hz), 8.60 (1H, brs).
130 	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δppm: 1.81-2.10 (4H, m), 3.54-3.70 (2H, m), 3.89-4.03 (2H, m), 4.47 (2H, brs), 5.02 (1H, brs), 6.22 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.49 (1H, dd, J = 8.3, 2.4 Hz), 6.86-7.00 (2H, m).

(234)

## 實例 1

5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯之合成

將 5-(3-氯基丙氧基)-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯 (1.17 克, 5.0 毫莫耳), 1-苯並[b]噻吩-4-基六氫吡啶氫氯酸鹽 (1.35 克, 5.3 毫莫耳), 碳酸鉀 (1.74, 12.6 毫莫耳) 及碘化鈉 (0.75 克, 5.0 毫莫耳) 加至二甲基甲醯胺 (12 毫升) 中, 再將混合物於 80℃ 下攪拌 3 小時。而後將反應溶液冷卻至室溫, 將水加入, 繼而以乙酸乙酯萃取。將有機相以水清洗及於硫酸鎂上乾燥。而後將反應溶液於減壓下濃縮, 再將餘留物藉矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯 = 7: 3 → 二氯甲烷: 甲醇 = 100: 3) 予以純化。而後將純化之產物於減壓下濃縮以得淡黃色油狀物質 (1.97 克)。令油狀物質於室溫下靜置以得固狀物質, 再將其以異丙醚清洗並予乾燥, 即得 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸甲酯 (1.49 克)。

熔點: 109.0-110.5℃

MS 414 ( $M^+$ )

## 實例 2

5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸之合成

將 6N 水性氫氧化鈉溶液 (2 毫升) 加至 5-[3-(4-苯

(235)

並 [b] 噻吩 -4-基 -六 氫 吡 嘧 -1-基 ) 丙 氧 基 ]-1-甲 基 -1H-吡 啶 -3-羧 酸 甲 酯 ( 1.62 克 , 3.9 毫 莫 耳 ) 之 乙 醇 溶 液 ( 10 毫 升 ) 中 , 再 將 混 合 物 於 室 溫 下 攪 拌 4 天 。 而 後 將 6N 氫 氯 酸 ( 2 毫 升 ) 加 至 於 冰 冷 卻 下 之 反 應 溶 液 中 , 再 將 混 合 溶 液 攪 拌 。 繼 而 將 二 氯 甲 烷 加 至 反 應 溶 液 中 , 再 藉 過 濾 法 以 得 沉 澱 物 。 將 濾 液 分 離 出 , 再 將 有 機 相 於 減 壓 下 濃 縮 。 而 後 將 濾 塊 與 餘 留 物 結 合 , 以 水 清 洗 並 予 乾 燥 , 即 得 白 色 粉 狀 之 5-[3-(4-苯 並 [b] 噻 吩 -4-基 -六 氫 吡 嘧 -1-基 ) 丙 氧 基 ]-1-甲 基 -1H-吡 啶 -3-羧 酸 ( 1.53 克 ) 。

熔 點 : 114.5-118.0°C

### 實 例 3

N-甲 基 -5-[3-(4-苯 並 [b] 噻 吩 -4-基 -六 氫 吡 嘧 -1-基 ) 丙 氧 基 ]-1-甲 基 -1H-吡 啶 -3-甲 醯 胺 氫 氯 酸 鹽 之 合 成

將 5-[3-(4-苯 並 [b] 噻 吩 -4-基 -六 氫 吡 嘧 -1-基 ) 丙 氧 基 ]-1-甲 基 -1H-吡 啶 -3-羧 酸 ( 0.3 克 , 0.75 毫 莫 耳 ) 之 二 甲 基 甲 醯 胺 溶 液 於 冰 上 冷 卻 , 再 將 三 乙 胺 ( 0.73 毫 升 , 5.2 毫 莫 耳 ) , 氫 氯 酸 甲 胺 ( 0.3 克 , 4.5 毫 莫 耳 ) 及 氰 磷 酸 二 乙 酯 ( DEPC ) ( 0.25 毫 升 , 1.4 毫 莫 耳 ) 加 入 , 而 後 將 混 合 物 於 室 溫 下 攪 拌 24 小 時 。 將 三 乙 胺 ( 0.73 毫 升 , 5.2 毫 莫 耳 ) , 氫 氯 酸 甲 胺 ( 0.3 克 , 4.5 毫 莫 耳 ) 及 氰 磷 酸 二 乙 酯 ( DEPC ) ( 0.25 毫 升 , 1.4 毫 莫 耳 ) 加 入 , 再 將 混 合 物 於 室 溫 下 攪 拌 4 天 。 繼 而 將 水 加 至 反 應 溶 液 中 , 其 後 以 乙 酸 乙 酯 萃 取 。 將 萃 取 之 物 質 以 水 清 洗 及 於 硫 酸 鎂 上

(236)

乾燥。將溶液於減壓下濃縮，再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=5：1→乙酸乙酯）予以純化。而後將純化之產物於減壓下濃縮，令餘留物溶於乙酸乙酯中，再將 4N 氫氯酸/乙酸乙酯加入。而後藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，再予乾燥，即得白色粉狀之 N-甲基-5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-甲醯胺氫氯酸鹽（0.24 克）。

熔點：228.0-232.5℃（分解）

#### 實例 4

5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-甲醯胺之合成

標題化合物係依與實例 3 相同之方法，使用 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-羧酸及氯化銨而得。

白色粉末（乙酸乙酯-異丙醚）

熔點：186.5-188.5℃

#### 實例 5

4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5,N-二甲基苯醯胺之合成

標題化合物係依與實例 1 相同之方法，使用 4-(3-氯基丙氧基)-3-甲氧基-5,N-二甲基苯醯胺及 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶氫氯酸鹽而得。

(237)

白色粉末（乙酸乙酯-甲醇）

熔點：141.5-142.5℃

#### 實例 6

N-甲基-2-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]噻唑-4-甲醯胺氫氯酸鹽之合成

將氫化鈉（55%，油狀，90毫克，2.2毫莫耳）加至於冰冷卻下之3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙醇（0.2克，0.7毫莫耳）及N-甲基-2-氨基噻唑-4-甲醯胺（0.26克，1.45毫莫耳）之二甲基甲醯胺溶液（2毫升）中，再將溶液於80℃下攪拌1.5小時。將反應溶液冷卻至室溫後，將水加入，再以乙酸乙酯萃取。而後將以乙酸乙酯萃取之溶液以水清洗，於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析（二氯甲烷：乙酸乙酯=5：1→乙酸乙酯）予以純化。將純化產物於減壓下濃縮後，令餘留物溶於乙酸乙酯中。將4N氫氯酸/乙酸乙酯溶液加至此溶液中，再藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，繼而予以乾燥，即得淡黃色粉狀之N-甲基-2-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]噻唑-4-甲醯胺氫氯酸鹽（0.24克）。

熔點：199.5-202.5℃

#### 實例 7

2-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]噻唑-



(238)

## 4-甲醯胺之合成

標題化合物係依與實例 6 相同之方法，使用 3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基）丙醇（0.2 克，0.7 毫莫耳）及 2-氨基噻唑-4-甲醯胺而得。

白色粉末（乙酸乙酯-異丙醚）

熔點：139.5-140.5℃

## 實例 8

{4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基）丙氧基]-3-甲氧基-5-甲苯基}-胺基甲酸第三丁酯之合成

標題化合物係依與實例 1 相同之方法，使用[4-（3-氨基丙氧基）-3-甲氧基-5-甲苯基]-胺基甲酸第三丁酯及 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩氫氨酸鹽而得。

淡棕色油狀物質

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm : 1.51 (9H, s), 1.95-2.10 (2H, m), 2.24 (3H, s), 2.66-2.81 (6H, m), 3.14-3.31 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.95 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 6.36 (1H, br), 6.60 (1H, d,  $J=2.5\text{ Hz}$ ), 6.87-6.92 (1H, m), 7.01 (1H, d,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.24-7.31 (1H, m), 7.37-7.44 (2H, m), 7.55 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )

MS 511 (M<sup>+</sup>)。

## 實例 9

(239)

{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺之合成

將 6N 氫氯酸 (3 毫升) 加至 {4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺}-胺基甲酸第三丁酯 (2.18 克, 4.3 毫莫耳) 之甲醇溶液 (10 毫升) 中, 再將混合物於室溫下攪拌過夜。於 60°C 下攪拌 15 分鐘後, 將混合物冷卻至室溫, 再將 6N 水性氫氧化鈉溶液加入以中和之。繼而將二氯甲烷加至反應混合物中, 再將以二氯甲烷萃取之物質於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。將所得餘留物藉矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯 = 3: 2 → 乙酸乙酯) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮至乾, 即得淡黃色固狀之 {4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺 (1.26 克)。

熔點: 155.0-158.0°C

MS 411 ( $M^+$ )

#### 實例 10

N-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺}甲醯胺氫氯酸鹽之合成

將 {4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺 (0.9 克, 2.2 毫莫耳) 加至甲酸乙酯 (10 毫升) 中, 再邊加熱邊迴流 33 小時。將反應溶液冷卻至室溫後, 將其於減壓下濃縮。將所得餘留物藉鹼

(240)

性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=5：1→乙酸乙酯）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，繼而將 4N 氫氨酸/乙酸乙酯溶液加至餘留物之乙酸乙酯溶液中。再藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，即得白色粉狀之 N-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}甲醯胺氫氨酸鹽（0.3 克）。

熔點：247.5-253.0℃（分解）

#### 實例 11

N-甲基-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}甲醯胺氫氨酸鹽之合成

將 6N 水性氫氨酸鈉溶液加至 N-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}甲醯胺氫氨酸鹽（0.23 克，0.48 毫莫耳）中，再將混合溶液以二氯甲烷萃取。將以二氯甲烷萃取之溶液於硫酸鎂上乾燥及於減壓下濃縮。令所得餘留物溶於四氫呋喃（THF）溶液（5 毫升）中，再將氫化鋰鋁（30 毫克，0.71 毫莫耳）於冰冷卻下加入，再邊加熱邊迴流 15 分鐘。將反應溶液於冰上冷卻，將水（0.03 毫升），15%水性氫氧化鈉溶液（0.03 毫升），及水（0.09 毫升）以此次序加至反應混合物中，再予攪拌。而後藉過濾法移除不可溶之物質，再將濾液於減壓下濃縮。將所得餘留物藉鹼性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=5：1→3：1）予以純化，繼而於減壓下濃縮。將 4N 氫氨酸/乙酸乙酯溶液加至餘留物之乙

(241)

酸乙酯溶液中，再藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，即得白色粉狀之 N-甲基-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺氫氯酸鹽(63毫克)}。

熔點：239.5-244.0℃(分解)

#### 實例 12

3-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}噁唑啉-2-酮氫氯酸鹽之合成

標題化合物係依與實例 1 相同之方法，使用 3-[4-(3-氯基丙氧基)-3-甲氧基-5-甲基苯基]噁唑啉-2-酮及 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩氫氯酸鹽而得。

白色粉末(乙醇)

熔點：247.5-251.0℃(分解)

#### 實例 13

N-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}乙醯胺之合成

標題化合物係依與實例 1 相同之方法，使用 N-[4-(3-氯基丙氧基)-3-甲氧基-5-甲基苯基]乙醯胺及 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩氫氯酸鹽而得。

白色粉末(乙酸乙酯-異丙醚)

熔點：121.5-122.0℃

(242)

## 實例 14

N-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲苯基}-N-甲基乙醯胺氫氨酸鹽之合成

將氫化鈉 (55 %, 油狀, 0.06 克, 1.3 毫莫耳) 加至於冰冷卻下之 N-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲苯基}乙醯胺 (0.45 克, 0.99 毫莫耳) 之二甲基甲醯胺溶液 (5 毫升) 中, 再將混合物於 0℃ 下攪拌 15 分鐘。而後將甲基碘 (0.07 毫升, 1.1 毫莫耳) 加至反應溶液中, 再將溶液於 0℃ 攪拌 1 小時。進一步將氫化鈉 (55 %, 油狀, 0.06 克, 1.3 毫莫耳) 及甲基碘 (0.07 毫升, 1.1 毫莫耳) 加至反應溶液中, 再將混合溶液於 0℃ 攪拌 2 小時。而後將水加至反應溶液中並以乙酸乙酯進行萃取。將萃取物質以水清洗, 及於硫酸鎂上乾燥。繼而將反應溶液於減壓下濃縮, 再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯 = 5: 1 → 乙酸乙酯) 予以純化。將純化產物於減壓下濃縮後, 將 4N 氫氨酸/乙酸乙酯溶液加至餘留物之乙酸乙酯溶液中。再藉過濾法以得沉澱之不可溶物質, 即得 N-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲苯基}-N-甲基乙醯胺氫氨酸鹽 (325 毫克)。

熔點: 230.0-234.0℃ (分解)

## 實例 15

4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-N,N-

(243)

## 二甲基-3-甲氧基-5-甲基苯胺氫氨酸鹽之合成

將福馬林（37%，0.29 毫升，3.9 毫莫耳）及氰基氫硼化鈉（0.21 克，3.1 毫莫耳）加至於冰冷卻下之 {4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺（0.32 克，0.78 毫莫耳）之甲醇溶液（6 毫升）中，再將混合物於 0℃ 下攪拌 15 分鐘。而後將乙酸（0.18 毫升，3.1 毫莫耳）加至反應溶液中，再將混合物於室溫下攪拌一小時。繼而將水性碳酸鉀溶液加至於冰冷卻下之反應溶液中，再以乙酸乙酯進行萃取。而後將萃取物質於硫酸鎂上乾燥。將反應溶液於減壓下濃縮，再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯 = 11：1 → 3：1）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮。將 4N 氫氨酸及乙酸乙酯之溶液加至餘留物之乙酸乙酯溶液中，再藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，即得 4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-N,N-二甲基-3-甲氧基-5-甲基苯胺氫氨酸鹽（137 毫克）。

熔點：234.5-240.5℃（分解）

## 實例 16

{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}胺基甲酸甲酯氫氨酸鹽之合成

標題化合物係依與實例 1 相同之方法，使用 4-(3-氨基丙氧基)-3-甲氧基-5-甲基苯基]胺基甲酸甲酯及 1-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩氫氨酸鹽而得。

(244)

白色粉末（乙酸乙酯）

熔點：230.0-235.5℃

#### 實例 17

N-甲基-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲苯基}胺基甲酸甲酯氫氨酸鹽之合成

標題化合物係依與實例 14 相同之方法，使用{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲苯基}胺基甲酸甲酯氫氨酸鹽及甲基碘而得。

白色粉末（乙酸乙酯）

熔點：228.0-233.5℃

#### 實例 18

6-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3,4-二氫-2H-苯並[1,4]噁咩氫氨酸鹽之合成

令氫化鋰鋁（86 毫克，2.3 毫莫耳）懸浮於四氫呋喃（20 毫升）中。再將 6-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3,4-二氫-2H-苯並[1,4]噁咩-3-酮（0.8 克，1.9 毫莫耳）之四氫呋喃溶液（10 毫升）於氫氣層下逐滴加入此溶液中。逐滴加入完全後，將反應溶液邊加熱邊迴流一小時。將水（0.1 毫升），15 %水性氫氧化鈉溶液（0.1 毫升），及水（0.3 毫升）加至於冰冷卻下之反應溶液中，再予攪拌。而後藉賽力特砍藻土過濾法將不可溶之物質移除，再將濾液於減壓下濃縮。將所得餘留物藉矽

(245)

膠管柱層析（二氯甲烷：甲醇=1：0→20：1）予以純化及於減壓下濃縮。令餘留物溶於乙酸乙酯（10 毫升）中，再將 1N 氫氨酸/乙醇之溶液（0.34 毫升）加入，而後將混合物於室溫下攪拌 15 分鐘。藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，以乙酸乙酯清洗並予乾燥，即得白色固狀之 6-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3,4-二氫-2H-苯並[1,4]噁吡啶氫氨酸鹽（0.11 克）。

熔點：207.9-208.8℃

#### 實例 19

7-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3,4-二氫-2H-苯並[1,4]噁吡啶氫氨酸鹽之合成

標題化合物係依與實例 18 相同之方法，使用 7-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3,4-二氫-2H-苯並[1,4]噁吡啶-3-酮而得。

淡棕色固狀物（乙酸乙酯）

熔點：214.0-215.9℃

#### 實例 20

7-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-4-甲基-3,4-二氫-2H-苯並[1,4]噁吡啶氫氨酸鹽之合成

將福馬林（37%，0.22 毫升，2.7 毫莫耳）及 MP-氰基氫硼化物（2.41 毫莫耳/克，1.12 克，2.7 毫莫耳）加至 7-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3,4-



(246)

二氫-2H-苯並[1,4]噁吡（0.30 克，0.67 毫莫耳）之甲醇溶液（15 毫升）中，再將混合物於室溫下攪拌過夜。而後藉過濾法移除不可溶之物質，再將濾液於減壓下濃縮。將所得餘留物藉矽膠管柱層析（二氯甲烷：甲醇=1：0→50：1）予以純化。再將純化產物於減壓下濃縮，繼而令餘留物溶於乙酸乙酯（15 毫升）中，再將 1N 氫氯酸/乙醇之溶液（0.64 毫升）加入。而後將混合物於室溫下攪拌 15 分鐘。藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，以乙酸乙酯清洗並予乾燥，即得淡棕色固狀之 7-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-4-甲基-3,4-二氫-2H-苯並[1,4]噁吡氫氯酸鹽（0.23 克）。

熔點：248.1-249.6℃

#### 實例 21

6-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-3-甲基-1,2,3,4-四氫喹啉-4-醇氫氯酸鹽及 6-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-3-甲基-1,2,3,4-四氫喹啉氫氯酸鹽之合成

將 6-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-3-甲基喹啉（0.25 克，0.58 毫莫耳）之四氫呋喃溶液（20 毫升）於冰上冷卻。再將氫化鋰鋁（26 毫克，0.69 毫莫耳）之四氫呋喃溶液（5 毫升）於氫氣層下逐滴加入此溶液中。逐滴加入完全後，將溶液於室溫下攪拌 20 分鐘，而後邊加熱邊迴流一小時。將水（0.03 毫升），15

(247)

%水性氫氧化鈉溶液（0.03 毫升），及水（0.1 毫升）加至於冰冷卻下之反應溶液中，再予攪拌。而後藉賽力特砍藻土過濾法將不可溶之物質移除，再將濾液於減壓下濃縮。將所得餘留物藉矽膠管柱層析（二氯甲烷：甲醇=1：0→25：1）予以純化。再將純化產物於減壓下濃縮，令餘留物溶於乙酸乙酯（5 毫升）中。將 1N 氫氯酸/乙醇之溶液（0.189 毫升）加入，而後將混合物於室溫下攪拌 15 分鐘。藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，以乙酸乙酯清洗並予乾燥，即得白色固狀之 6-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-3-甲基-1,2,3,4-四氫喹啉-4-醇氫氯酸鹽（87 毫克）。

MS 438 ( $M^+$ )

令洗提之二氯甲烷/甲醇（10：1）溶液通過矽膠管柱層析之柱中。再將所得洗提液於減壓下濃縮，而後令餘留物溶於乙酸乙酯（5 毫升）中。繼而將 1N 氫氯酸/乙醇溶液（0.226 毫升）加入，再將混合物於室溫下攪拌 15 分鐘。而後藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，再予乾燥，即得白色固狀之 6-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-3-甲基-1,2,3,4-四氫喹啉氫氯酸鹽（49 毫克）。

熔點：203.1-204.4℃

## 實例 22

5-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-2,3-

(248)

## 二氫-1H-吡啶氮氯酸鹽之合成

將三乙矽烷（1.14 毫升，7.14 毫莫耳）加至 5-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-1H-吡啶（228 毫克，0.71 毫莫耳）之三氟乙酸溶液（5 毫升）中，再將混合物於 50℃ 下攪拌 2 小時。而後將混合物於減壓下濃縮。令餘留物溶於二氯甲烷中，以飽和水性碳酸氫鈉溶液中和並予分離。將有機相以飽和水性碳酸氫鈉溶液，水及飽和鹽水溶液依此次序清洗，而後於減壓下濃縮。再將所得餘留物藉矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=5：1→1：1）予以純化。而後將純化之產物於減壓下濃縮，再將餘留物加至乙酸乙酯（5 毫升）中，繼而將 1N 氮氯酸/乙醇溶液（0.10 毫升）加入，再將混合物於室溫下攪拌 15 分鐘。藉過濾法以得沉澱之不可溶物質，以乙酸乙酯清洗，並予乾燥，即得白色固狀之 5-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-2,3-二氫-1H-吡啶氮氯酸鹽（32 毫克）。

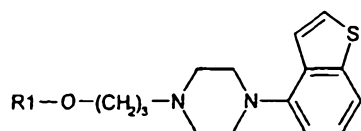
熔點：222.4-223.9℃


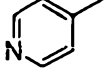

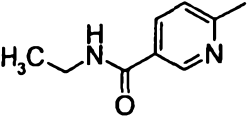
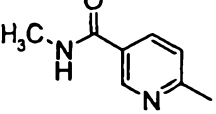
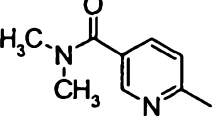
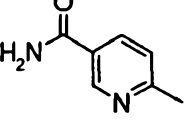
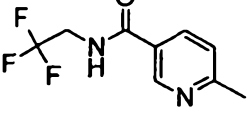
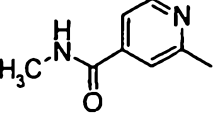
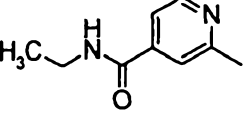
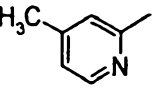
下表 13 至 311 所列之化合物係依與參考實例 1 至 36 或實例 1 至 22 及 3094 至 3110 相同之方法，使用適當之原材料物質製得。

下表中，具有物理性質諸如結晶形式、熔點、鹽、<sup>1</sup>H-NMR 及 MS（質譜）等之化合物係實際製得。

(249)

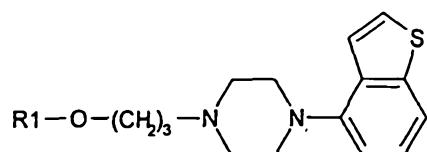
[表13]

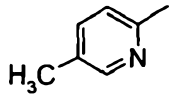
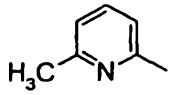
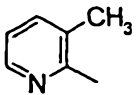
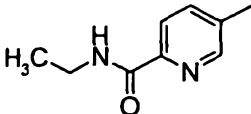
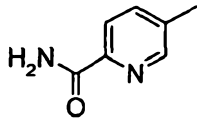
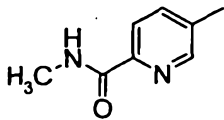
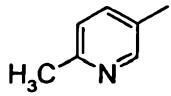
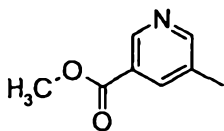
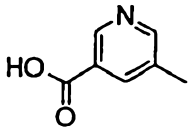
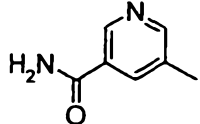


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
23		白色固狀物 (乙醇)	225-228	三氫氨酸鹽
24		白色針形結晶 (乙醇/乙酸乙酯)	165.0-167.0	氫氨酸鹽
25		白色固狀物 (乙醇)	204-206	氫氨酸鹽
26		白色粉末 (乙酸乙酯)	201.5-207.5	氫氨酸鹽
27		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	132.5-133.5	—
28		白色粉末 (乙酸乙酯)	205.5-208.0	氫氨酸鹽
29		白色粉末 (2-丙醇)	206.5-208.0	—
30		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	201.5-204.0	氫氨酸鹽
31		白色粉末 (乙酸乙酯)	155.5-162.0	氫氨酸鹽
32		白色粉末 (乙酸乙酯)	140.0-141.5	氫氨酸鹽
33		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	192-194	二氫氨酸鹽

(250)

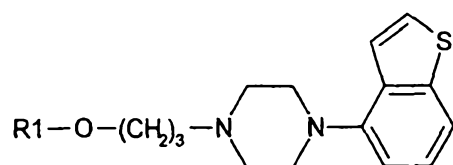
[表14]

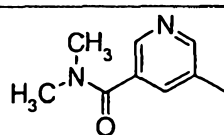
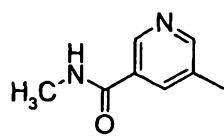
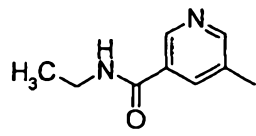
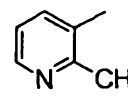
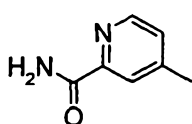
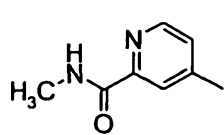
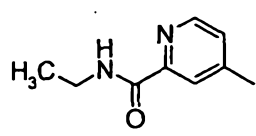
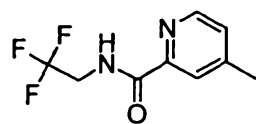
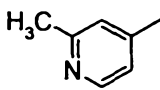
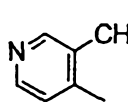


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
34		淡黃色粉末 (乙醇)	201-203	二氫氨酸鹽
35		白色粉末 (乙醇)	201-203	氫氨酸鹽
36		白色粉末 (乙醇)	214.0-215.0	氫氨酸鹽
37		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	131.5-132.0	—
38		白色粉末 (乙酸乙酯)	193.0-194.0	—
39		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	128.0-129.5	—
40		白色粉末 (乙醇)	234.0-236.0	氫氨酸鹽
41		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	224.0-226.0	二氫氨酸鹽
42		白色粉末 (水)	230.0 (分解)	氫氨酸鹽
43		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	171.0-174.5	—

(251)

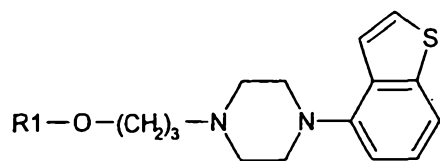
[表15]


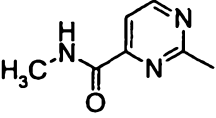
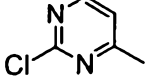
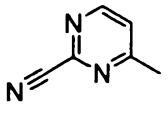
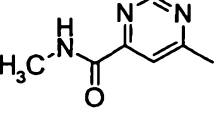
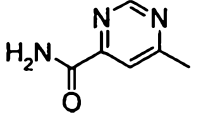
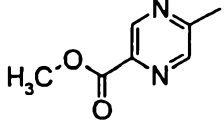
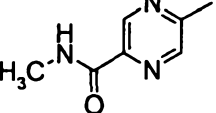
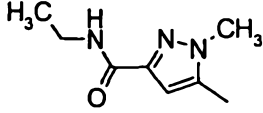
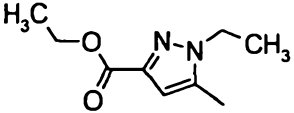


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
44		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	166.0 (分解)	二氫氯酸鹽
45		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	198.5-204.0	二氫氯酸鹽
46		白色粉末 (乙酸乙酯)	211.5-214.5	二氫氯酸鹽
47		白色粉末 (乙醇)	241.0-243.0	氫氯酸鹽
48		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	150.0-150.5	—
49		白色粉末 (乙酸乙酯)	199.0-200.5	二氫氯酸鹽
50		白色粉末 (乙酸乙酯)	206.0-208.5	氫氯酸鹽
51		白色粉末 (乙酸乙酯)	208.0-213.0	氫氯酸鹽
52		白色粉末 (乙醇)	157-159	氫氯酸鹽
53		白色粉末 (乙醇)	197.0-199.0	二氫氯酸鹽

(252)

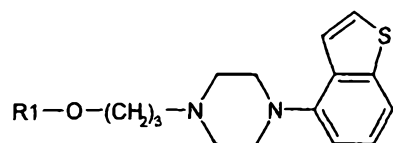
[表16]

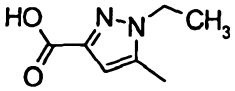
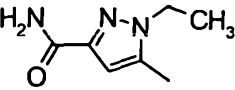
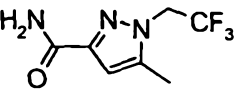
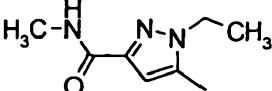
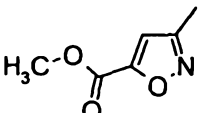
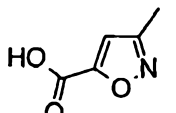
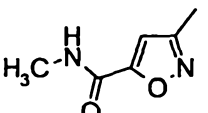
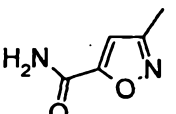
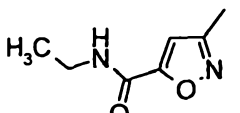
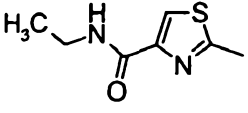
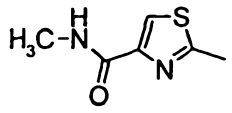


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
54		白色粉末 (乙醇)	205-207	氫氨酸鹽
55		白色粉末 (乙酸乙酯)	178.0-182.5	氫氨酸鹽
56		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	191.5-195.5	氫氨酸鹽
57		淡黃色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	112.0-115.5	—
58		白色粉末 (甲醇)	205.0-209.5	氫氨酸鹽
59		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	149.5-151.0	—
60		淡黃色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	114.5-115.5	—
61		白色粉末 (甲醇)	116.5-118.0	—
62		白色粉末 (乙酸乙酯)	210.5-214.5	氫氨酸鹽
63		淡黃色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	109.0-110.0	—

(253)

[表17]



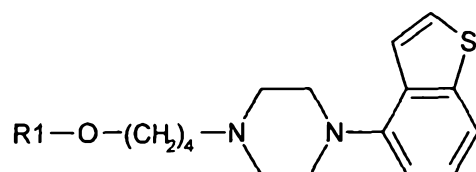
實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
64		白色粉末 (乙醇/水)	129.0-131.0	—
65		白色粉末 (乙酸乙酯)	247.5 (分解)	氫氨酸鹽
66		白色粉末 (乙酸乙酯)	231.0-234.0	氫氨酸鹽
67		白色粉末 (乙酸乙酯)	245.5 (分解)	氫氨酸鹽
68		白色粉末 (乙酸乙酯)	199.5-201.5	氫氨酸鹽
69		白色粉末 (乙醇/水)	252.5-255.0 (分解)	—
70		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	131.5-132.5	—
71		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	167.5-169.0	—
72		白色粉末 (乙酸乙酯)	219.5-222.5 (分解)	氫氨酸鹽
73		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	151.0-153.5	氫氨酸鹽
74		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	138.5-140.0	—

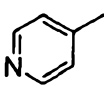
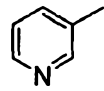
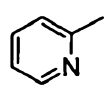
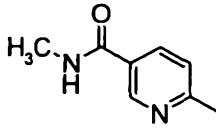
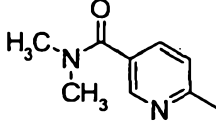
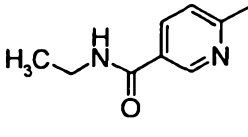
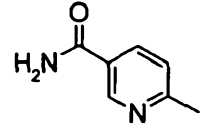
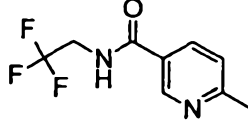
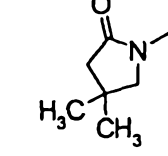




(255)

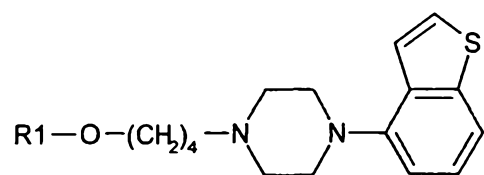
[表20]

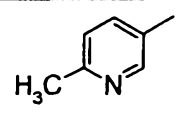
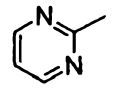


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
80		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	183.0-185.0	二氫氨酸鹽
81		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	205.0-207.0	氫氨酸鹽
82		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	197.0-199.0	氫氨酸鹽
83		白色粉末 (乙酸乙酯)	166.5-168.0	氫氨酸鹽
84		白色粉末 (乙酸乙酯)	196.0-201.0	氫氨酸鹽
85		白色粉末 (乙酸乙酯)	175.0-176.0	氫氨酸鹽
86		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	150.0-154.5	—
87		白色粉末 (乙酸乙酯)	172.0-175.0	氫氨酸鹽
88		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	201-205	氫氨酸鹽

(256)

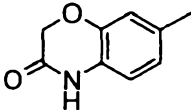
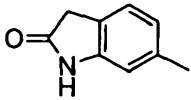
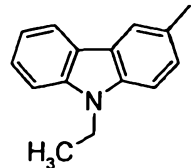
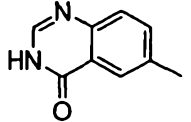
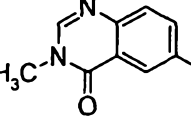
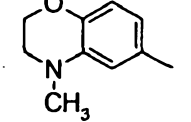
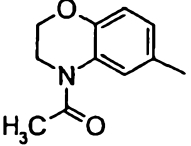
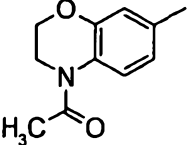
[表21]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
89		白色粉末 (乙醇)	195-197	氫氨酸鹽
90		白色粉末 (乙醇)	190-192	氫氨酸鹽

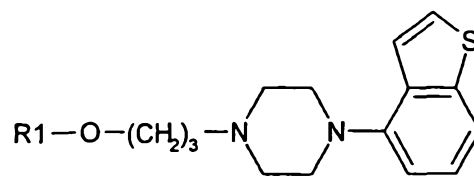
(257)

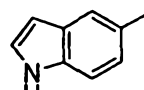
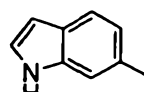
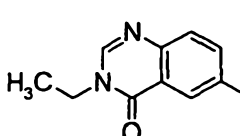
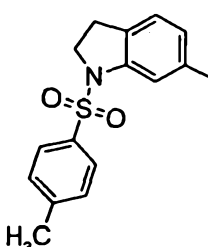
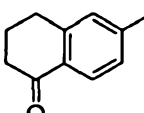
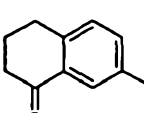

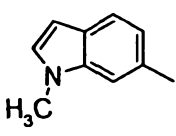
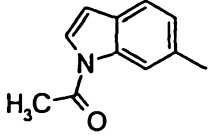
[表22]

$\text{R1}-\text{O}-(\text{CH}_2)_3-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{C}_6\text{H}_4 \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{C}_4\text{H}_3\text{S} \end{array}$				
實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
91		白色粉末 (乙酸乙酯)	149-150	—
92		淡粉紅色粉末 (乙醇)	161-163	—
93		白色固狀物 (乙酸乙酯)	226.8-229.0	氫氨酸鹽
94		白色固狀物 (乙酸乙酯)	213.1-218.5	—
95		白色固狀物 (乙酸乙酯)	252.9-254.3	氫氨酸鹽
96		白色固狀物 (乙酸乙酯)	238.7-239.9	氫氨酸鹽
97		白色固狀物 (乙酸乙酯)	238.9-240.7	氫氨酸鹽
98		淡棕色固狀物 (乙酸乙酯)	218.4-220.4	氫氨酸鹽

(258)

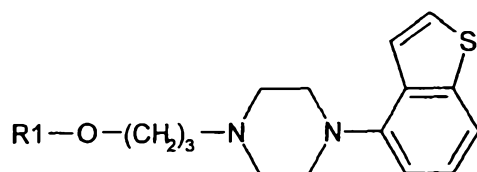
[表23]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
99		白色固狀物 (乙酸乙酯)	267.0-271.0	氫氨酸鹽
100		白色固狀物 (乙酸乙酯 / 己烷)	143.8-145.2	—
101		白色固狀物 (乙酸乙酯)	250.6-252.1	氫氨酸鹽
102		白色固狀物 (乙酸乙酯)	233.3-235.2	氫氨酸鹽
103		白色固狀物 (乙醇/ 乙酸乙酯)	251.1-253.6	氫氨酸鹽
104		白色固狀物 (乙酸乙酯)	249.8-252.3	氫氨酸鹽
105		白色固狀物 (乙酸乙酯)	255.1-256.6	氫氨酸鹽
106		白色固狀物 (乙酸乙酯)	207.9-208.7	氫氨酸鹽
107		白色固狀物 (乙酸乙酯)	214.5-216.8	氫氨酸鹽

(259)

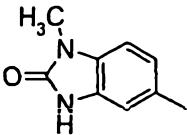
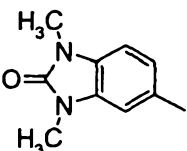
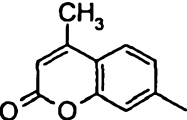
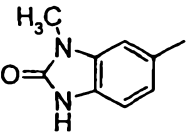
[表24]



實例	R1	NMR	鹽
108		$^1\text{H-NMR (CDCl}_3\text{) } \delta$ ppm: 2.04–2.13 (2H, m), 2.65 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.73 (4H, br), 3.19 (4H, br), 4.15 (2H, t, $J=6.6$ Hz), 4.67 (2H, s), 6.42 (1H, dd, $J=1.3, 8.0$ Hz), 6.69 (1H, dd, $J=1.3, 8.3$ Hz), 6.87–6.92 (2H, m), 7.25–7.30 (1H, m), 7.35–7.42 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.84 (1H, br)	—
109		$^1\text{H-NMR (DMSO-}d_6\text{) } \delta$ ppm: 1.80–2.00 (2H, m), 2.45–2.55 (2H, m), 2.55–2.65 (4H, br), 3.00–3.10 (4H, br), 3.93 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.47 (2H, s), 6.45–6.55 (2H, m), 6.80–6.90 (2H, m), 7.26 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.38 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 7.60 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.67 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 10.59 (1H, s)	—
110		$^1\text{H-NMR (CDCl}_3\text{) } \delta$ ppm: 2.06 (2H, quint, $J=6.5$ Hz), 2.66 (2H, t, $J=6.9$ Hz), 2.70–2.80 (4H, m), 3.20–3.25 (4H, m), 4.12 (2H, t, $J=6.1$ Hz), 4.60 (2H, s), 6.55–6.70 (2H, m), 6.88 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 6.91 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7.20–7.30 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.43 (1H, brs)	—
111		$^1\text{H-NMR (DMSO-}d_6\text{) } \delta$ ppm: 1.80–1.90 (2H, m), 2.41 (2H, t, $J=6.6$ Hz), 2.50–2.55 (4H, m), 2.95–3.00 (4H, m), 3.83 (2H, t, $J=6.7$ Hz), 6.47 (1H, dd, $J=2.4, 8.6$ Hz), 6.70 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 6.85 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.09 (1H, d, $J=8.6$ Hz), 7.27 (1H, dd, $J=7.9, 7.9$ Hz), 7.36 (1H, d, $J=5.6$ Hz), 7.60 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.67 (1H, d, $J=5.6$ Hz), 9.46 (1H, brs)	—
112		$^1\text{H-NMR (DMSO-}d_6\text{) } \delta$ ppm: 1.88 (2H, t, $J=6.8$ Hz), 2.50–2.55 (2H, m), 2.60 (4H, brs), 3.06 (4H, brs), 3.95 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 6.45–6.55 (2H, m), 6.78 (1H, d, $J=9.1$ Hz), 6.88 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 7.26 (1H, dd, $J=7.8, 7.8$ Hz), 7.39 (1H, d, $J=5.6$ Hz), 7.55–7.70 (2H, m), 10.35 (1H, brs), 10.49 (1H, brs)	—

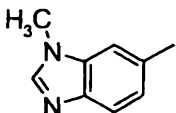
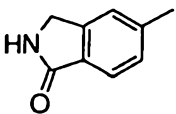
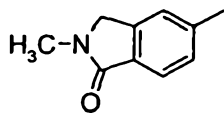
(260)

[表25]

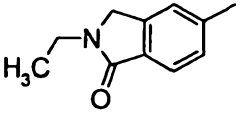
R1—O—(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> —N		N		噻吩基	
實例	R1	NMR		鹽	
113		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.20–2.30 (2H, m), 2.45–2.55 (2H, m), 3.00–3.80 (11H, m), 4.06 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.60–6.70 (2H, m), 6.90–7.00 (2H, m), 7.33 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.67 (1H, brs), 10.81 (1H, brs).		二氫氨酸鹽	
114		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.00–2.10 (4H, m), 2.70–2.85 (6H, m), 3.20–3.25 (4H, m), 3.40 (6H, s), 4.097 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.61 (1H, d, J=2.2 Hz), 6.68 (1H, dd, J=2.3, 8.4 Hz), 6.85 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.92 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.25–7.35 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.57 (1H, d, J=8.0 Hz).		—	
115		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.25–2.35 (2H, m), 2.40 (3H, s), 3.20–3.70 (10H, m), 4.22 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.22 (1H, s), 6.95–7.05 (3H, m), 7.31 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.49 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.65–7.80 (3H, m), 10.93 (1H, brs).		氫氨酸鹽	
116		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.00–2.10 (2H, m), 2.60–2.70 (2H, m), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.39 (3H, s), 4.05–4.15 (2H, m), 6.55–6.70 (2H, m), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.96 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.25–7.30 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 9.12 (1H, brs).		—	

(261)

[表25-1]

R1-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N<img alt="piperidine ring" data-bbox="445 180 505 220"/>-N<img alt="thienylphenyl group" data-bbox="445 145 505 220"/>				
實例	R1	NMR	鹽	
117		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.10 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70 (2H, t, J=7.4 Hz), 2.77 (4H, brs), 3.22 (4H, brs), 3.80 (3H, s), 4.14 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.85-7.00 (3H, m), 7.25-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.77 (1H, s).	—	
118		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.07 (2H, t, J=7.0 Hz), 2.65 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.74 (4H, brs), 3.20 (4H, brs), 4.13 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.40 (2H, s), 6.38 (1H, brs), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.97 (1H, s), 7.02 (1H, dd, J=2.1, 8.4 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.78 (1H, d, J=8.4 Hz).	—	
119		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.07 (2H, t, J=7.0 Hz), 2.66 (2H, t, J=5.7 Hz), 2.74 (4H, brs), 3.17 (3H, s), 3.20 (4H, brs), 4.12 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.31 (2H, s), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.90-7.00 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m), 7.39 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.41 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.74 (1H, d, J=8.4 Hz).	—	

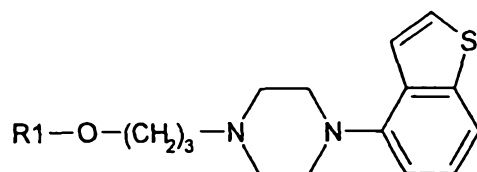
[表25-2]

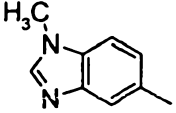
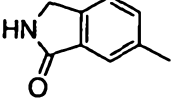
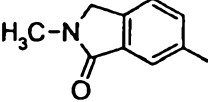
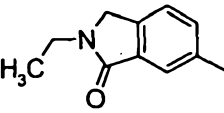
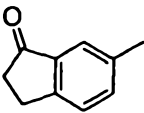
R1-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N<img alt="piperidine ring" data-bbox="445 625 505 665"/>-N<img alt="thienylphenyl group" data-bbox="445 590 505 665"/>				
實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
120		白色粉末 (甲醇)	242-246	氫氨酸鹽



(262)

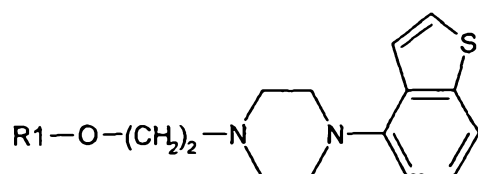
[表25-3]

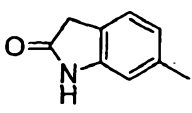


實例	R1	NMR	鹽
121		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 2.08 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.69 (2H, t, $J=7.4$ Hz), 2.76 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.82 (3H, s), 4.13 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 6.91 (1H, d, $J=6.3$ Hz), 6.99 (1H, dd, $J=2.3, 8.7$ Hz), 7.25–7.35 (3H, m), 7.39 (1H, d, $J=5.6$ Hz), 7.43 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.81 (1H, s).	—
122		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 2.00–2.10 (2H, m), 2.65 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.74 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 4.13 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 4.40 (2H, s), 6.84 (1H, brs), 6.91 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.16 (1H, dd, $J=2.3, 8.3$ Hz), 7.25–7.30 (1H, m), 7.35–7.45 (4H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz).	—
123		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 2.06 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.65 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.74 (4H, brs), 3.20 (7H, brs), 4.12 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 4.31 (2H, s), 6.91 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 7.10 (1H, dd, $J=2.4, 8.3$ Hz), 7.25–7.35 (2H, m), 7.35 (1H, d, $J=2.3$ Hz), 7.39 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 7.42 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz).	—
124		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{DMSO}-d_6$ ) $\delta$ ppm: 1.15 (3H, t, $J=7.3$ Hz), 2.20–2.30 (2H, m), 3.15–3.30 (2H, m), 3.30–3.40 (4H, m), 3.45–3.70 (6H, m), 4.16 (2H, t, $J=5.8$ Hz), 4.39 (2H, s), 6.97 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.10–7.25 (2H, m), 7.31 (1H, dd, $J=7.9, 7.9$ Hz), 7.45–7.55 (2H, m), 7.69 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.76 (1H, d, $J=5.6$ Hz), 10.74 (1H, brs).	氫氨酸鹽
125		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{DMSO}-d_6$ ) $\delta$ ppm: 2.20–2.30 (2H, m), 2.64 (2H, t, $J=5.8$ Hz), 3.01 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 3.20–3.40 (6H, m), 3.53 (2H, d, $J=12.3$ Hz), 3.64 (2H, d, $J=11.2$ Hz), 4.15 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 6.95 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 7.13 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 7.25–7.35 (2H, m), 7.45–7.55 (2H, m), 7.69 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.75 (1H, d, $J=5.6$ Hz), 11.12 (1H, brs).	氫氨酸鹽

(263)

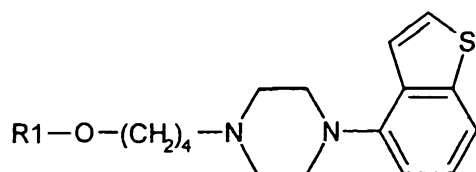
[表26]

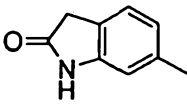
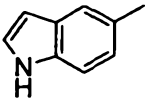
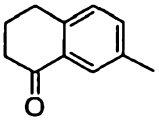
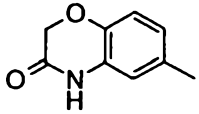
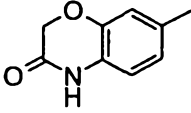
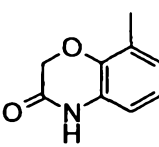
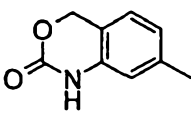
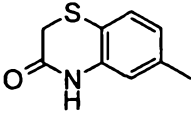
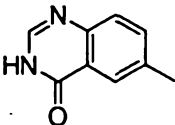
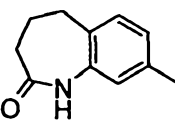


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
126		紅棕色粉末 (乙腈)	191-193	—

(264)

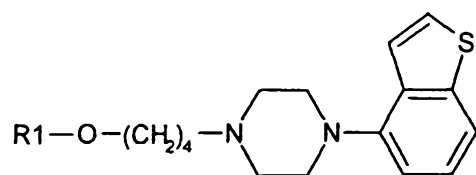
[表27]

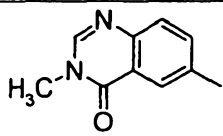
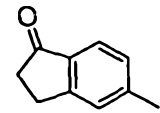
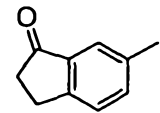
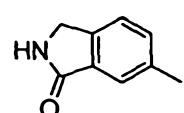


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
127		紅棕色粉末 (乙醇)	215-217	氫氨酸鹽
128		白色固狀物 (乙酸乙酯)	209.2-210.9	氫氨酸鹽
129		白色固狀物 (乙醇/乙酸乙酯)	242.0-244.9	氫氨酸鹽
130		白色粉末 (乙醇)	211-213	氫氨酸鹽
131		淡紫色粉末 (乙酸乙酯)	180-182	—
132		淡粉紅色粉末 (乙醇)	170.2-171.9	—
133		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	253-258 (分解)	氫氨酸鹽
134		白色粉末 (2-丙醇)	213.7-220.6	氫氨酸鹽
135		白色固狀物 (乙酸乙酯)	152.6-155.3	氫氨酸鹽
136		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	226-228	氫氨酸鹽

(265)

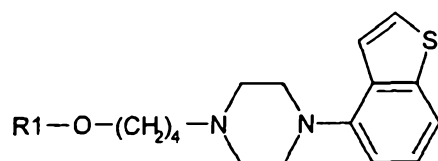
[表28]

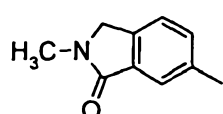
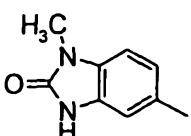
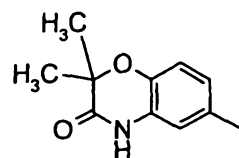
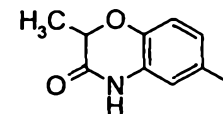
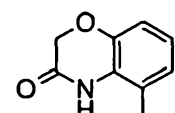
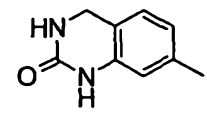


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
137		白色固狀物 (乙酸乙酯)	238.8-241.8	氫氨酸鹽
138		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	198-201	氫氨酸鹽
139		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	206-209	氫氨酸鹽
140		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	157-161	—

(266)

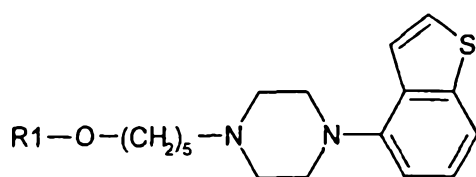
[表29]

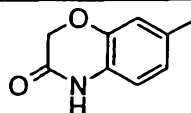
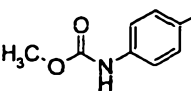
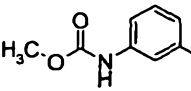


實例	R1	NMR	鹽
141		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.75–1.85 (2H, m), 1.90–1.95 (2H, m), 3.05 (3H, s), 3.15–3.35 (6H, m), 3.55–3.65 (4H, m), 4.08 (2H, t, J=6.1 Hz), 4.36 (2H, s), 6.95 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.10–7.20 (2H, m), 7.30 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.45–7.50 (2H, m), 7.69 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.75 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.75 (1H, brs).	二氫氨酸鹽
142		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.70–1.80 (2H, m), 1.85–2.00 (2H, m), 3.22 (3H, s), 3.15–3.35 (6H, m), 3.45–3.60 (4H, m), 3.95 (2H, t, J=6.1 Hz), 6.60–6.65 (2H, m), 6.90–7.00 (2H, m), 7.30 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.45–7.50 (1H, m), 7.68 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.75 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.82 (1H, s), 11.31 (1H, brs).	氫氨酸鹽
143		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.52 (6H, s), 1.60–1.90 (4H, m), 2.53 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70–2.80 (4H, m), 3.10–3.30 (4H, m), 3.97 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.37 (1H, d, J=2.7 Hz), 6.53 (1H, dd, J=2.7, 8.8 Hz), 6.85–6.95 (2H, m), 7.25–7.35 (2H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.06 (1H, s)	—
144		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.37 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.50–1.80 (4H, m), 2.41 (2H, t, J=6.9 Hz), 2.55–2.65 (4H, br), 3.90 (2H, t, J=6.2 Hz), 4.51 (1H, q, J=6.7 Hz), 6.45–6.50 (2H, m), 6.80–6.90 (2H, m), 7.25 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.38 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.59 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.67 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.53 (1H, s)	—
145		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.65–1.95 (4H, m), 2.53 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70–2.75 (4H, m), 3.15–3.25 (4H, m), 4.08 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.61 (2H, s), 6.57 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.61 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.85–6.95 (2H, m), 7.20–7.35 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.80 (1H, brs)	—
146		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.60–1.88 (4H, m), 2.51 (2H, t, J=7.5 Hz), 2.63–2.77 (4H, m), 3.13–3.25 (4H, m), 3.95 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.46 (2H, s), 5.28 (1H, brs), 6.25 (1H, d, J=2.4 Hz), 6.50 (1H, dd, J=8.4, 2.4 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.7 Hz), 6.92 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.27 (1H, dd, J=7.8, 8.0 Hz), 7.38 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.41 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.51 (1H, brs), 7.54 (1H, d, J=8.0 Hz)	—

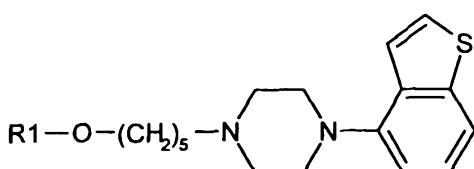
(267)

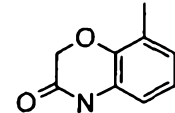
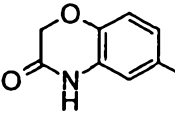
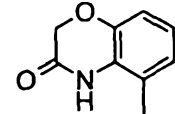
[表30]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
147		白色粉末 (乙酸乙酯)	143-144	—
148		淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	112.5-114.5	—
149		白色粉末 (乙酸乙酯)	208.0-211.5	氫氨酸鹽

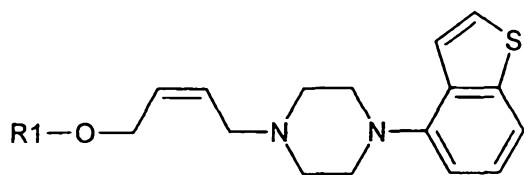
[表31]



實例	R1	NMR	鹽
150		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.40-1.67 (2H, m), 1.73-1.90 (4H, m), 3.13-3.30 (6H, m), 3.52-3.62 (4H, m), 3.96-4.01 (2H, m), 4.54 (2H, s), 6.50 (1H, d, J=7.7 Hz), 6.67 (1H, d, J=7.3 Hz), 6.83-6.88 (1H, m), 6.96 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.28-7.34 (1H, m), 7.48 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.6 Hz), 10.42 (1H, br), 10.67 (1H, br)	氫氨酸鹽
151		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.40-1.60 (4H, m), 1.60-1.80 (2H, m), 2.35-2.45 (2H, m), 2.55-2.65 (4H, br), 3.90 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.49 (2H, s), 6.45-6.55 (2H, m), 6.80-6.95 (2H, m), 7.28 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.40 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.62 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.69 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.61 (1H, s)	—
152		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.45-1.70 (4H, m), 1.80-1.90 (2H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 2.65-2.75 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 4.05 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.61 (2H, s), 6.50-6.65 (2H, m), 6.85-6.95 (2H, m), 7.20-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.80 (1H, brs)	—

(268)

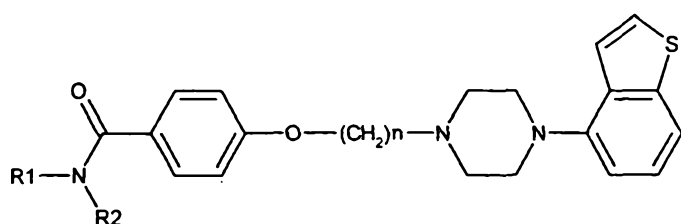
[表32]



實例	R1	NMR	鹽
153		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.73 (4H, m), 3.19–3.20 (6H, m), 4.56 (2H, s), 4.54–4.62 (2H, m), 5.76–5.92 (2H, m), 6.38 (1H, d, J=2.7 Hz), 6.54 (1H, dd, J=8.8, 2.7 Hz), 6.89–6.92 (2H, m), 7.25 (1H, m), 7.39–7.41 (2H, m), 7.53–7.56 (2H, m)	—

(269)

[表33]

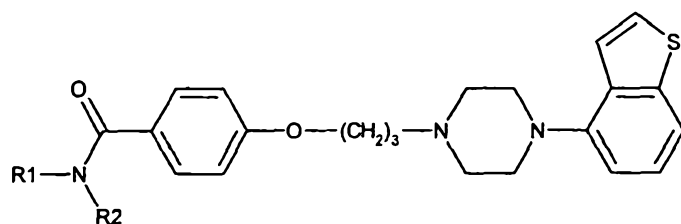


實例	R1	R2	n	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
154	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯)	218.5-222.0 (分解)	氫氨酸鹽
155	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	3	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	127.0-128.5	—
156	-H	-CH <sub>3</sub>	3	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	151.0-154.5	—
157	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯)	206.5-211.5	氫氨酸鹽
158	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯)	205.5-209.0	氫氨酸鹽
159	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯)	217.0 (分解)	氫氨酸鹽
160	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯)	229.5-232.5	二氫氨酸鹽
161	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯)	218.5-221.0	氫氨酸鹽
162	-H	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	165.5-167.0	—
163	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	131.5-132.5	—
164	-H	-H	3	白色粉末 (二氯甲烷)	186.0-191.0	—
165	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> OH	3	白色固狀物 (乙醇)	202-203	氫氨酸鹽
166	-H		3	淡棕色固狀物 (乙醇)	215-216	氫氨酸鹽
167	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4	白色粉末 (乙酸乙酯)	198.0-199.5	氫氨酸鹽
168	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4	白色粉末 (乙酸乙酯)	194.5-196.0	氫氨酸鹽
169	-H	-H	4	白色粉末 (2-丙醇)	150.0-151.5	—
170	-H	-CH <sub>3</sub>	4	白色粉末 (乙酸乙酯)	154.0-156.0	—
171	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4	白色粉末 (乙酸乙酯)	226.0 (分解)	氫氨酸鹽



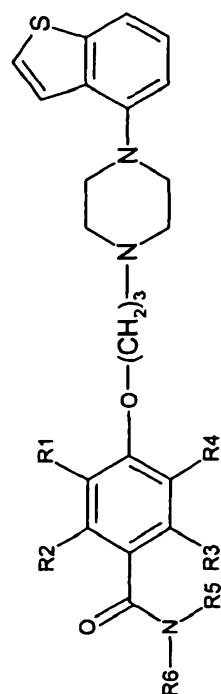
(270)

[表34]



實例	R1	R2	NMR	鹽
172	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.1-2.2 (2H, m), 3.1-3.8 (14H, m), 4.17 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.6-4.8 (1H, br), 6.9-7.1 (3H, m), 7.33 (1H, dd, J=7.9, 8.1 Hz), 7.51 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.72 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.86 (2H, d, J=8.8 Hz), 8.2-8.3 (1H, br), 10.2-10.4 (1H, br).	氫氨酸鹽

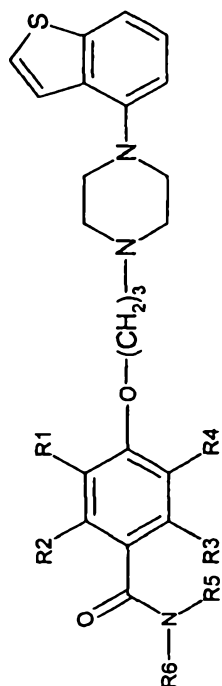
[表35]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點 (°C)	鹽
173	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	199.0-204.0	氫氨酸鹽
174	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	162.0-163.0	-
175	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	154.0-155.5	-
176	-Cl	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	145.0-148.0	-
177	-H	-H	-H	-Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	213.0 (分解)	氫氨酸鹽
178	-H	-H	-H	-Cl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	211.0 (分解)	氫氨酸鹽
179	-Cl	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	128.5-131.0	-
180	-F	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	153.5-156.0	-

(272)

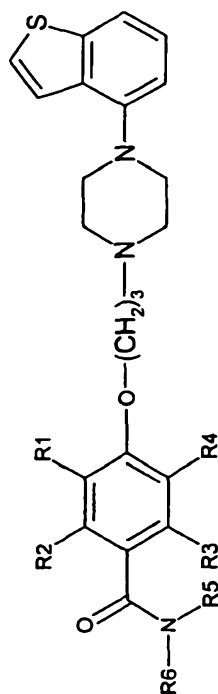
[表36]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
181	-H	-H	-H	-F	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	232.0 (分解)	氫氨酸鹽
182	-H	-H	-H	-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	198.0-202.0	氫氨酸鹽
183	-H	-H	-H	-F	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	210.5-213.0	氫氨酸鹽
184	-F	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	176.5-179.5	-
185	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (2-丙醇)	178.5-180.0	-
186	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (2-丙醇)	156.5-158.0	-
187	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	220.0-222.0 (分解)	氫氨酸鹽
188	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (2-丙醇)	140.5-143.0	-
189	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (2-丙醇)	154.5-157.0	-
190	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (2-丙醇)	162.0-163.5	-

(273)

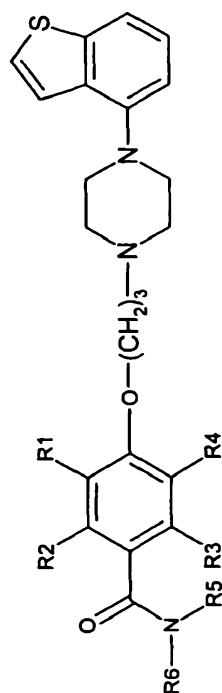
[表37]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
191	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (2-丙醇)	160.5-162.0	-
192	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	淡黃色粉末 (2-丙醇)	144.5-146.0	-
193	-Cl	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	白色粉末	120-122	-
194	-H	-H	-H	-F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	215.0-217.0	氫氨酸鹽
195	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙醇/己烷)	120.0-121.0	-
196	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	194-196	氫氨酸鹽
197	-Br	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	152.5-154.0	-
198	-Br	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	148.0-150.0	-
199	-H	-H	-H	-Br	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	225.0 (分解)	氫氨酸鹽
200	-H	-H	-H	-Br	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	214.5-220.5 (分解)	氫氨酸鹽

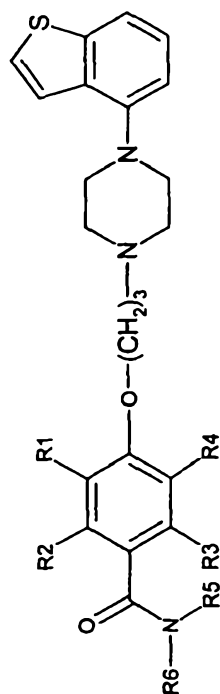
(274)

[表38]



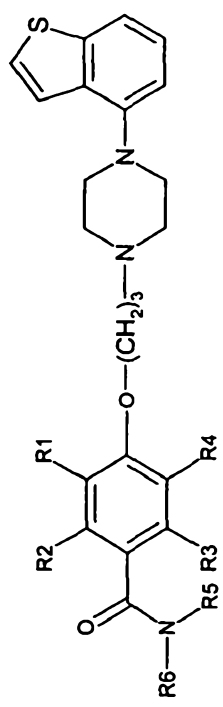
實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
201	-H	-H	-H	-Br	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	230.0-234.5	氫氨酸鹽
202	-CN	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	182.0-185.0	-
203	-CN	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (2-丙醇)	177.5-181.5	-
204	-H	-H	-H	-CN	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	213.5-214.0	氫氨酸鹽
205	-CN	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (2-丙醇)	162.5-166.0	-
206	-H	-H	-H	-CN	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	217.0-222.0	氫氨酸鹽
207	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	133.5-135.5	-
208	-H	-Cl	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	137.0-139.0	-
209	-H	-H	-Cl	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	236.0 (分解)	氫氨酸鹽
210	-H	-H	-Cl	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	223.0-224.0	氫氨酸鹽

[表39]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
211	-H	-H	-Cl	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	210.5-216.0	氫氨酸鹽
212	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	212.0-219.5	氫氨酸鹽
213	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (二氧甲烷異丙醚)	139.5-141.0	氫氨酸鹽
214	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	214.0-218.5	氫氨酸鹽
215	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	252.5 (分解)	氫氨酸鹽
216	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	216.0-218.5	氫氨酸鹽
217	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (2-丙醇)	173.5-178.5	-

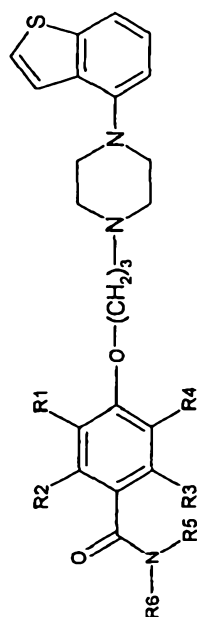
[表39-1]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	NMR	例
218	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.20-1.30 (3H, m), 2.10-2.20 (2H, m), 2.69 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70-2.75 (4H, m), 2.85 (6H, s), 3.20-3.25 (4H, m), 3.45-3.55 (2H, m), 4.10-4.20 (2H, m), 6.00 (1H, brs), 6.85-6.95 (2H, m), 7.25-7.30 (3H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.1 Hz).	-
219	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.20-1.30 (3H, m), 2.05-2.15 (2H, m), 2.25 (3H, s), 2.65 (2H, t, J=7.1 Hz), 2.70-2.80 (4H, m), 3.20-3.25 (4H, m), 3.40-3.55 (2H, m), 4.21 (2H, t, J=6.4 Hz), 6.22 (1H, brs), 6.91 (1H, d, J=7.7 Hz), 6.98 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.82 (1H, brs), 8.70 (1H, s).	-

(277)

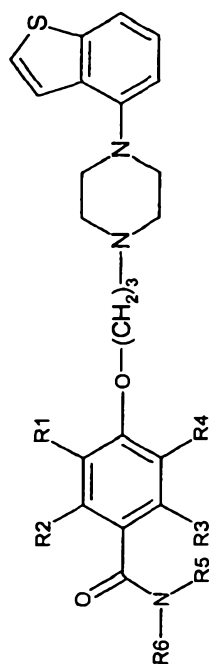
[表40]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
220	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (2-丙醇)	221.5-223.0	氫氨酸鹽
221	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	207.5-215.0	氫氨酸鹽
222	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	197.0-202.0	氫氨酸鹽
223	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	219.0-227.0	氫氨酸鹽
224	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	157.5-161.0	-
225	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	157.5-161.5	-
226	-H	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	217.5-219.5 (分解)	氫氨酸鹽
227	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	163.5-165.5	-
228	-NH <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	172.5-173.0	-
229	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	158.5-162.0	-
230	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	146.5-148.5	-



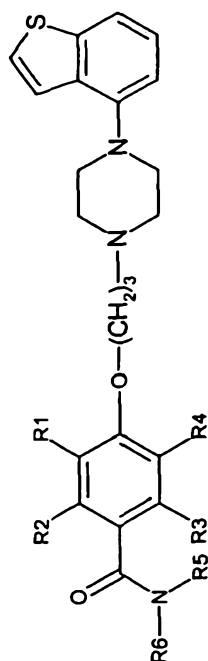
**[表41]**



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
231	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	144.5-150.0	-
232	-NH <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	124.0-125.5	-
233	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	143.0-145.0	-
234	-H	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	219.0-223.0	氫氨酸鹽
235	-NH <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	125.0-126.0	-
236	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	147.5-148.5	-
237	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	150.5-152.5	-
238	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	138.0-139.0	-
239	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	137.5-139.0	-
240	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	167.0-168.0	-

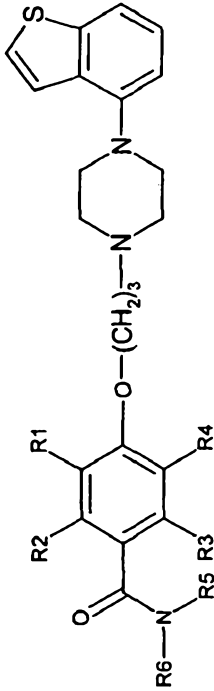
(279)

[表42]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
241	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	152.5-154.5	-
242	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	184.0-185.5	-
243	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	147.5-148.0	-
244	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	233.0-237.5 (分解)	氫氨酸鹽
245	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	145.5-147.5	-
246	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	186.5-188.0	氫氨酸鹽
247	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	(乙酸乙酯/異丙醚)	126.0-130.0	-
248	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	(乙酸乙酯/異丙醚)	137.5-140.0	-
249	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	180.5-186.0	氫氨酸鹽
250	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	186.5-192.0	氫氨酸鹽

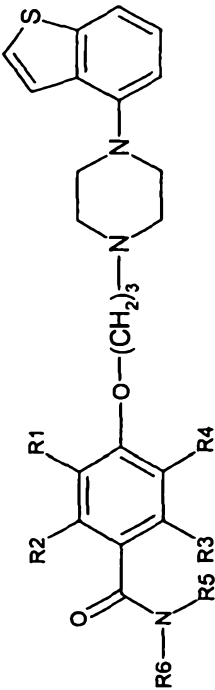
[表43]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(℃)	鹽
251	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	156.0-157.0	-
252	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/甲醇)	141.5-142.5	-
253	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	220.5-224.5	氫氨酸鹽
254	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	223.0-227.5	氫氨酸鹽

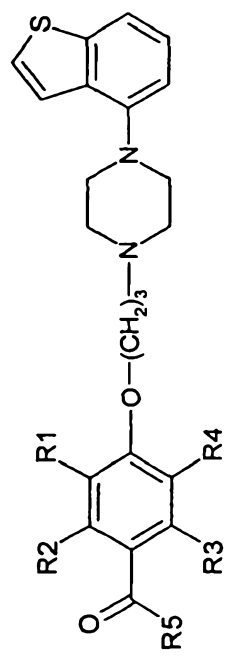
(281)

[表44]



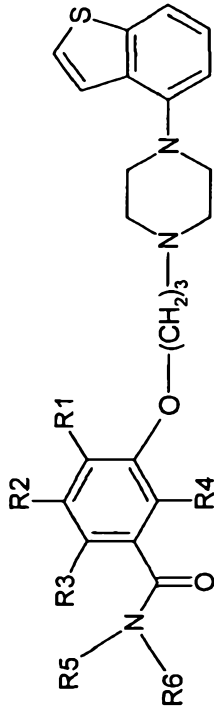
實例	R1 R2 R3 R4 R5 R6						NMR	鹽
255	-H	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	1H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.28 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.05-2.15 (2H, m), 2.68 (2H, t, J=7.0 Hz), 2.73 (4H, brs), 3.19 (4H, brs), 3.45-3.55 (2H, m), 4.29 (2H, t, J=6.2 Hz), 6.14 (1H, brs), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.18 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.04 (1H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 8.23 (1H, d, J=2.2 Hz).	-

[表45]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
256	-H	-H	-H	-H		白色粉末(乙酸乙酯)	234.5-238.0	氫氨酸鹽
257	-H	-H	-H	-H		白色粉末(乙酸乙酯)	244.0 (分解)	二氫氨酸鹽
258	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末(乙酸乙酯)	218.5-222.0	氫氨酸鹽
259	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末(乙酸乙酯)	255.0 (分解)	二氫氨酸鹽
260	-H	-H	-H	-F		白色粉末(乙酸乙酯)	224.5-227.5 (分解)	氫氨酸鹽
261	-H	-H	-H	-F		白色粉末(乙酸乙酯)	255.0 (分解)	二氫氨酸鹽
262	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>		白色粉末(乙酸乙酯)	236.0 (分解)	氫氨酸鹽
263	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>		白色粉末(乙酸乙酯)	255.5 (分解)	二氫氨酸鹽
264	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>		白色粉末(乙酸乙酯)	226.0-228.0 (分解)	氫氨酸鹽
265	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>		白色粉末(乙酸乙酯)	232.0 (分解)	二氫氨酸鹽

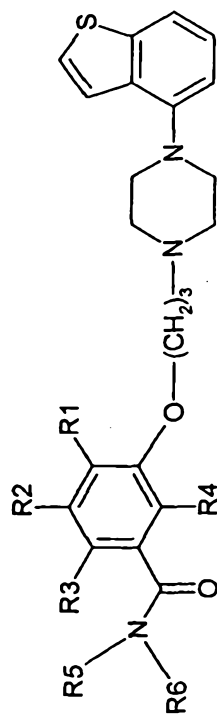
[表46]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
266	-H	-H	-H	-H	-H	-H	淡黃色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	158.0-160.0	-
267	-H	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	183.0-186.0	氫氨酸鹽
268	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	158.0-161.5	氫氨酸鹽
269	-H	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	168.5-173.0	氫氨酸鹽
270	-H	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	淡黃色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	187.5-189.0	氫氨酸鹽
271	-F	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	156.5-159.0	-
272	-F	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	214.5-218.0	氫氨酸鹽
273	-F	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	211.0-218.0	氫氨酸鹽
274	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	139.0-140.5	-
275	-Cl	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	218.5-222.5	氫氨酸鹽
276	-Cl	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	247.0 (分解)	氫氨酸鹽
277	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	129.5-130.0	-
278	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	148.5-151.0	-
279	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	133.0-134.5	-
280	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	155.5-160.0	-
281	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	163.5-165.0	氫氨酸鹽

(284)

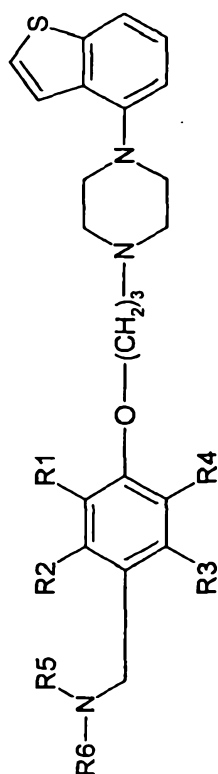
[表47]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
282	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	187.0-188.5	氫氨酸鹽
283	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	132.0-134.0	-
284	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	201.0-206.0	氫氨酸鹽
285	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	156.0-158.5	-

(285)

[表48]

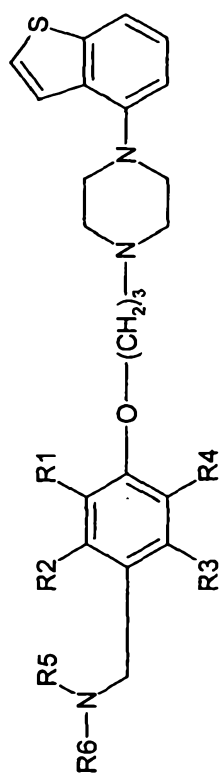


實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
286	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	228.0-241.0 (分解)	二氫氨酸鹽
287	-H	-H	-H	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	232.0-236.0 (分解)	二氫氨酸鹽
288	-H	-H	-H	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	210.0-222.0 (分解)	二氫氨酸鹽
289	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	235.5 (分解)	二氫氨酸鹽
290	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	257.5 (分解)	二氫氨酸鹽
291	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	232.0 (分解)	二氫氨酸鹽
292	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	238.5-240.5 (分解)	二氫氨酸鹽
293	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	209.5 (分解)	三氫氨酸鹽
294	-H	-H	-H	-H	-H	-H	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	245.5 (分解)	二氫氨酸鹽
295	-H	-H	-H	-H	-CHO	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	207.5-213.0	氫氨酸鹽
296	-H	-H	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	196.5-201.0	氫氨酸鹽
297	-H	-H	-H	-H	-COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	194.5-198.0	氫氨酸鹽
298	-H	-H	-H	-H	-COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	192.5-195.5	氫氨酸鹽
299	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	236.5 (分解)	二氫氨酸鹽
300	-H	-H	-H	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	191.0-193.5	二氫氨酸鹽
301	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/異丙醇)	101.0-103.0	三氫氨酸鹽
302	-H	-H	-H	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	207.5-214.5	二氫氨酸鹽
303	-H	-H	-H	-Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	259.0 (分解)	二氫氨酸鹽
304	-H	-H	-H	-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	247.0 (分解)	二氫氨酸鹽
305	-H	-H	-H	-F	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	237.0 (分解)	二氫氨酸鹽
306	-H	-H	-H	-F	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	196.0-199.0	氫氨酸鹽



(286)

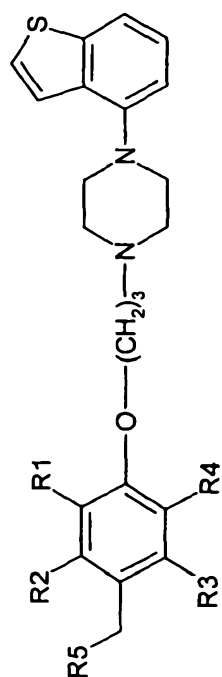
[表49]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
307	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	256.5 (分解)	二氫氨酸鹽
308	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	254.5 (分解)	二氫氨酸鹽
309	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	277.5 (分解)	二氫氨酸鹽
310	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	230.0-232.0 (分解)	氫氨酸鹽
311	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	239.5 (分解)	二氫氨酸鹽
312	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	206.0-211.5	氫氨酸鹽

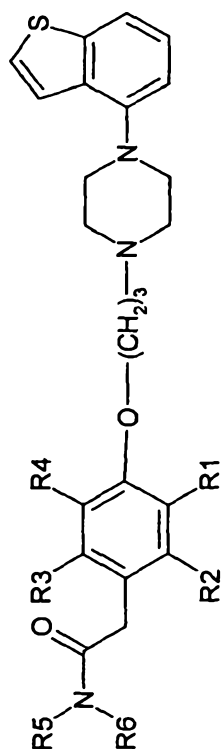
(287)

[表50]



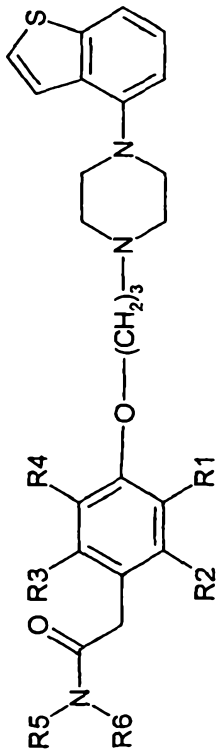
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
313	-H	-H	-H	-H		白色粉末(乙酸乙酯)	243.5 (分解)	二氫氯酸鹽
314	-H	-H	-H	-H		白色粉末(乙酸乙酯)	261.5 (分解)	二氫氯酸鹽
315	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末(乙酸乙酯)	249.0 (分解)	二氫氯酸鹽
316	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末(乙酸乙酯)	253.5 (分解)	三氫氯酸鹽
317	-H	-H	-H	-F		白色粉末(乙酸乙酯)	252.0 (分解)	二氫氯酸鹽
318	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>		白色粉末(乙酸乙酯)	242.0 (分解)	二氫氯酸鹽

[表51]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
319	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	179.0-183.5	氫氨酸鹽
320	-H	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯/水)	150.0-154.5	-
321	-H	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	198.0-207.0	氫氨酸鹽
322	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/異丙醚)	128.0-129.5	-
323	-H	-H	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/異丙醚)	112.5-113.5	-
324	-H	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯/異丙醚)	126.0-127.0	-
325	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(2-丙醇)	161.5-166.0	-
326	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	194.5-197.0	氫氨酸鹽
327	-H	-H	-H	-Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	197.5-201.0	氫氨酸鹽
328	-H	-H	-H	-Cl	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	227.5 (分解)	氫氨酸鹽
329	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	(乙酸乙酯)	204.0-206.0	氫氨酸鹽
330	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯/異丙醚)	129.0-130.0	-
331	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	176.0-178.5	氫氨酸鹽
332	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	188.5-192.0	氫氨酸鹽
333	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	178.0-184.0	氫氨酸鹽
334	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	187.5-192.0	氫氨酸鹽

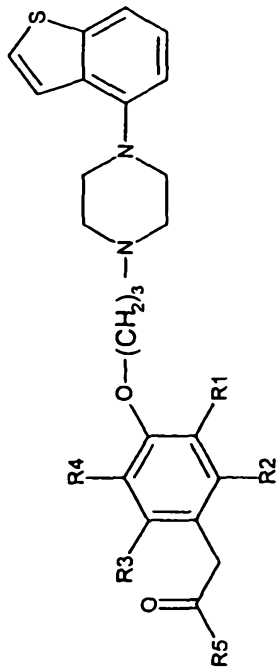
[表52]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
335	-F	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(2-丙醇)	146.5-150.0	-
336	-H	-H	-H	-F	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	191.0-193.0	氫氨酸鹽
337	-H	-H	-H	-F	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	192.5-197.0	氫氨酸鹽
338	-H	-H	-H	-F	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	216.0-220.5	氫氨酸鹽
339	-H	-H	-H	-F	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	淡黃色粉末(乙酸乙酯)	197.0-202.0	氫氨酸鹽
340	-H	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	149.5-150.5	-

(290)

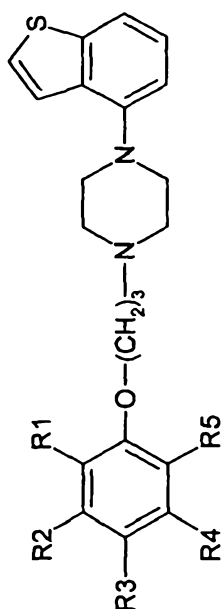
[表53]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(℃)	鹽
341	-H	-H	-H	-H		白色粉末(乙酸乙酯/ 異丙醚)	130.5-131.5	-
342	-H	-H	-H	-H		白色粉末(乙酸乙酯)	227.5 (分解)	氫氨酸鹽

(291)

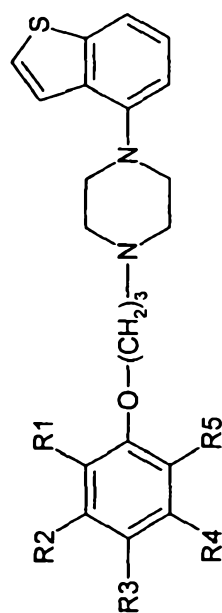
[表54]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
343	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末(乙醇)	283.0-285.0	氫氨酸鹽
344	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	淡黃色粉末(乙酸乙酯/異丙醚)	149.5-150.5	-
345	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	淡黃色粉末(乙醇/乙酸乙酯)	174-176	二氫氨酸鹽
346	-H	-H	-NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	225 (分解)	氫氨酸鹽
347	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末(乙酸乙酯)	196.0-202.0	氫氨酸鹽
348	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> )COCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末(乙醇)	246-247	氫氨酸鹽
349	-H	-H	-NH <sub>2</sub>	-H	-H	白色粉末(含水之乙醇)	266-271 (分解)	氫氨酸鹽
350	-H	-H	-NHCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末(乙醇)	264-266	二氫氨酸鹽
351	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	白色粉末(乙醇)	269-270	二氫氨酸鹽
352	-CH <sub>3</sub>	-H	-NH <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	淡黃色固狀物(乙酸乙酯)	155.0-158.0	-
353	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	206.0-210.0	氫氨酸鹽
354	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCHO	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	247.5-253.0 (分解)	氫氨酸鹽
355	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末(乙酸乙酯)	230.0-235.5	氫氨酸鹽

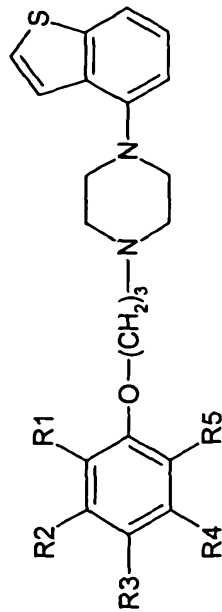
(292)

[表55]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
356	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/ 2-丙醇)	154.5-156.5	-
357	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (2-丙醇)	141.0-144.5	-
358	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙醇)	247.5-251.0 (分解)	氫氨酸鹽
359	-CH <sub>2</sub> OH	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙醇)	144.0-145.0	氫氨酸鹽

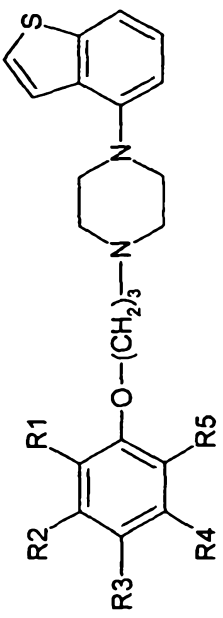
[表56]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
360	-H	-H	-NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.24 (6H, d, J = 6.5Hz), 2.2-2.4 (2H, m), 3.15-3.8 (12H, m), 4.15 (2H, t, J = 6Hz), 6.99 (1H, d, J = 7.5Hz), 7.11 (2H, d, J = 9Hz), 7.33 (1H, dd, J = 8, 8Hz), 7.4-7.55 (3H, m), 7.71 (1H, d, J = 8Hz), 7.78 (1H, d, J = 5.5Hz), 10.87 (3H, br).	三氫氟酸鹽
361	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.00-2.15 (2H, m), 2.60-2.70 (2H, m), 2.73 (4H, brs), 3.20 (4H, brs), 3.77 (3H, s), 3.88 (3H, s), 4.10 (2H, t, J=6.6 Hz), 6.52 (1H, brs), 6.74 (1H, dd, J=2.5, 8.6 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.19 (1H, brs), 7.28 (1H, dd, J=7.8 Hz), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=7.8 Hz).	-
362	-H	-H	-NHCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.91 (6H, s), 3.20-3.40 (6H, m), 3.55 (2H, d, J=12.4 Hz), 3.65 (2H, d, J=11.4 Hz), 4.05 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.86 (2H, d, J=9.0 Hz), 6.98 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.30-7.40 (3H, m), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 8.16 (1H, brs), 11.05 (1H, brs).	二氫氟酸鹽
363	-F	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.24 (2H, brs), 3.10-3.25 (2H, m), 3.30-3.50 (4H, m), 3.50-3.60 (2H, m), 3.66 (3H, s), 3.65-3.70 (2H, m), 4.13 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.98 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.10-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.40 (1H, d, J=13.3 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 9.69 (1H, brs), 10.56 (1H, brs).	氫氟酸鹽



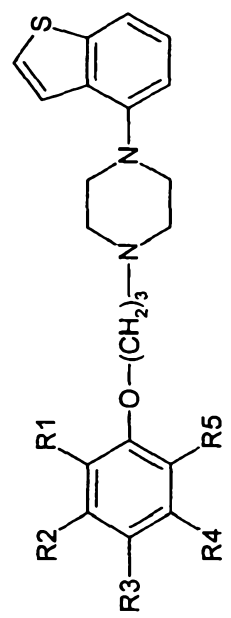
[表56-1]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
364	-H	-H	-NHCONH <sub>2</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.64 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70-2.75 (4H, m), 3.15-3.20 (4H, m), 4.03 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.83 (2H, brs), 6.83 (1H, brs), 6.85-6.95 (3H, m), 7.20 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	-
365	-H	-H	-NHCON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.06 (6H, t, J=7.0 Hz), 2.15-2.30 (2H, m), 3.20-3.45 (10H, m), 3.54 (2H, d, J=12 Hz), 3.64 (2H, d, J=12 Hz), 4.03 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.9 Hz), 6.97 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.25-7.40 (3H, m), 7.49 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.6 Hz), 8.01 (1H, s), 10.95 (1H, s).	二氫氯酸鹽
366	-H	-H		-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.05-2.10 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.76 (4H, brs), 3.22 (4H, brs), 4.11 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.91 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.01 (2H, d, J=8.9 Hz), 7.20 (2H, d, J=9.6 Hz), 7.25-7.35 (3H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, s).	-
367	-H	-H		-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.05-2.15 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 4.12 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.91 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.00-7.05 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.50-7.60 (3H, m), 8.08 (1H, s), 8.45 (1H, s).	-

(295)

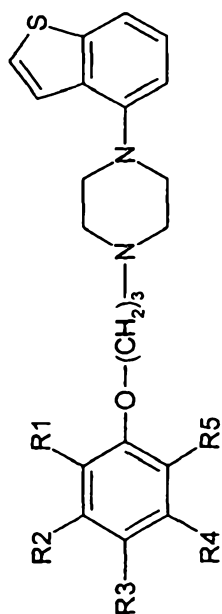
[表57]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
368	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	224.0-232.0 (分解)	二氫氨酸鹽
369	-H	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	178.0-181.0 (分解)	氫氨酸鹽
370	-H	-H	-CN	-H	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	105.5-107.0	-
371	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	263.0 (分解)	氫氨酸鹽
372	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	242.0 (分解)	氫氨酸鹽
373	-H	-H	-Br	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	119.0-120.0	-
374	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-H	白色粉末 (水)	121.0-124.5	-
375	-Cl	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	淡黃色粉末 (乙醇/異丙醚)	122.0-123.5	-
376	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	213.5-221.5 (分解)	氫氨酸鹽
377	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-F	白色粉末 (乙酸乙酯)	231.5-233.5	氫氨酸鹽

(296)

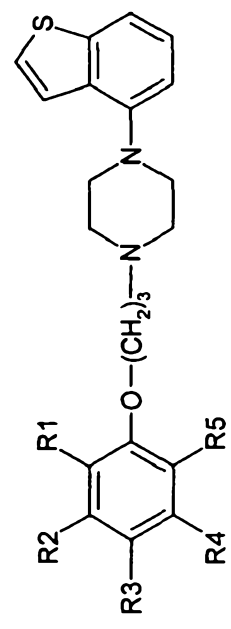
[表58]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
378	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-Cl	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	273.0 (分解)	氫氨酸鹽
379	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	-H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	217.0-222.0	氫氨酸鹽
380	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-F	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	267.0 (分解)	氫氨酸鹽
381	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	258.0 (分解)	二氫氨酸鹽
382	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	236.5 (分解)	二氫氨酸鹽
383	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )COCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	215.0-217.0	氫氨酸鹽
384	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	211.0-217.0	氫氨酸鹽
385	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	210.5-212.0	氫氨酸鹽
386	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	196.0-202.0 (分解)	二氫氨酸鹽
387	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	230.0 (分解)	二氫氨酸鹽

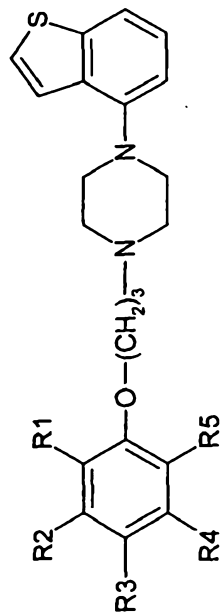
(297)

[表59]



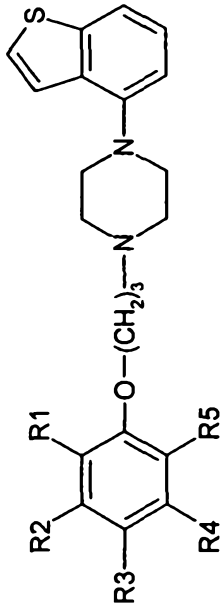
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
388	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	223.0 (分解)	二氫氯酸鹽
389	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-Cl	白色粉末 (乙酸乙酯)	225.0-228.5	氫氯酸鹽
390	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	-H	-Cl	白色粉末 (氫氯酸/乙酸)	208.0-209.5	氫氯酸鹽
391	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	205.5-213.5	氫氯酸鹽
392	-CH <sub>3</sub>	-H	-CN	-H	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	105.5-106.0	-
393	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (氫氯酸/乙酸)	198.5-201.0	氫氯酸鹽
394	-H	-H	-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙醇)	199.0-203.0	-
395	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (氫氯酸/乙酸)	280.0 (分解)	氫氯酸鹽
396	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-F	白色粉末 (乙酸乙酯)	220.5-224.0	氫氯酸鹽
397	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	-H	-F	白色粉末 (氫氯酸/乙酸)	181.5-184.5	氫氯酸鹽

[表60]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
398	-H	-H	-CN	-OCH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	238.0 (分解)	氫氨酸鹽
399	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-Br	白色粉末 (乙酸乙酯)	237.5-242.5 (分解)	氫氨酸鹽
400	-H	-CN	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	217.5-221.0 (分解)	氫氨酸鹽
401	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-Br	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	271.0 (分解)	氫氨酸鹽
402	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	242.5-244.5	氫氨酸鹽
403	-H	-H	-H	-H	-CN	白色粉末 (乙酸乙酯)	221.5-226.0	氫氨酸鹽
404	-CN	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	128.5-130.0	-
405	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-CN	白色粉末 (二氧甲烷/水)	271.0 (分解)	氫氨酸鹽
406	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	220.0-227.5	氫氨酸鹽
407	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	224.5-232.0	氫氨酸鹽

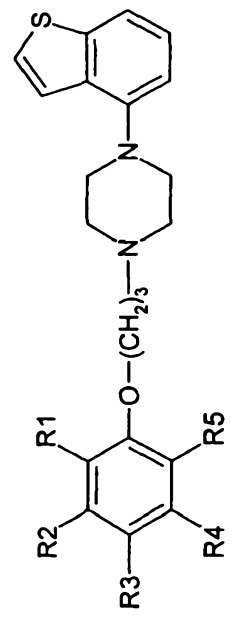
[表61]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
408	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-Cl	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	216.5-219.0	氫氯酸鹽
409	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-Cl	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	259.0 (分解)	氫氯酸鹽
410	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CHO	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/2-丙醇)	118.0-119.5	-
411	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (水)	240.0 (分解)	氫氯酸鹽
412	-H	-H	-CN	-CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	230.0-237.0	氫氯酸鹽
413	-NO <sub>2</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	113.0-114.0	-
414	-H	-H	-CHO	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	102.5-105.5	-
415	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-NO <sub>2</sub>	白色粉末 (氫氯酸/乙酸)	259.0 (分解)	二氫氯酸鹽
416	-H	-H	-CH=CHCO <sub>2</sub> H	-H	-H	白色粉末 (氫氯酸/水)	265.0 (分解)	氫氯酸鹽
417	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	211.5-221.0	氫氯酸鹽

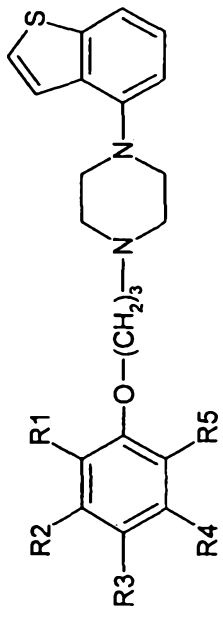
(300)

[表62]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
418	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-CF <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	269.0 (分解)	氫氨酸鹽
419	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	206.0-208.0	氫氨酸鹽
420	-H	-H	-CH=CHCONH <sub>2</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	210.5-215.0	-
421	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	-H	-H	-H	淡棕色粉末 (乙酸乙酯)	255.0 (分解)	氫氨酸鹽
422	-H	-H	-CH=CHCONHCH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	165.5-169.0	-
423	-H	-H	-CH=CHCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	130.5-131.5	-
424	-H	-H	-CH=CHCONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	158.0-159.0	-
425	-H	-H	-CH=CHCONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	177.5-180.0	-
426	-H	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	235.0-237.5	氫氨酸鹽
427	-F	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	218.5-224.0	氫氨酸鹽

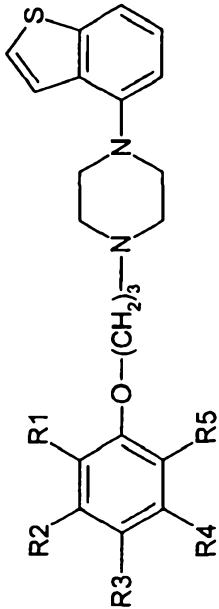
[表63]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
428	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	-H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	240.0 (分解)	氫氨酸鹽
429	-F	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	260.0 (分解)	氫氨酸鹽
430	-Cl	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	241.0-245.0	氫氨酸鹽
431	-Cl	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	268.0 (分解)	氫氨酸鹽
432	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	238.0-242.0 (分解)	氫氨酸鹽
433	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (異丙醚)	106.0-108.0	-
434	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	256.5 (分解)	氫氨酸鹽
435	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (水)	252.5 (分解)	氫氨酸鹽
436	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	225.0-234.0	氫氨酸鹽
437	-H	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	222.0-226.5	氫氨酸鹽

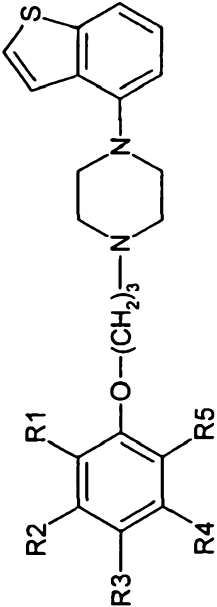


[表64]



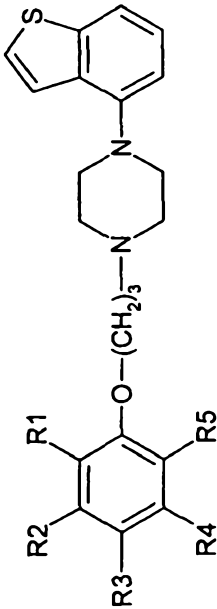
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(℃)	鹽
438	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	208.0-213.5	氫氨酸鹽
439	-H	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	-H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	257.5 (分解)	氫氨酸鹽
440	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	-H	-H	淡黃色粉末 (95% 2-丙醇)	167.5-170.0	-
441	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	-H	-H	淡黃色粉末 (95% 2-丙醇)	128.0-132.0	-
442	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	250.0 (分解)	氫氨酸鹽
443	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	白色粉末 (95% 2-丙醇)	130.5-132.0	氫氨酸鹽
444	-H	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/庚丙醚)	132.5-134.0	氫氨酸鹽
445	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	173.5-175.0	氫氨酸鹽
446	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	白色粉末 (水)	154.0-155.5	氫氨酸鹽
447	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	239.0-242.0 (分解)	氫氨酸鹽

[表65]



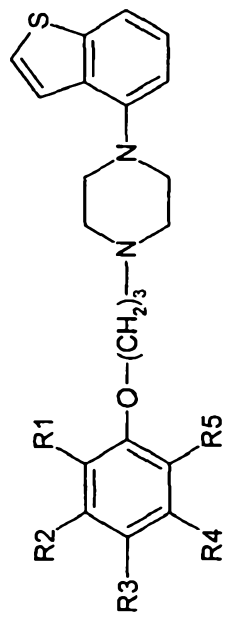
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(℃)	鹽
448	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (水)	191.0-196.0	-
449	-H	-H	-CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/四氫呋喃)	193.0-196.5	二氫氯酸鹽
450	-OCH <sub>3</sub>	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	243.0 (分解)	氫氯酸鹽
451	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (水)	97.0-102.0	-
452	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (水)	145.5-150.5	-

[表66]

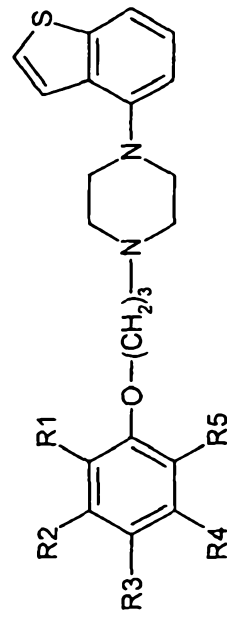


實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
453	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	112.5-113.5	-
454	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	112.0-113.0	-

[表67]

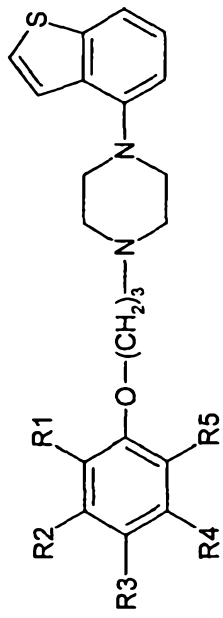


實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
455	-H	-H	-F	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.15-2.30 (2H, m), 3.10-3.25 (2H, m), 3.25-3.60 (4H, m), 3.55-3.75 (4H, m), 4.10 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.90-7.10 (4H, m), 7.25-7.40 (3H, m), 7.51 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.72 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.12 (1H, brs).	氫氨酸鹽
456	-H	-H	-H	-H	-H		氫氨酸鹽



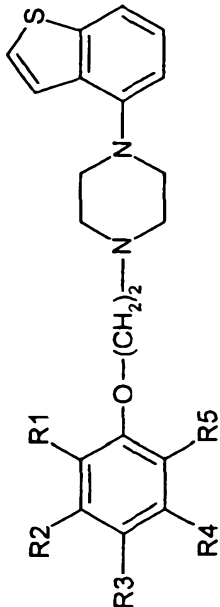
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
457	-H	-H	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	無色針形結晶 (乙醇)	243.7 - 244.8	-

[表67-1]



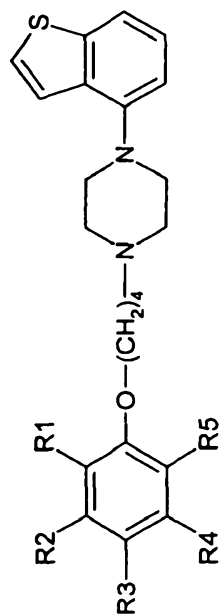
實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
458	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm : 2.20-2.40 (2H, m), 2.53 (3H, s), 3.20-3.70 (10H, m), 3.83 (3H, s), 4.19 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.96 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.10 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.31 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.45-7.50 (2H, m), 7.62 (1H, dd, J=2.0, 8.4 Hz), 7.69 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.5 Hz), 11.14 (1H, brs).	氫氨酸鹽
459	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.95-2.10 (6H, m), 2.60-2.75 (7H, m), 2.96 (2H, t, J=11.3 Hz), 3.21 (4H, brs), 3.55 (2H, d, J=12.4 Hz), 4.06 (2H, t, J=6.2 Hz), 6.80-6.95 (3H, m), 7.17 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.35 (1H, m), 7.40 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.43 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.57 (1H, d, J=8.1 Hz).	氫氨酸鹽
460	-H	-H	HN	-H	-H		-
461	-H	-H	O	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.55-1.65 (2H, m), 1.80-1.95 (2H, m), 2.00-2.10 (2H, m), 2.13 (3H, s), 2.55-2.75 (7H, m), 3.10-3.20 (6H, m), 3.93 (1H, d, J=13.7 Hz), 4.05 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.78 (1H, d, J=13.3 Hz), 6.85-6.95 (3H, m), 7.11 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.39 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.42 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	-
462	-H	-H	H <sub>3</sub> C-N	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.75-1.85 (4H, m), 2.00-2.10 (4H, m), 2.32 (3H, s), 2.35-2.45 (1H, m), 2.63 (2H, t, J=7.4 Hz), 2.73 (4H, brs), 2.96 (2H, d, J=11.5 Hz), 3.20 (4H, brs), 4.04 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.85-6.95 (3H, m), 7.14 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	-

[表68]



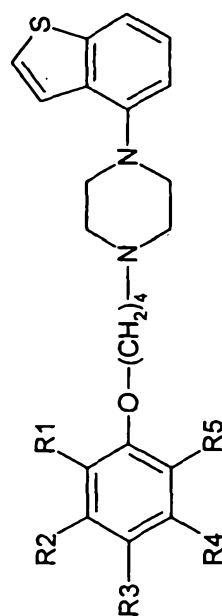
實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
463	-H	-H	-F	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 3.10–3.25 (2H, m), 3.40–3.75 (8H, m), 4.40–4.45 (2H, m), 6.98 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.00–7.25 (4H, m), 7.33 (1H, dd, J=7.9, 7.8 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.37 (1H, brs).	氫氯酸鹽
464	-H	-H	-H	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 3.10–3.35 (2H, m), 3.40–3.80 (8H, m), 4.48 (2H, t, J=4.8 Hz), 6.95–7.10 (4H, m), 7.25–7.40 (3H, m), 7.51 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.80–11.20 (1H, br).	氫氯酸鹽

[表69]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
465	-H	-H	-H	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.70-2.00 (4H, m), 3.10-3.40 (6H, m), 3.50-3.80 (4H, m), 4.03 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.90-7.00 (5H, m), 7.25-7.40 (3H, m), 7.50 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.59 (1H, brs)	氫氨酸鹽
466	-H	-H	-F	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.75-1.95 (4H, m), 3.10-3.50 (6H, m), 3.50-3.65 (4H, m), 4.00 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.90-7.00 (3H, m), 7.00-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J=7.9, 7.8 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.40-10.60 (1H, brs)	氫氨酸鹽
467	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.80-1.95 (4H, m), 2.52 (3H, s), 3.20-3.35 (6H, m), 3.50-3.65 (4H, m), 3.83 (3H, s), 4.00-4.15 (2H, m), 6.95 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.08 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.30 (1H, dd, J=7.8, 7.8 Hz), 7.40-7.50 (2H, m), 7.61 (1H, dd, J=1.9, 8.4 Hz), 7.69 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.75 (1H, d, J=5.6 Hz), 11.0 (1H, brs)	氫氨酸鹽

[表69-1]

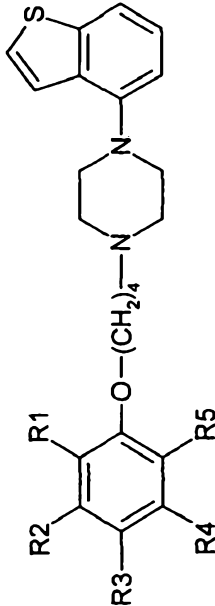


實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
468	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	241.0 (分解)	氫氨酸鹽
469	-H	-H	-H	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	203.0-209.5	氫氨酸鹽
470	-H	-H	-CN	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	220.0-223.0 (分解)	氫氨酸鹽
471	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-H	白色粉末 (氫氨酸/乙酸)	247.5-250.0 (分解)	氫氨酸鹽
472	-H	-CN	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	196.0-198.5	氫氨酸鹽
473	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	255.5-258.5	氫氨酸鹽
474	-CN	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	187.5-188.5	氫氨酸鹽
475	-H	-H	-H	-CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/2-丙醇)	137.0 (分解)	氫氨酸鹽
476	-H	-H	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/2-丙醇)	130.0-135.0	氫氨酸鹽
477	-H	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	白色粉末 (二氯甲烷/水)	192.0-197.0	氫氨酸鹽
478	-H	-CONH <sub>2</sub>	-H	-H	-H	淡黃色粉末 (2-丙醇)	148.0-151.0	-



(310)

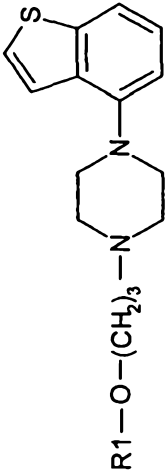
[表69-2]

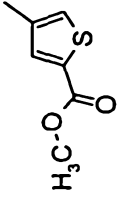
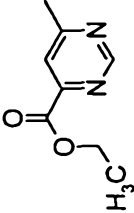
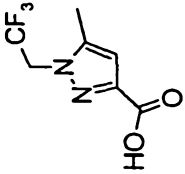


實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
479	-H	-H	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	234.0-239.0	氫氨酸鹽
480	-H	-H	-H	-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	135.0-141.5	氫氨酸鹽
481	-H	-H	-H	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	209.5-213.0	氫氨酸鹽

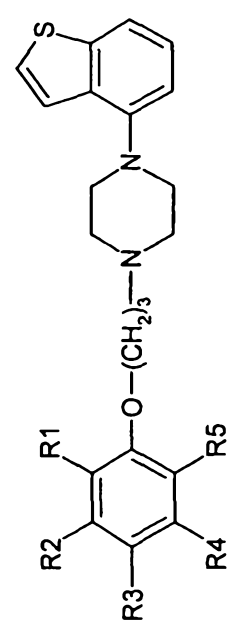
(311)

[表70]



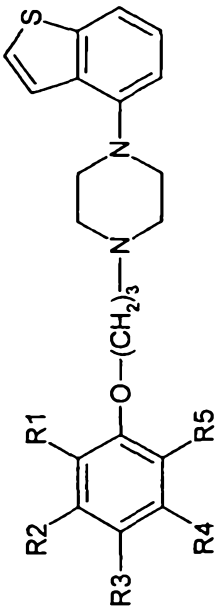
實例	R1	NMR	鹽
482		$^1H$ -NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.00–2.10 (2H, m), 2.63 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70–2.80 (4H, m), 3.15–3.25 (4H, m), 3.89 (3H, s), 4.00–4.10 (2H, m), 6.57 (1H, d, J=1.9 Hz), 6.91 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.20–7.35 (2H, m), 7.35–7.50 (3H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz).	—
483		$^1H$ -NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.44(3H, t, 7.0Hz), 2.01–2.12(2H, m), 2.63(2H, t, J=7.5Hz), 2.67–2.81(4H, m), 3.12–3.29(4H, m), 4.44–4.55(4H, m), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.27(1H, dd, J=5.5Hz, 7.5Hz), 7.40(2H, dd, J=5.5Hz, 8.0Hz), 7.44(1H, d, J=1.0Hz), 7.55(1H, d, J=8.0Hz), 8.90(1H, d, J=1.0Hz)	—
484		$^1H$ -NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm : 1.83–2.00 (2H, m), 2.59–2.70 (4H, m), 3.00–3.15(4H, m), 3.17(1H, d, J=4.5Hz), 3.31(1H, d, J=4.5Hz), 4.15 (2H, t, J=6.0 Hz), 4.77(2H, q, J=8.8Hz), 6.90 (1H, d, J=7.3Hz), 7.27 (1H, t, J=7.8Hz), 7.40(1H, d, J=5.5Hz), 7.61(1H, d, J=8.0Hz), 7.69(1H, d, J=5.5Hz).	—

[表71]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
485	-H	-H	$-(CH_2)_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.43(9H, s), 1.97-2.07 (2H, m), 2.64(2H, t, J=7.5Hz), 2.69-2.87(6H, m), 2.81(3H, s), 3.15-3.27(4H, m), 3.38 (2H, t, J=7.5Hz), 4.04 (2H, t, J = 6.3Hz), 6.83-6.92 (3H, m), 7.02-7.15(2H, m), 7.28(1H, t, J=7.8Hz), 7.37-7.43 (2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz)	-
486	-H	-H		-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.60-2.10 (6H, m), 2.30-2.40 (2H, m), 2.47 (3H, s), 2.60-2.70 (1H, m), 2.74 (4H, br), 2.85-3.00 (2H, m), 3.20 (4H, br), 3.90-4.10 (4H, m), 6.85-6.95 (2H, m), 7.07 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.45 (3H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.2 Hz).	-
487	-H	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm : 2.20-2.43 (2H, m), 3.17-3.77 (10H, m), 4.30 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.90-7.20 (2H, m), 7.30-7.40 (2H, m), 7.50-7.63 (1H, m), 7.70-7.79 (4H, m), 11.00 (1H, br), 12.71(1H, br).	-
488	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.60-2.80 (6H, m), 3.10-3.30 (4H, m), 3.89 (6H, s), 4.10 (2H, t, J = 6.4Hz), 6.90 (1H, dd, J = 0.5, 7.6Hz), 7.27 (1H, dd, J = 7.8, 7.8Hz), 7.35-7.45 (3H, m), 7.50-7.60 (2H, m).	-
489	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm : 1.90-2.05 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.55-3.30 (10H, m), 3.85 (3H, s), 4.03 (2H, t, J = 6.1Hz), 6.93 (1H, d, J = 7.6Hz), 7.29 (1H, dd, J = 7.8, 7.8Hz), 7.35-7.50 (3H, m), 7.65 (1H, d, J = 8.0Hz), 7.72 (1H, d, J = 5.5Hz), 11.50-13.50 (1H, br).	-

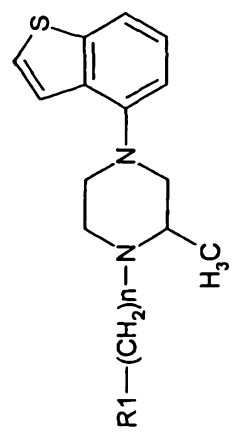
[表71-1]

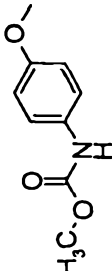
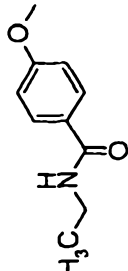
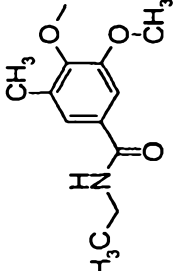
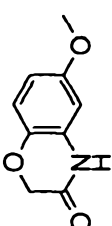


實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	例
490	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.98-2.09(2H, m), 2.70-2.83(6H, m), 3.13-3.30(4H, m), 3.45(2H, d, J=6.5Hz), 3.89(3H, s), 4.10(2H, t, J=6.4Hz), 5.04-5.11(2H, m), 5.91-6.09(1H, m), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.24-7.31(1H, m), 7.38-7.44(2H, m), 7.47-7.57(3H, m).	-
491	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 0.97(3H, t, J=7.3Hz), 1.52-1.74(2H, m), 1.93-2.13(2H, m), 2.57-2.85(6H, m), 3.07-3.30(4H, m), 3.89(6H, s), 4.09(2H, t, J=6.3Hz), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.24-7.31(1H, m), 7.38-7.45(3H, m), 7.52-7.57(2H, m).	-

(314)

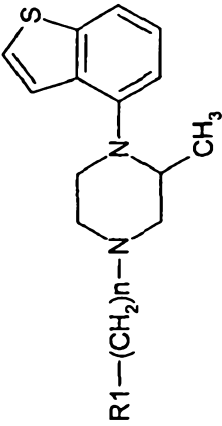
[表72]

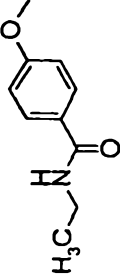
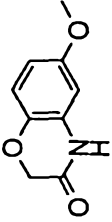


實例	R1	n	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(℃)	鹽
492		3	白色粉末 (乙酸乙酯)	129.0-138.5	氫氨酸鹽
493		3	白色粉末 (乙酸乙酯)	130.0-136.0	氫氨酸鹽
494		3	白色粉末		富馬酸鹽
495		4	白色粉末 (乙醇)	154-156	二氫氨酸鹽

(315)

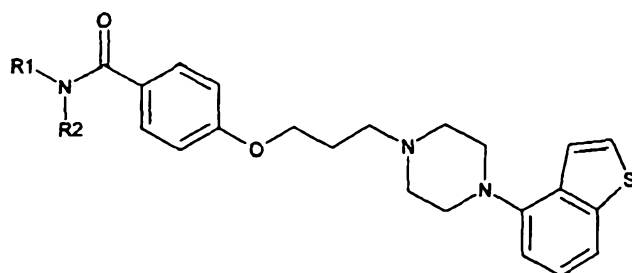
[表73]



實例	R1	n	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
496		3	白色粉末 (乙酸乙酯)	151.5-156.5	氫氨酸鹽
497		4	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	220-225	二氫氨酸鹽

(316)

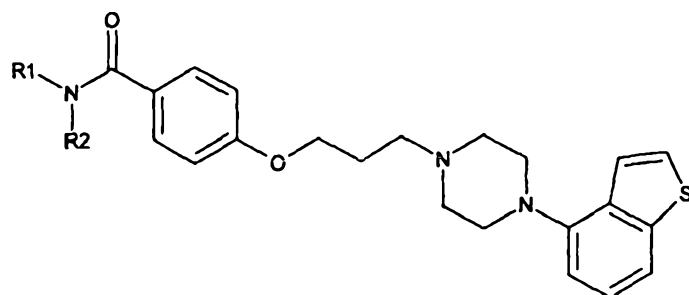
[表74]



實例	R1	R2	MS(M+1)
498	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	478
499	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	508
500	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	484
501	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	481
502	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	512
503	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	492
504	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	504
505	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	452
506	-H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	452
507	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	452
508	-H	-cyclo-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	492
509	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	506
510	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	466
511	-H	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	452
512	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	454
513	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	468
514	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	482
515	-H	-1-CH <sub>3</sub> -CYCLOHEXYL	492
516	-H	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	450
517	-H	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	492
518	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	468
519	-H	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	453
520	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	482
521	-H	-CH <sub>2</sub> CCH	434
522	-CH <sub>3</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	452
523	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	466
524	-H	-CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	480
525	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	467
526	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	464
527	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	478
528	-CH <sub>3</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	492
529	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	468
530	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	522
531	-H	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	464
532	-H	-3-PYRIDYL	473
533	-H	-4-PYRIDYL	473
534	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	516

(317)

[表75]

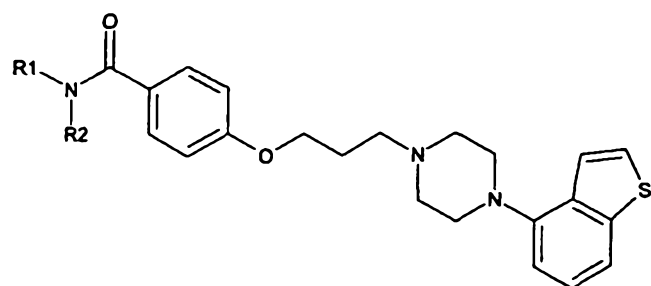


實例	R1	R2	MS (M+1)
535	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	435
536	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	468
537	-H	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	449
538	-H	-CH <sub>2</sub> CN	566
539	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	523
540	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	523
541	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	481
542	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	482
543	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	523
544	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>	481
545	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> OH	495
546	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(I-Pr) <sub>2</sub>	524
547	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	524
548	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	563
549	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	509
550	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	493
551	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	528
552	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	484
553	-H	-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	496
554	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	482
555	-H	-CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	442
556	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	467
557	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	470
558	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	435
559	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	468
560	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	449



(318)

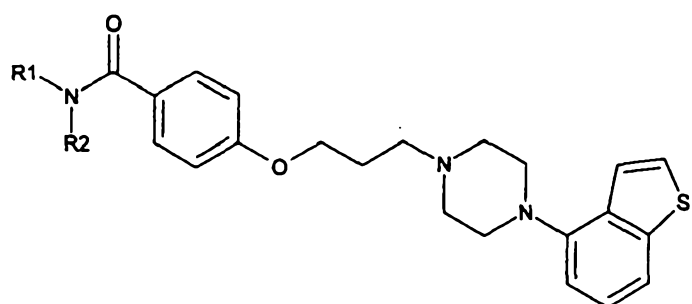
[表76]



實例	R1	R2	MS (M+1)
561	-H		510
562	-H		524
563	-H		495
564	-H		496
565	-H		482
566	-H		467
567	-H		466
568	-H		480
569	-H		568
570	-H		554

(319)

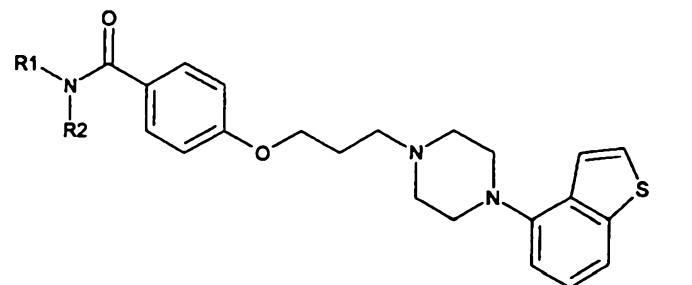
[表77]

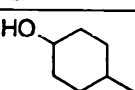
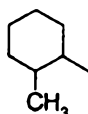
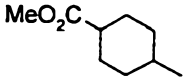
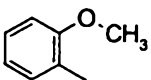
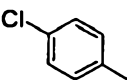
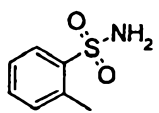
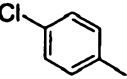
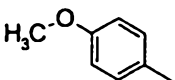
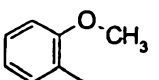
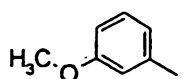


實例	R1	R2	MS (M+1)
571	-H		496
572	-H		482
573	-H		468
574	-H		470
575	-H		450
576	-H		509
577	-H		481
578	-H		450
579	-H		478

(320)

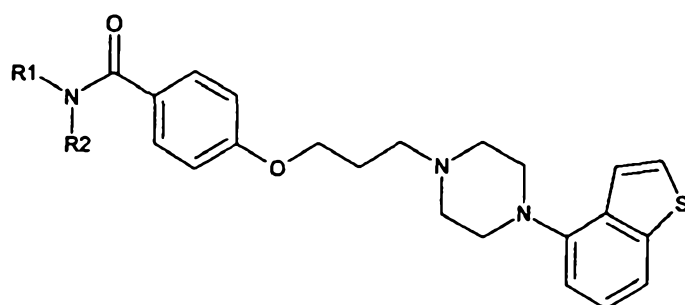
[表78]



實例	R1	R2	MS (M+1)
580	-H		494
581	-H		492
582	-H		536
583	-CH <sub>3</sub>		516
584	-CH <sub>3</sub>		520
585	-H		551
586	-H		506
587	-H		502
588	-H		502
589	-H		502

(321)

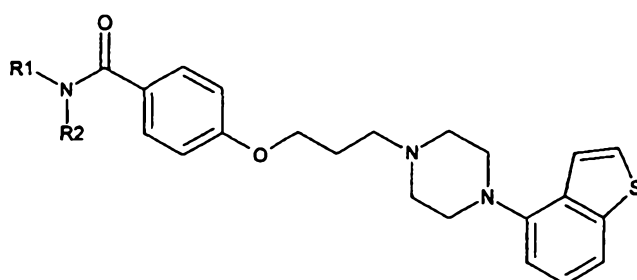
[表79]



實例	R1	R2	MS (M+1)
590	-H		506
591	-H		506
592	-H		540
593	-H		554
594	-H		554
595	-H		487
596	-H		533
597	-CH <sub>3</sub>		515
598	-H		487

(322)

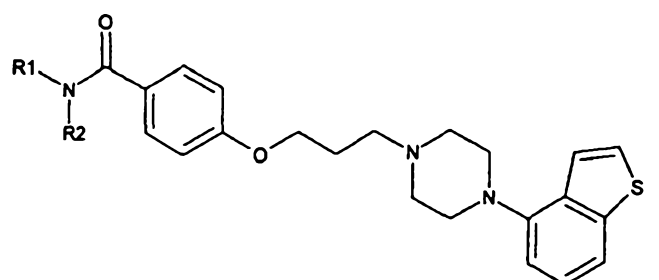
[表80]



實例	R1	R2	MS (M+1)
599	-H		487
600	-H		487
601	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		529
602	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		515
603	-H		501
604	-H		501
605	-H		501
606	-CH <sub>3</sub>		507
607	-CH <sub>3</sub>		535
608	-H		535

(323)

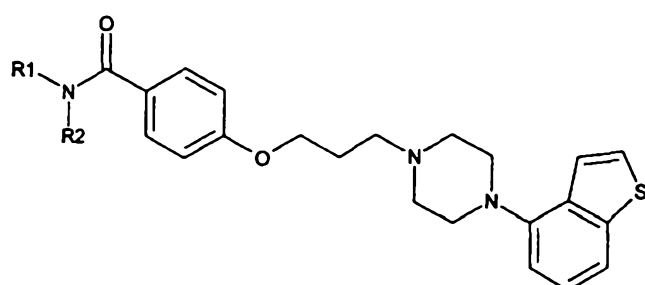
[表81]



實例	R1	R2	MS (M+1)
609	-H		551
610	-H		579
611	-H		479
612	-H		493
613	-H		507
614	-H		565
615	-H		465
616	-H		479
617	-H		493
618	-H		507

(324)

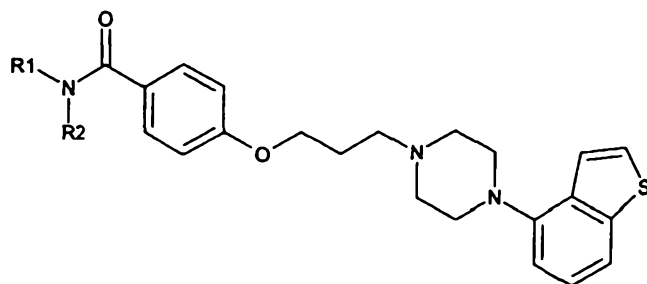
[表82]



實例	R1	R2	MS (M+1)
619	-H		507
620	-H		521
621	-H		507
622	-H		536
623	-H		507
624	-H		509
625	-H		523
626	-H		476
627	-H		490
628	-H		504

(325)

[表83]

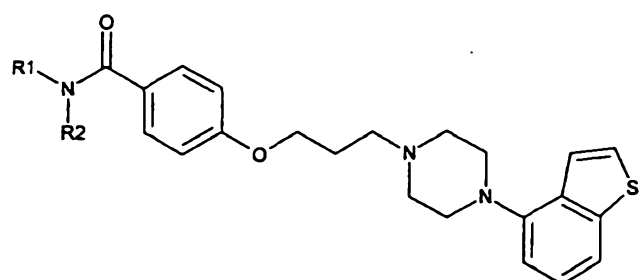


實例	R1	R2	MS (M+1)
629	-H		476
630	-H		480
631	-H		480
632	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		522
633	-H		494
634	-H		482
635	-H		496
636	-H		492
637	-H		506
638	-H		492



(326)

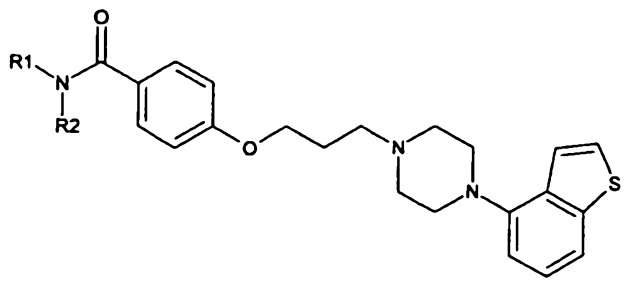
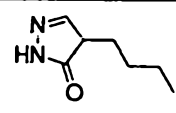
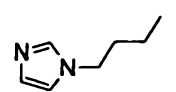
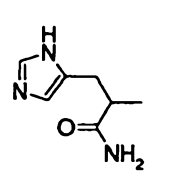
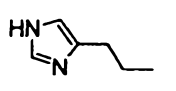
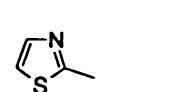
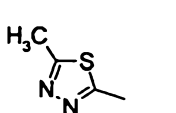
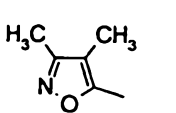
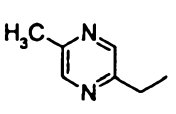
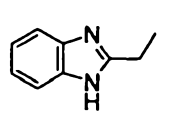
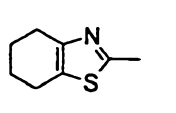
[表84]



實例	R1	R2	MS (M+1)
639	-H		506
640	-H		489
641	-H		503
642	-H		489
643	-H		490
644	-H		538
645	-H		528
646	-H		518
647	-H		518
648	-H		504

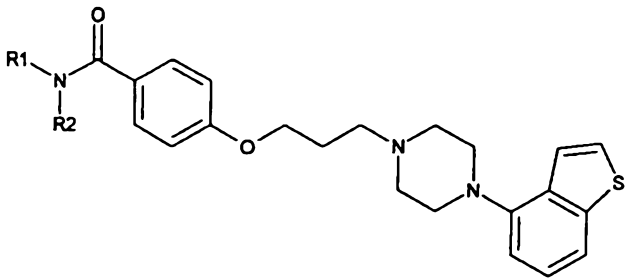
(327)

[表85]

			
實例	R1	R2	MS (M+1)
649	-H		520
650	-H		504
651	-H		533
652	-H		490
653	-H		479
654	-H		494
655	-H		491
656	-H		502
657	-H		526
658	-H		533

(328)

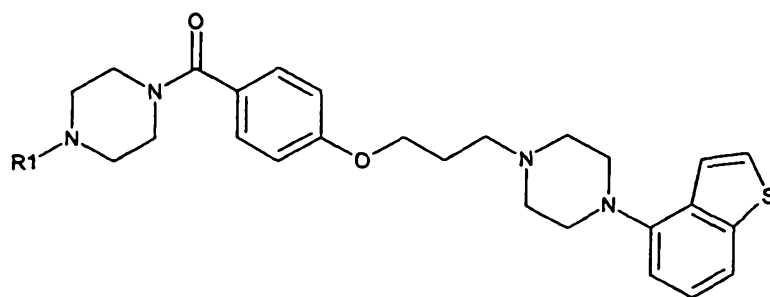
[表86]



實例	R1	R2	MS (M+1)
659	-H		512
660	-H		511
661	-H		539
662	-H		528
663	-H		523
664	-H		523
665	-H		555
666	-H		571
667	-H		555
668	-H		570

(329)

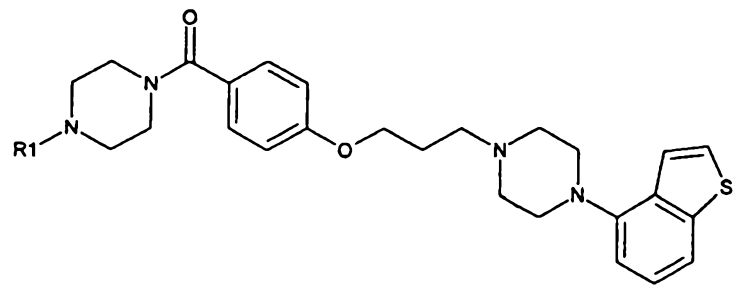
[表87]



實例	R1	MS (M+1)
669	-H	465
670	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	521
671	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	535
672	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	507
673	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	535
674	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	507
675	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	493
676	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	549
677	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	533
678	-cyclo-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	561
679	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	509
680	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	523
681	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	537
682	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	551
683	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	537
684	-CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	565
685	-COCH <sub>3</sub>	507
686	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	550
687	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	536

(330)

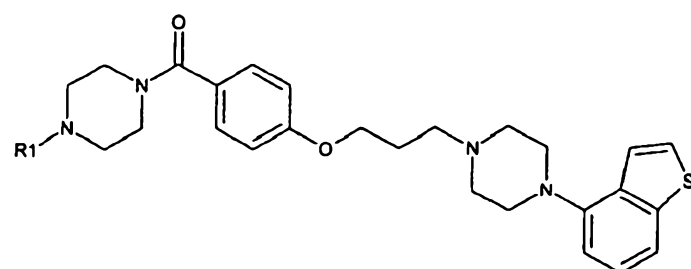
[表88]



實例	R1	MS (M+1)
688		576
689		578
690		562
691		551
692		565
693		549
694		576
695		576
696		576
697		556
698		556

(331)

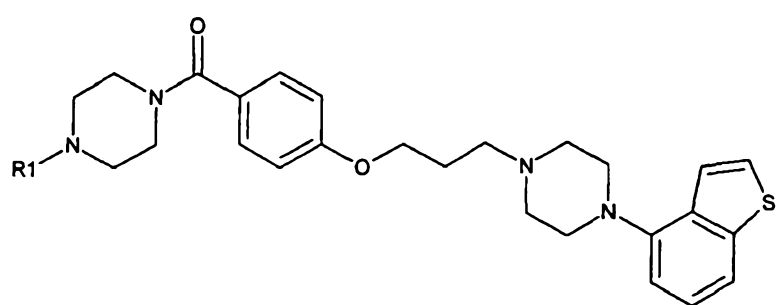
[表89]



實例	R1	MS (M+1)
699		556
700		570
701		570
702		632
703		559
704		545
705		561
706	-4-PYRIDYL	542
707	-3-PYRIDYL	542
708	-2-PYRIDYL	542
709		567
710		556
711		556

(332)

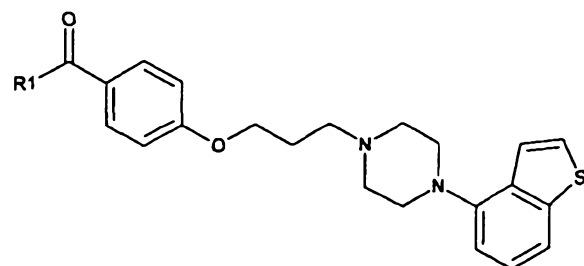
[表90]



實例	R1	MS (M+1)
712	 <chem>Cc1cc(C(F)(F)F)nc1</chem>	610
713	 <chem>Cc1cc2sc(C)cc2n1</chem>	598

(333)

[表91]

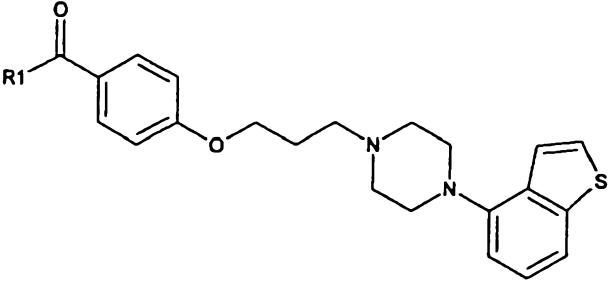



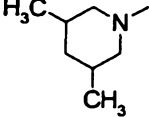
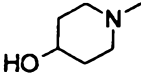
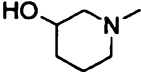
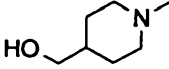
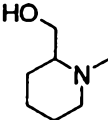
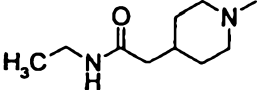
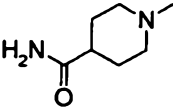
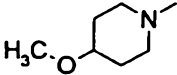
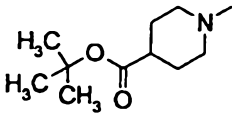
實例	R1	MS (M+1)
714		450
715		480
716		493
717		466
718		507
719		549
720		507
721		533
722		547
723		562
724		535



(334)

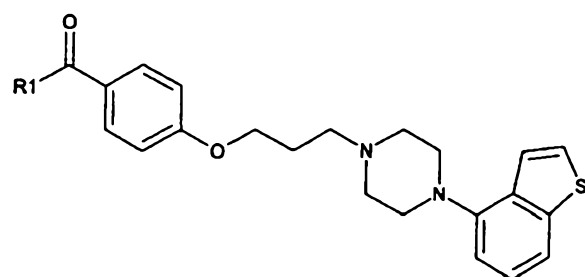
[表92]



實例	R1	MS (M+1)
725		464
726		492
727		480
728		480
729		494
730		494
731		549
732		507
733		494
734		564

(335)

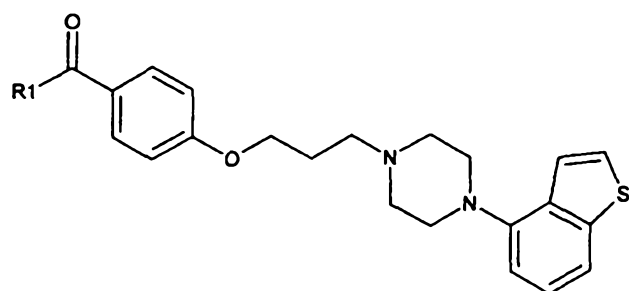
[表93]



實例	R1	MS (M+1)
735		536
736		536
737		536
738		521
739		579
740		547
741		576
742		562
743		549
744		576
745		522

(336)

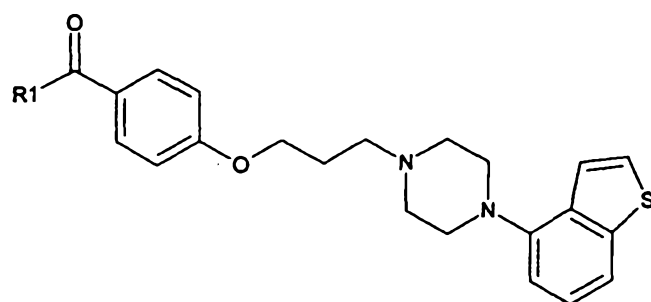
[表94]



實例	R1	MS (M+1)
746		478
747		482
748		494
749		563
750		479
751		493
752		556
753		476
754		468
755		504

(337)

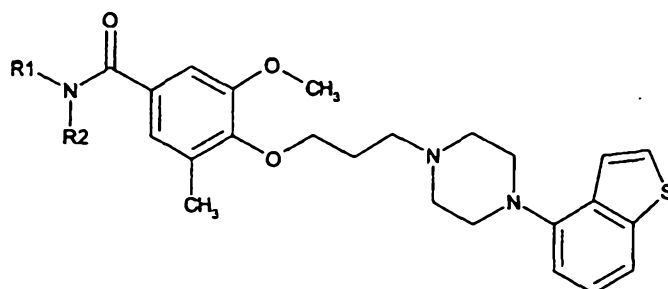
[表95]



實例	R1	MS (M+1)
756		600
757		498
758		512
759		551

(338)

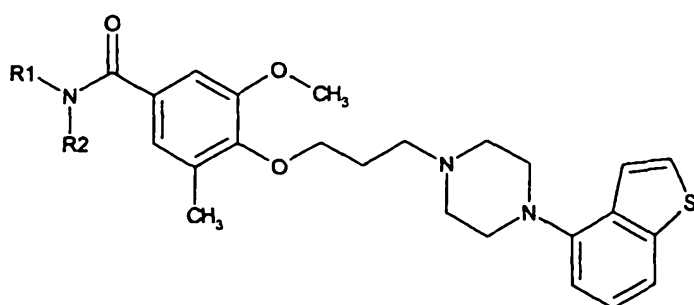
[表96]



實例	R1	R2	MS (M+1)
760	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	522
761	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	482
762	-H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	496
763	-H	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	480
764	-H	-cyclo-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	536
765	-H	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	530
766	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	482
767	-H	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	496
768	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	498
769	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	512
770	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	526
771	-H	-1-CH <sub>3</sub> -CYCLOHEXYL	536
772	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	560
773	-H	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	508
774	-H	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	494
775	-H	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	536
776	-H	-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	544
777	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	544
778	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	512
779	-H	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	497
780	-H	-CH <sub>2</sub> CCH	478
781	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	510
782	-H	-CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	524
783	-H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	510
784	-CH <sub>3</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	536
785	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	496
786	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	496
787	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	544
788	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	510
789	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	526
790	-CH <sub>3</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	496
791	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	508
792	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	522
793	-H	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	510

(339)

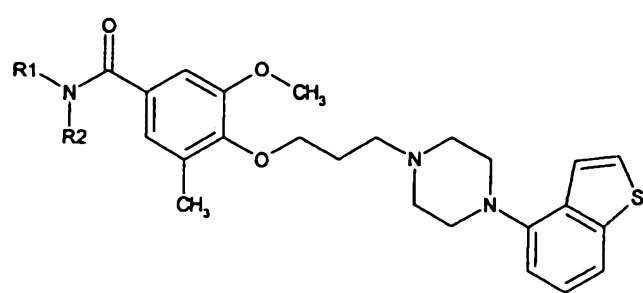
[表97]



實例	R1	R2	MS (M+1)
794	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	512
795	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	484
796	-H	-CH <sub>2</sub> CN	479
797	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-2-PYRIDYL	545
798	-H	-3-PYRIDYL	517
799	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	516
800	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>	525
801	-H	-CH <sub>2</sub> CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	524
802	-H	-CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	528
803	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	540
804	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	526
805	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	486
806	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	511
807	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	514
808	-H	-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	504

(340)

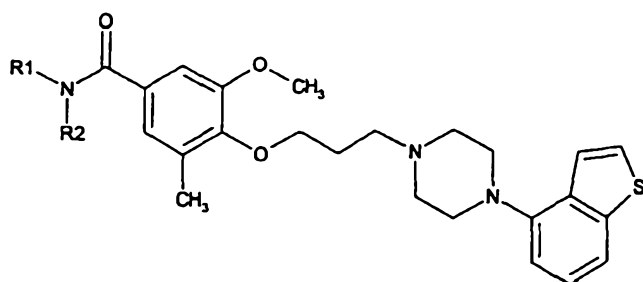
[表98]



實例	R1	R2	MS (M+1)
809	-H		554
810	-H		568
811	-H		539
812	-H		598
813	-H		540
814	-H		526
815	-H		511
816	-H		494
817	-H		540
818	-H		612
819	-C2H5		522

(341)

[表99]

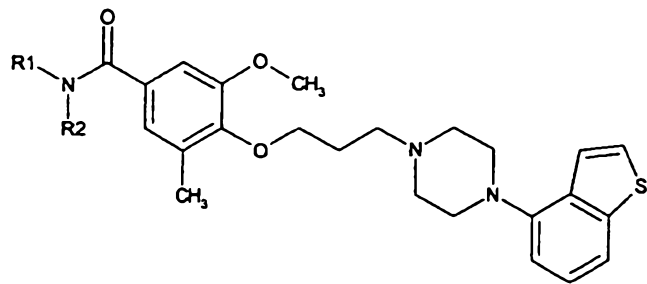


實例	R1	R2	MS (M+1)
820	-H		526
821	-H		512
822	-H		514
823	-H		496
824	-H		494
825	-H		522
826	-H		538
827	-H		536
828	-H		580
829	-CH <sub>3</sub>		560
830	-CH <sub>3</sub>		544



(342)

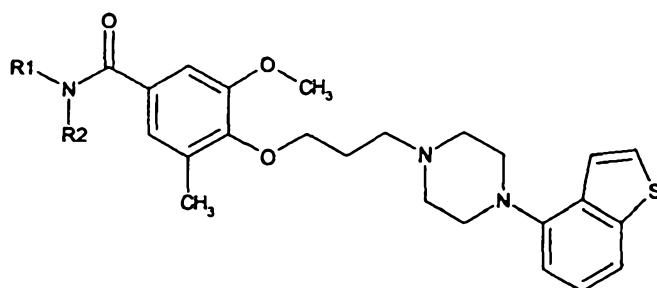
[表100]



實例	R1	R2	MS (M+1)
831	-CH <sub>3</sub>		564
832	-H		562
833	-H		562
834	-H		584
835	-H		600
836	-H		572
837	-H		550
838	-H		546
839	-H		546
840	-H		546
841	-H		550

(343)

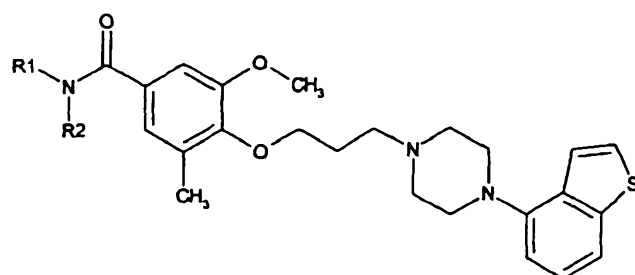
[表101]



實例	R1	R2	MS (M+1)
842	-H		550
843	-H		530
844	-H		558
845	-H		574
846	-H		576
847	-H		592
848	-H		581
849	-H		580
850	-H		576
851	-H		576

(344)

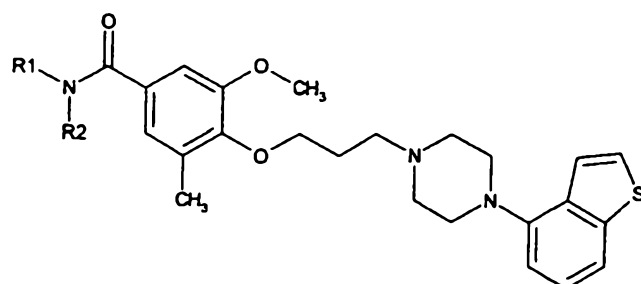
[表102]



實例	R1	R2	MS (M+1)
852	-H		560
853	-H		603
854	-H		576
855	-H		556
856	-H		558
857	-H		564
858	-H		564
859	-H		564
860	-H		572
861	-H		560
862	-H		560

(345)

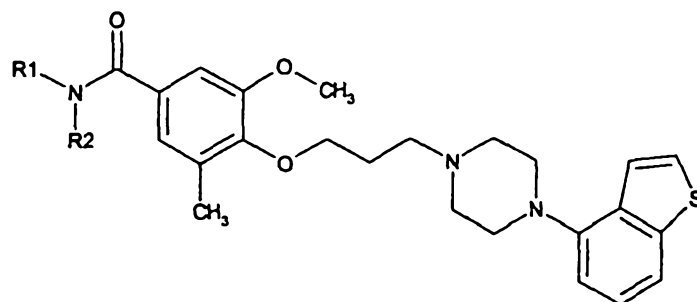
[表103]



實例	R1	R2	MS (M+1)
863	-H		574
864	-H		574
865	-H		578
866	-H		598
867	-H		614
868	-H		574
869	-H		548
870	-H		590
871	-H		544
872	-H		562
873	-H		602

(346)

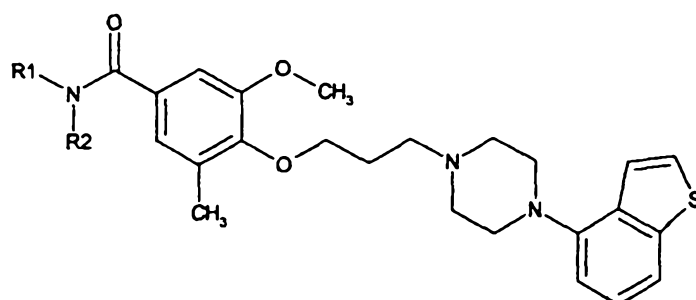
[表104]



實例	R1	R2	MS (M+1)
874	-H		588
875	-H		587
876	-H		560
877	-H		562
878	-H		574
879	-H		578
880	-H		558
881	-H		558
882	-H		578
883	-H		562

(347)

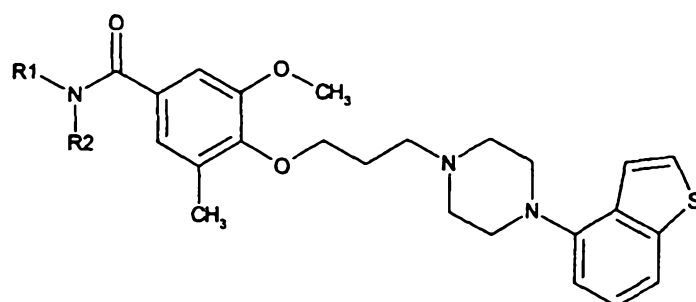
[表105]



實例	R1	R2	MS (M+1)
884	-H		590
885	-H		574
886	-H		630
887	-CH <sub>3</sub>		558
888	-CH <sub>3</sub>		588
889	-CH <sub>3</sub>		574
890	-H		598
891	-H		548
892	-H		598
893	-H		548

(348)

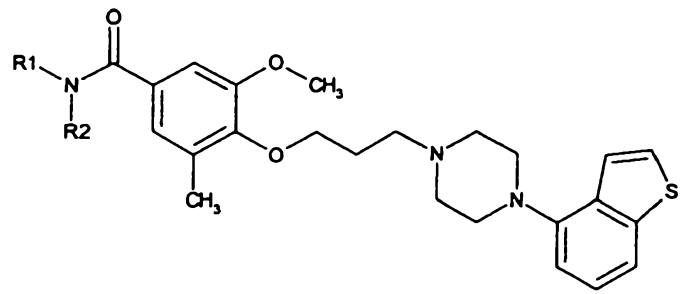
[表106]



實例	R1	R2	MS (M+1)
894	-H		566
895	-H		614
896	-H		562
897	-H		562
898	-H		562
899	-H		580
900	-H		612
901	-H		612
902	-H		612

(349)

[表107]

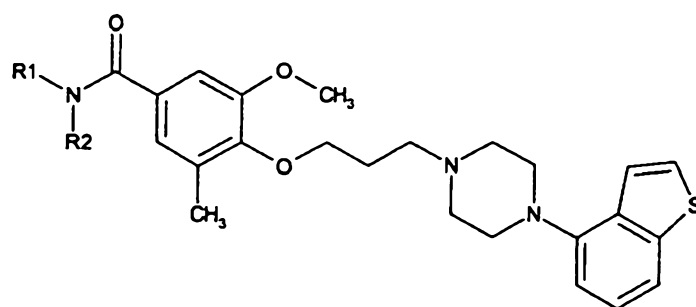


實例	R1	R2	MS (M+1)
903	-H		576
904	-H		576
905	-H		576
906	-H		594
907	-H		626
908	-H		626
909	-H		626
910	-H		566
911	-H		628



(350)

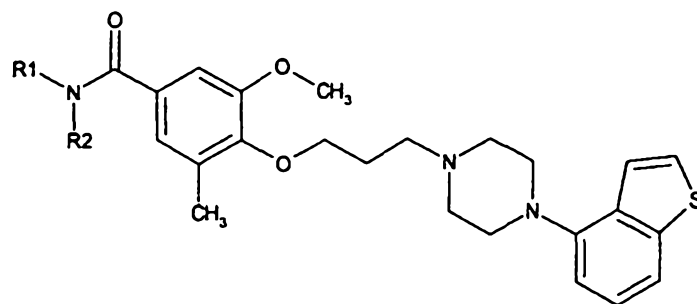
[表108]



實例	R1	R2	MS (M+1)
912	-H		602
913	-H		606
914	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		584
915	-H		566
916	-H		580
917	-H		531
918	-H		531
919	-H		531
920	-H		545
921	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		573

(351)

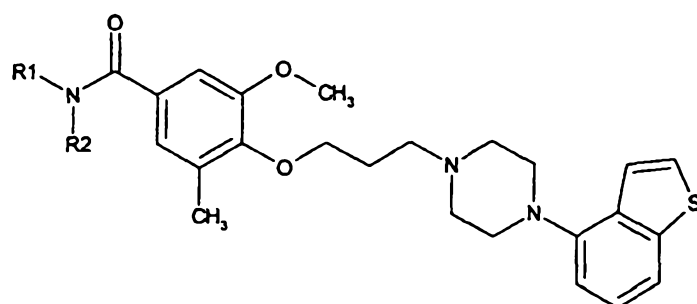
[表109]



實例	R1	R2	MS (M+1)
922	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		559
923	-H		545
924	-H		545
925	-H		579
926	-CH <sub>3</sub>		675
927	-H		565
928	-H		551
929	-H		520
930	-H		534
931	-H		548

(352)

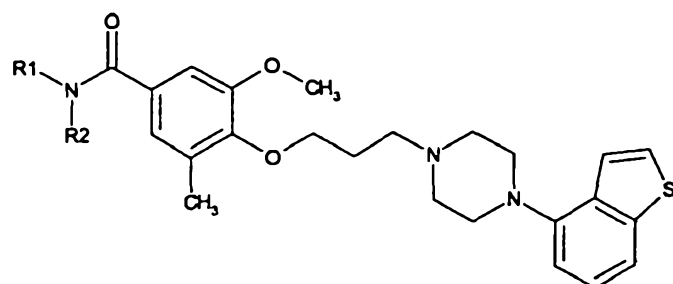
[表110]



實例	R1	R2	MS (M+1)
932	-H		520
933	-H		524
934	-H		524
935	-H		538
936	-H		526
937	-H		540
938	-H		536
939	-H		550
940	-H		536
941	-H		550

(353)

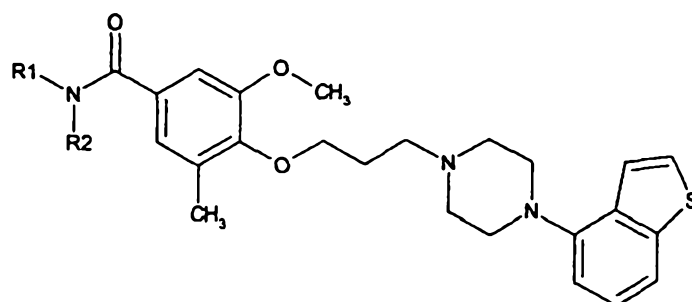
[表111]



實例	R1	R2	MS (M+1)
942	-H		533
943	-H		533
944	-H		562
945	-H		548
946	-H		548
947	-H		577
948	-H		592
949	-H		534
950	-H		537
951	-H		546
952	-H		556

(354)

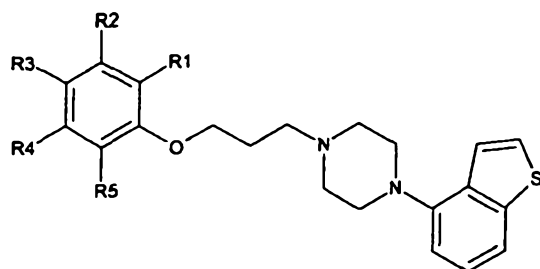
[表112]





實例	R1	R2	MS (M+1)
953	-H		583
954	-H		598
955	-H		570
956	-H		572
957	-H		599
958	-H		615
959	-H		598

(355)

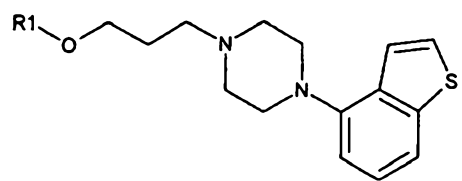
[表113]

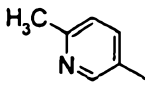
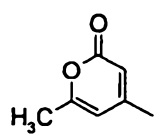
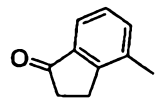
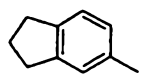
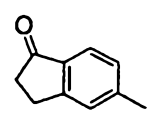
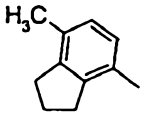
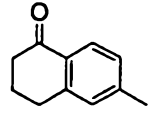
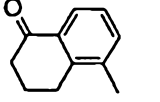
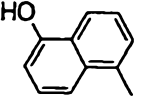
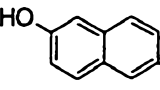
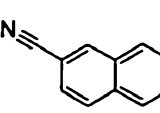


實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS (M+1)
960	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	410
961	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	410
962	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	383
963	-H	-H	-Cl	-H	-H	387
964	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	367
965	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	421
966	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	437
967	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	399
968	-H	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	429
969	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	459
970	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	398
971	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-H	395
972	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	413
973	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	413
974	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	413
975	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	367
976	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	381
977	-F	-H	-H	-H	-H	371
978	-H	-F	-H	-H	-H	371
979	-H	-H	-F	-H	-H	371
980	-F	-H	-F	-H	-H	389
981	-H	-F	-H	-H	-F	389
982	-F	-H	-H	-H	-F	389
983	-F	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	385
984	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	425
985	-CH <sub>3</sub>	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-H	409
986	-H	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	445
987		-H	-H	-H	-H	420
988	-H	-H		-H	-H	419

(356)

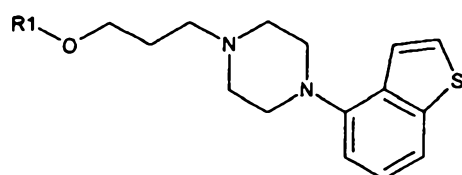
[表114]



實例	R1	MS (M+1)
989	-3-PYRIDYL	354
990		368
991		385
992		407
993		393
994		407
995		407
996		421
997		421
998		419
999		419
1000		428

(357)

[表115]

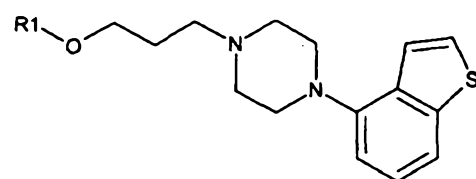


實例	R1	MS (M+1)
1001		433
1002		433
1003		437
1004		409
1005		423
1006		409
1007		421
1008		435
1009		451
1010		427
1011		394



(358)

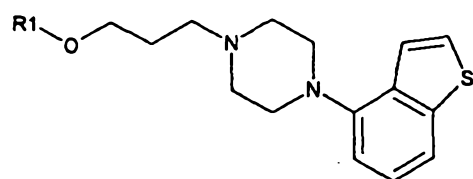
[表116]



實例	R1	MS (M+1)
1012		395
1013		450
1014		436
1015		410
1016		424
1017		424
1018	-2-苯並噻唑基	410
1019		438
1020		440
1021		451
1022		465

(359)

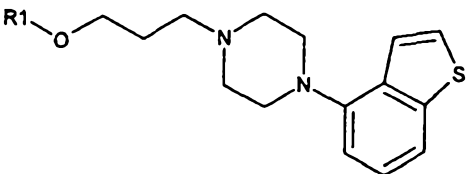
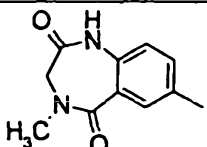
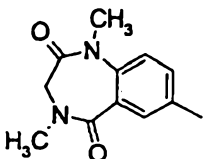
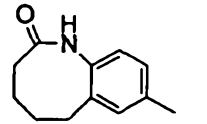
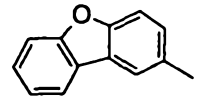
[表117]



實例	R1	MS (M+1)
1023		465
1024		436
1025		450
1026		436
1027		438
1028		452
1029		438
1030		438
1031		479
1032		451

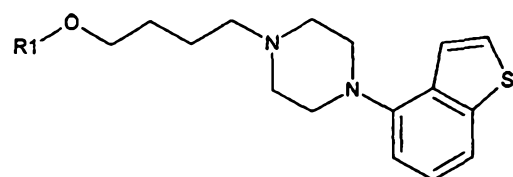
(360)

[表118]

		
實例	R1	MS (M+1)
1033		465
1034		479
1035		450
1036		443

(361)

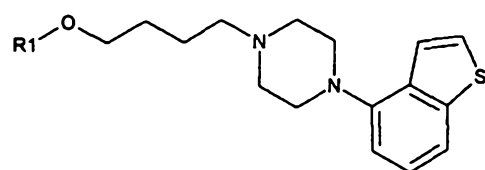
[表119]



實例	R1	MS (M+1)
1037		464
1038		450
1039		424
1040		438
1041		438
1042		452
1043		454
1044		479
1045		465

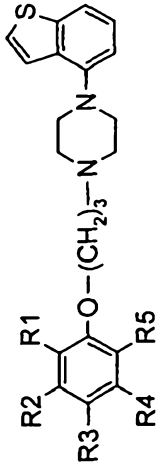
(362)

[表120]



實例	R1	MS (M+1)
1046		479
1047		450
1048		464
1049		450
1050		466
1051		465
1052		493
1053		479
1054		493
1055		464

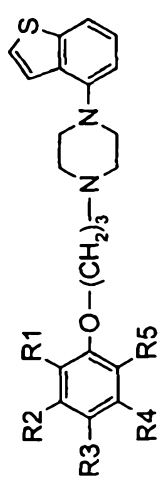
[表121]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1056	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	235.5-237.5	氫氨酸鹽
1057	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-OH	白色粉末 (乙酸乙酯)	246.5 (分解)	氫氨酸鹽
1058	-CH <sub>3</sub>	-H	-Br	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	265.0 (分解)	氫氨酸鹽
1059	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCOCH <sub>2</sub> NHCO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	140.5-142.5	-
1060	-CH <sub>3</sub>	-H	-NHCOCH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (甲醇/水)	268.0 (分解)	二氫氨酸鹽
1061	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCOCH <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	167.5-170.5	-
1062	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCOCH <sub>2</sub> NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	157.0-159.5	-
1063	-CH <sub>3</sub>	-H	-NHCOCH <sub>2</sub> NHCHO	-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (二氯甲烷/水)	235.5 (分解)	氫氨酸鹽

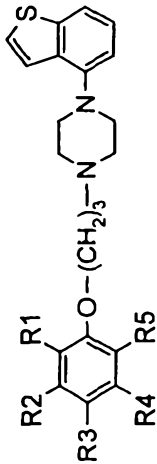
(364)

[表122]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1064	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	235.5-240.5 (分解)	二氫氨酸鹽
1065	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (異丙醇/ 異丙醚)	194.0-197.5	氫氨酸鹽
1066	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	淡黃色粉末 (乙酸乙酯/ 異丙醚)	156.0-157.5	氫氨酸鹽

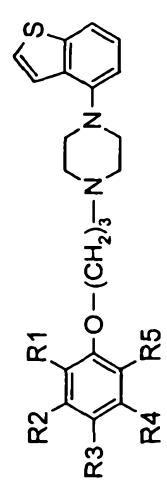
[表123]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1067	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	114.0-115.5	-
1068	-OCH3	-H		-H	-CH3	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	245.0 (分解)	氫氨酸鹽
1069	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (乙酸乙酯)	217.0-224.5 (分解)	氫氨酸鹽
1070	-OCH3	-H		-H	-CHO	白色粉末 (乙醇)	218.0 (分解)	氫氨酸鹽
1071	-OCH3	-H		-H	-CH2OH	白色粉末 (乙醇)	224.0-226.5 (分解)	氫氨酸鹽
1072	-OCH3	-H		-H	-CH2OCH3	白色粉末 (乙醇)	224.0-226.0	氫氨酸鹽

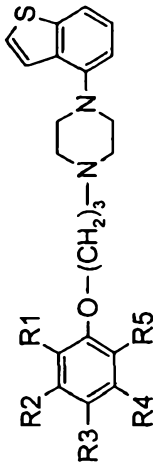


[表124]



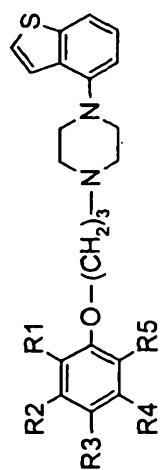
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1073	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	白色粉末 (乙醇/乙醚)	151.0-152.0	二富馬酸鹽
1074	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	淡黃色粉末 (乙醇/水)	264.0 (分解)	氫氨酸鹽
1075	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	淡黃色粉末 (乙醇/ 異丙醚)	143.5-151.0	-
1076	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	246.5-249.0 (分解)	氫氨酸鹽
1077	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	234.0-240.0 (分解)	二氫氨酸鹽
1078	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (甲醇/水)	286.5 (分解)	二氫氨酸鹽

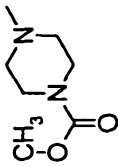
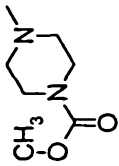
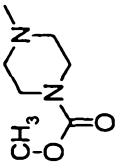
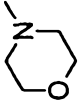

[表125]



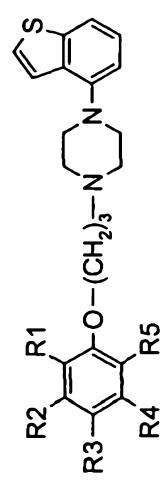
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1079	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙醇/水)	218.0-221.5	氫氨酸鹽
1080	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	223.0-228.0	氫氨酸鹽
1081	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯/異丙醚)	139.5-142.0	-
1082	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	270.0 (分解)	三氫氨酸鹽
1083	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	257.0-261.0 (分解)	氫氨酸鹽
1084	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>2</sub> OH	白色粉末 (乙酸乙酯)	217.5-221.0	氫氨酸鹽

[表126]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式(再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1085	-OCH <sub>3</sub>	H		H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	250.0 (分解)	氫氨酸鹽
1086	-OCH <sub>3</sub>	H		H	-CHO	淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	225.0 (分解)	氫氨酸鹽
1087	-OCH <sub>3</sub>	H		H	-CH <sub>2</sub> OH	白色粉末 (乙酸乙酯/ 異丙醚)	128.0-130.0	-
1088	-OCH <sub>3</sub>	H		H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	246.0 (分解)	氫氨酸鹽
1089	-OCH <sub>3</sub>	H		H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	248.0-251.0 (分解)	二氫氨酸鹽

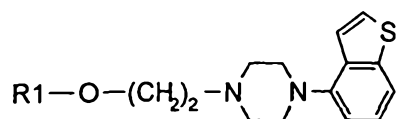
[表127]

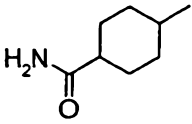
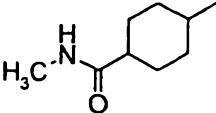


實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	鹽
1090	-NH <sub>2</sub>	-H	-CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.23 (3H, t, J=7.4 Hz), 2.00-2.15 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.40-3.50 (2H, m), 3.50-4.30 (2H, br), 4.13 (2H, t, J=6.5 Hz), 5.99 (1H, brs), 6.80 (1H, d, J=8.4 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.08 (1H, dd, J=2.1, 8.3 Hz), 7.19 (1H, d, J=2.1 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).	-

(370)

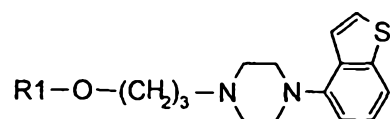
[表128]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1091		白色粉末 (乙醇/ 乙酸乙酯)	166.0-171.0	—
1092		白色粉末 (乙酸乙酯/ 異丙醚)	138.5-141.0	—

(371)

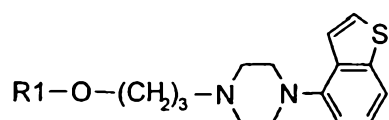
[表129]

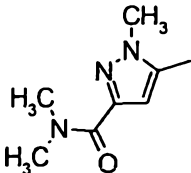
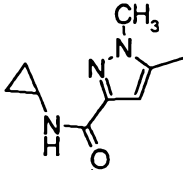
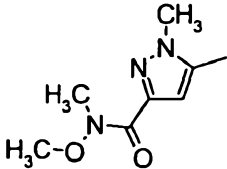
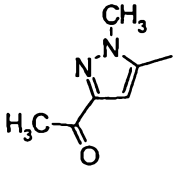
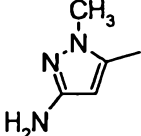
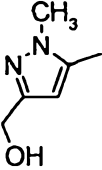
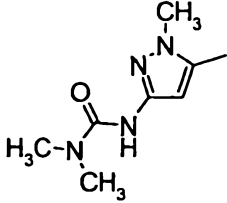
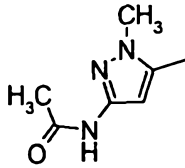


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1093		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	138.5-140.5	—
1094		白色粉末 (乙醇)	233.5 (分解)	氫氨酸鹽
1095		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	147.0-148.5	—
1096		白色粉末 (水)	115.0-121.0	—
1097		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	129.0-130.5	—
1098		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	139.0-140.5	—

(372)

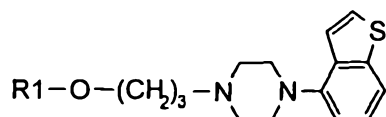
[表130]

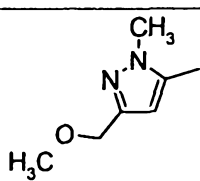
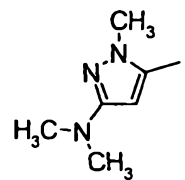
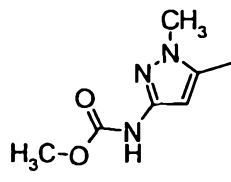
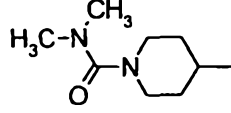
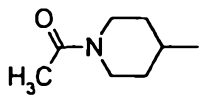
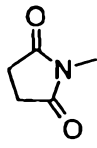
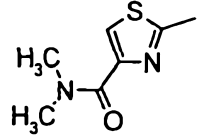


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1099		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	128.5-131.5	—
1100		白色粉末 (異丙醇/ 乙酸乙酯)	227.0 (分解)	氫氨酸鹽
1101		白色粉末 (乙醇/ 乙酸乙酯)	211.0-213.5	氫氨酸鹽
1102		白色粉末 (乙醇/水)	245.0 (分解)	氫氨酸鹽
1103		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	112.0-113.0	—
1104		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	123.5-126.0	—
1105		淡黃色粉末 (乙酸乙酯)	174.0-176.5	氫氨酸鹽
1106		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	137.0-139.0	—

(373)

[表131]

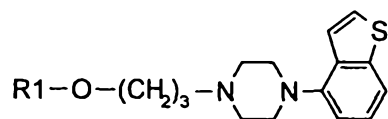


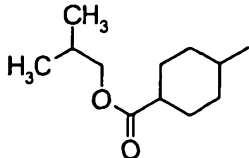
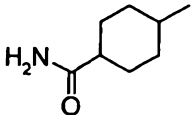
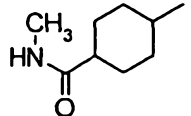
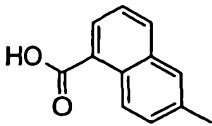
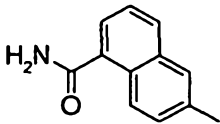
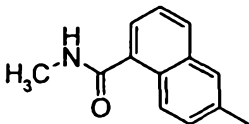
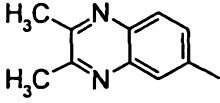
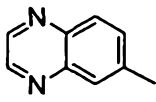
實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1107		白色粉末 (乙酸乙酯)	194.0-196.0	氫氨酸鹽
1108		白色粉末 (乙酸乙酯)	173.0-177.0	二氫氨酸鹽
1109		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	162.5-165.0	—
1110		白色粉末 (甲醇)	202-205	氫氨酸鹽
1111		白色粉末 (甲醇)	208-210	氫氨酸鹽
1112		白色粉末 (乙醇)	255.0-257.0	氫氨酸鹽
1113		白色粉末 (甲醇)	178-182	氫氨酸鹽



(374)

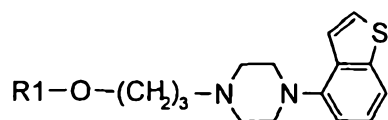
[表132]

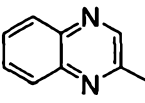
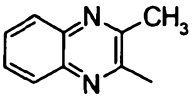
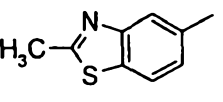
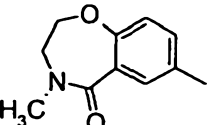
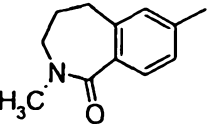


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1114		白色粉末 (乙酸乙酯)	199.0-201.5	氫氨酸鹽
1115		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	107.5-108.5	—
1116		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	110.0-112.0	—
1117		白色粉末 (水)	203.0-210.0	—
1118		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	167.0-169.0	—
1119		白色粉末 (乙酸乙酯)	138.0-140.0	—
1120		白色粉末 (乙酸乙酯/己烷)	115	—
1121		淡棕色粉末 (乙醇)	134.7	—

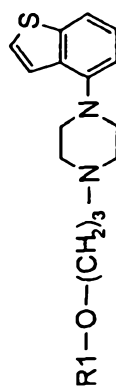
(375)

[表133]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1122		白色粉末 (乙醇)	131.3	—
1123		白色粉末 (乙醇)	107.1	—
1124		白色粉末 (乙酸乙酯)	231.3-232.8	氫氨酸鹽
1125		白色粉末 (乙酸乙酯)	218.9-221.0	氫氨酸鹽
1126		白色粉末 (乙酸乙酯)	259.0-260.2	氫氨酸鹽

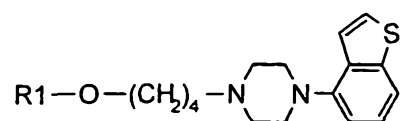
[表134]

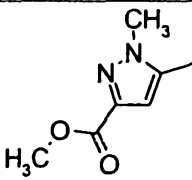
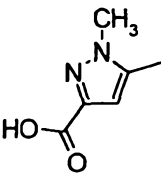
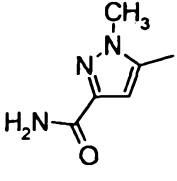
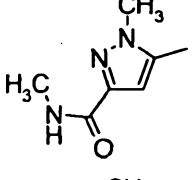
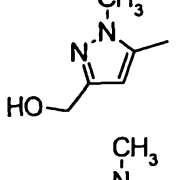
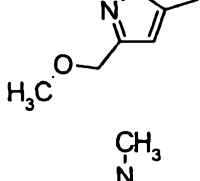
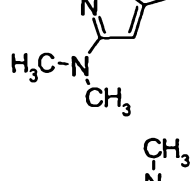
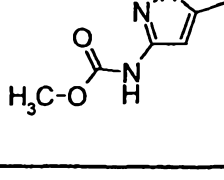


實例	R1	熔點(°C)	鹽
1127		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.80-2.10 (4H, m), 2.74 (6H, s), 3.10-3.70 (16H, m), 4.00-4.10 (1H, m), 6.97 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.32 (1H, t, J=7.9 Hz), 7.49 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.91 (1H, brs).	氫氨酸鹽
1128		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.80-2.10 (4H, m), 1.93 (3H, s), 3.10-3.60 (16H, m), 3.90-4.10 (1H, m), 6.95 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.30 (1H, t, J=7.9 Hz), 7.47 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.68 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.75 (1H, d, J=5.5 Hz), 11.30 (1H, brs).	氫氨酸鹽
1129		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.20-2.40 (2H, m), 2.70-3.70 (10H, m), 4.55 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.98 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.32 (1H, t, J=7.9 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.89 (1H, s), 10.97 (1H, brs), 12.93 (1H, brs).	氫氨酸鹽
1130		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 2.25-2.35 (2H, m), 3.20-4.00 (10H, m), 4.30 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.97 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.24 (1H, dd, J=5.5, 2.8 Hz), 7.31 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.49 (1H, d, J=5.4 Hz), 7.59 (1H, d, J=2.5 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.5 Hz), 8.53 (1H, d, J=5.7 Hz), 10.99 (1H, brs).	氫氨酸鹽
1131		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.89-2.13 (2H, m), 2.52-2.83 (6H, m), 3.03-3.3- (4H, m), 4.01 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.46 (2H, brs), 5.30 (1H, brs), 6.51 (1H, dd, J = 8.3, 2.3 Hz), 6.83-6.96 (2H, m), 7.19-7.45 (3H, m), 7.48 (1H, brs), 7.55 (1H, d, J = 8.0 Hz).	富馬酸鹽

(377)

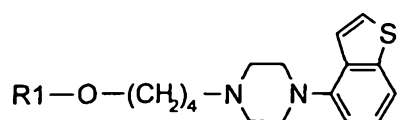
[表135]

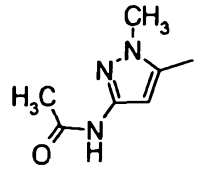
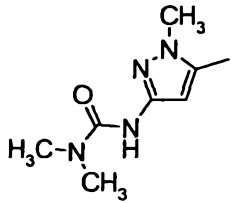
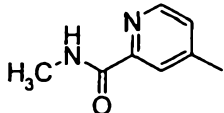
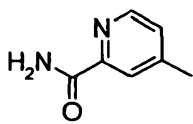
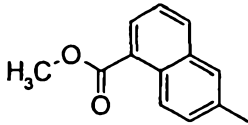
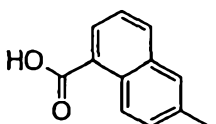
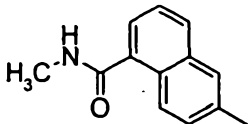
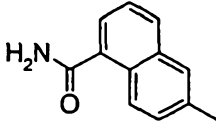

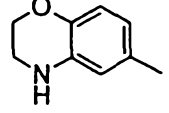


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1132		淡棕色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	103.5-106.0	—
1133		淡棕色粉末 (二氯甲烷/水)	140.5-144.0	—
1134		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	143.0-144.5	—
1135		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	211.0-213.5	氫氨酸鹽
1136		白色粉末 (乙酸乙酯)	207.5-209.5	氫氨酸鹽
1137		白色粉末 (乙醇)	167.0-168.5	氫氨酸鹽
1138		白色粉末 (乙酸乙酯)	156.5-158.5	氫氨酸鹽
1139		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	157.5-161.5	—

(378)

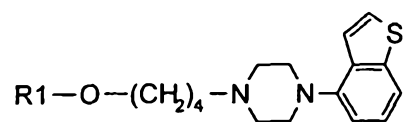
[表136]

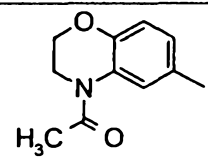
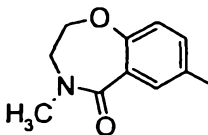
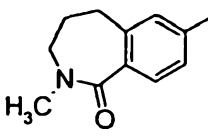
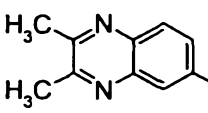
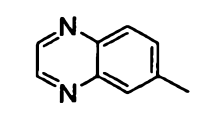
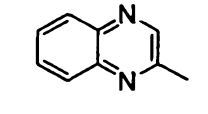
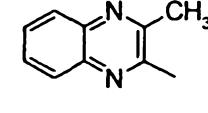


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1140		白色粉末 (乙酸乙酯)	203.5-206.0	氫氨酸鹽
1141		白色粉末 (乙酸乙酯)	186.0-187.5	氫氨酸鹽
1142		白色粉末 (乙酸乙酯)	203.0-207.0	氫氨酸鹽
1143		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	146.5-148.0	—
1144		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	96.5-97.0	—
1145		白色粉末 (乙酸)	254.0 (分解)	二氫氨酸鹽
1146		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	124.0-126.5	—
1147		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	181.5-183.5	—
1148		白色粉末 (乙酸乙酯)	230.2-231.5	氫氨酸鹽
1149		白色粉末 (乙酸乙酯)	207.4-209.6	氫氨酸鹽

(379)

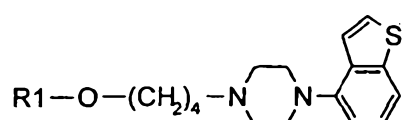
[表137]

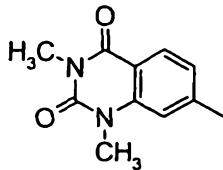


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1150		白色粉末 (乙酸乙酯)	213.8-215.2	氫氨酸鹽
1151		白色粉末 (乙酸乙酯)	217.0-218.0	氫氨酸鹽
1152		白色粉末 (乙酸乙酯)	231.6-232.9	氫氨酸鹽
1153		淡黃色粉末 (乙醇)	135.7	—
1154		淡黃色粉末 (乙醇)	238.1-240.1	氫氨酸鹽
1155		白色粉末 (乙醇)	210.4	氫氨酸鹽
1156		白色粉末 (乙醇)	94.1	—

(380)

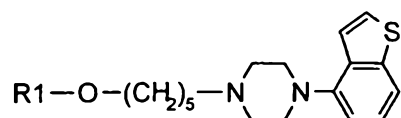
[表138]

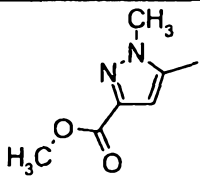
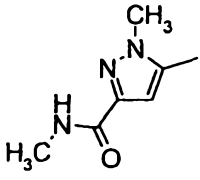
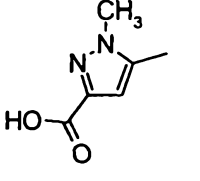
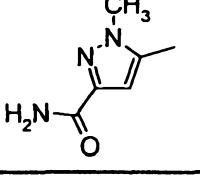


實例	R1	NMR	鹽
1157		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.72-1.83 (2H, m), 1.83-1.98 (2H, m), 2.48-2.59 (2H, m), 2.64-2.81 (4H, m), 3.12-3.28 (4H, m), 3.46 (3H, s), 3.58 (3H, s), 4.13 (2H, t, J = 6.3 Hz), 6.62 (1H, d, J = 2.1 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.8, 2.1 Hz), 6.90 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.20-7.31 (1H, m), 7.35-7.43 (2H, m), 7.55 (1H, d, J = 8.0 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8.8 Hz).	—

(381)

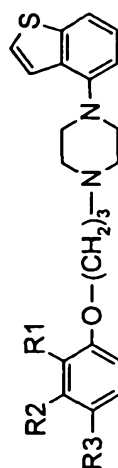
[表139]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
1158		白色粉末 (乙酸乙酯)	200.5-201.5	氫氨酸鹽
1159		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	225.0-230.0	氫氨酸鹽
1160		白色粉末 (二氯甲烷/水)	156.0-158.5	—
1161		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	169.0-171.5	—

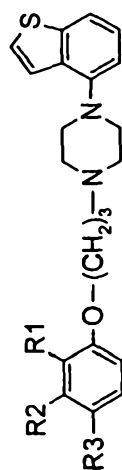


[表140]



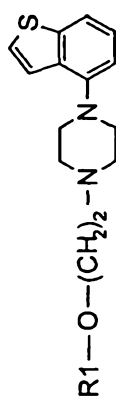
實例	R1	R2	R3	R4	R5	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:
1162	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	1.51 (9H, s), 1.95-2.10 (2H, m), 2.24 (3H, s), 2.66-2.81 (6H, m), 3.14-3.31 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.95 (2H, t, J=6.3Hz), 6.36 (1H, br), 6.60 (1H, d, J=2.5Hz), 6.87-6.92 (1H, m), 7.01 (1H, d, J=2.0Hz), 7.24-7.31 (1H, m), 7.37-7.44 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0Hz)
1163	-OCH <sub>3</sub>	-H	-I	-H	-CH <sub>3</sub>	1.92-2.10 (2H, m), 2.23 (3H, s), 2.57-2.86 (6H, m), 3.11-3.31 (4H, m), 3.82 (3H, s), 3.98 (2H, t, J=6.4Hz), 6.90 (1H, d, J=7.6Hz), 7.03 (1H, d, J=2.0Hz), 7.13 (1H, d, J=1.6Hz), 7.22-7.34 (1H, m), 7.40 (1H, dd, J=5.5Hz, 9.3Hz), 7.55 (1H, d, J=8.0Hz)
1164	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NHCONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	-H	-CH <sub>3</sub>	1.94-2.13 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.60-2.90 (6H, m), 3.12-3.33 (4H, m), 3.49-3.75 (4H, m), 3.83 (3H, s), 3.97 (2H, t, J=6.4Hz), 5.22 (1H, br), 6.25 (1H, br), 6.59 (1H, d, J=2.3Hz), 6.86 (1H, d, J=2.3Hz), 6.91 (1H, d, J=7.4Hz), 7.21-7.33 (1H, m), 7.41 (1H, dd, J=5.6Hz, 7.6Hz), 7.56 (1H, d, J=8.0Hz)
1165	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	1.91-2.08 (2H, m), 2.22 (3H, s), 2.62-2.81 (6H, m), 2.95 (2H, t, J=5.7Hz), 3.08-3.27 (6H, m), 3.80 (3H, s), 3.91 (2H, t, J=6.4Hz), 6.05 (1H, d, J=2.6Hz), 6.10 (1H, d, J=2.6Hz), 6.90 (1H, d, J=7.5Hz), 7.20-7.32 (1H, m), 7.34-7.46 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0Hz)
1166	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCOCH <sub>2</sub> Cl	-H	-CH <sub>3</sub>	1.91-2.11 (2H, m), 2.23 (3H, s), 2.60-2.84 (6H, m), 3.11-3.26 (4H, m), 3.26-3.36 (2H, m), 3.45-3.63 (2H, m), 3.81 (3H, s), 3.91 (2H, t, J=6.4Hz), 4.06 (2H, s), 6.04 (1H, d, J=2.5Hz), 6.10 (1H, d, J=2.5Hz), 6.78-6.96 (2H, m), 7.21-7.33 (1H, m), 7.35-7.47 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1Hz)

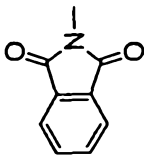
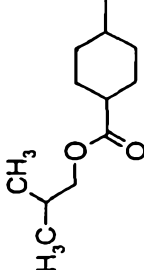
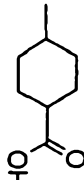
[表141]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:
1167	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>2</sub> Cl	3.89 (3H, s), 3.98-4.17 (4H, m), 4.40-4.54 (2H, m), 4.69 (2H, m), 6.77 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.91 (1H, d, J=2.5 Hz), 7.21-7.32 (1H, m), 7.35-7.46 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=9.3 Hz)
1168	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	1.48 (9H, s), 1.93-2.12 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.60-2.86 (6H, m), 2.95-3.12 (4H, m), 3.14-3.31 (4H, m), 3.50-3.67 (4H, m), 3.83 (3H, s), 3.94 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.33 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.19-7.33 (1H, m), 7.41 (2H, dd, J=5.5 Hz, 9.3 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz)
1169	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	1.92-2.09 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.61-2.81 (6H, m), 2.98-3.12 (8H, m), 3.14-3.25 (4H, m), 3.83 (3H, s), 3.94 (2H, t, J=6.4 Hz), 6.33 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.5 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.0 Hz), 7.20-7.33 (1H, m), 7.34-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz)
1170	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	1.50 (9H, s), 1.95-2.11 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.59-2.82 (6H, m), 3.12-3.27 (4H, m), 3.63-3.81 (4H, m), 3.83 (3H, s), 4.01 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.24 (2H, s), 6.61-6.71 (2H, m), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.21-7.33 (1H, m), 7.41 (2H, dd, J=5.5 Hz, 9.8 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz)
1171	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CHO	1.49 (9H, s), 1.96-2.12 (2H, m), 2.60-2.82 (6H, m), 3.04-3.16 (4H, m), 3.16-3.28 (4H, m), 3.52-3.64 (4H, m), 3.89 (3H, s), 4.14 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.78 (1H, d, J=2.8 Hz), 6.86-6.96 (2H, m), 7.20-7.33 (1H, m), 7.35-7.46 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 10.44 (1H, s)
1172	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CHO	1.97-2.13 (2H, m), 2.59-2.83 (6H, m), 2.96-3.09 (4H, m), 3.09-3.17 (4H, m), 3.17-3.28 (4H, m), 3.89 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=6.5 Hz), 6.79 (1H, d, J=2.7 Hz), 6.86-6.96 (2H, m), 7.20-7.34 (1H, m), 7.36-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 10.44 (1H, s)

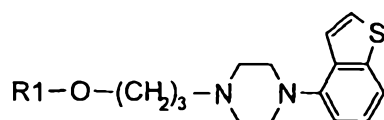
[表142]

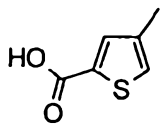
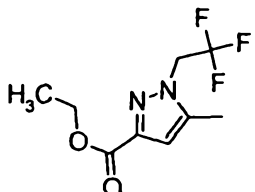
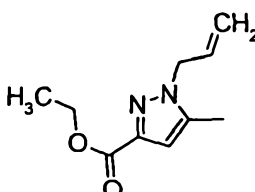
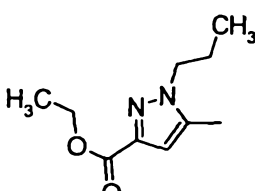


實例	R1	NMR
1173		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 2.70-2.87(4H, m), 2.95(2H, t, J=5.1Hz), 2.99-3.14(4H, m), 4.42(2H, t, J=5.1Hz), 6.78(1H, dd, J=0.6Hz, 7.6Hz), 7.18-7.30(1H, m), 7.38(2H, s), 7.54(1H, d, J=8.0Hz), 7.69-7.80(2H, m), 7.80-7.89(2H, m).
1174		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 0.93(6H, d, J=6.7Hz), 1.41-1.75(5H, m), 1.75-2.02(4H, m), 2.23-2.48(1H, m), 2.65-2.87(6H, m), 3.06-3.25(4H, m), 3.42-3.54(1H, m), 3.62(2H, t, J=6.2Hz), 3.85(2H, d, J=6.5Hz), 6.89(1H, d, J=7.6Hz), 7.20-7.34(1H, m), 7.34-7.46(2H, m), 7.54(1H, d, J=8.0Hz).
1175		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.41-1.75(4H, m), 1.75-2.01(4H, m), 2.18-2.44(1H, m), 2.72-3.04(6H, m), 3.14-3.31(4H, m), 3.44-3.54(1H, m), 3.64(2H, t, J=6.0Hz), 6.88(1H, d, J=7.6Hz), 7.20-7.31(1H, m), 7.31-7.44(2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz).

(385)

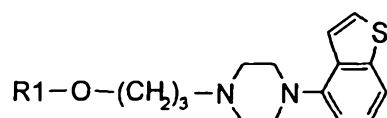
[表143]

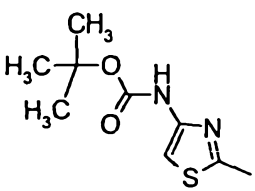
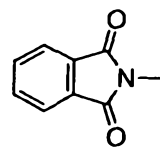
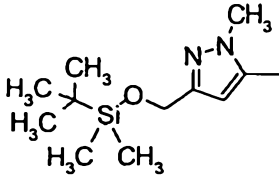
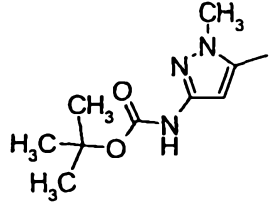


實例	R1	NMR
1176		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{DMSO-d}_6$ ) $\delta$ ppm: 1.85–1.95 (2H, m), 2.57 (2H, t, $J=7.1$ Hz), 2.60–2.75 (4H, m), 3.05–3.15 (4H, m), 4.03 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 6.85–6.95 (2H, m), 7.20–7.31 (2H, m), 7.35–7.41 (1H, m), 7.60 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.68 (1H, d, $J=5.5$ Hz).
1177		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 1.39 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.00–2.11 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 2.63–2.80 (4H, m), 3.09–3.25 (4H, m), 4.24 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.40 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.64 (2H, q, $J=8.3$ Hz), 6.12 (1H, s), 6.90 (1H, dd, $J=0.5$ Hz, 7.5 Hz), 7.25–7.31 (1H, m), 7.38–7.43 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.1$ Hz).
1178		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 1.39 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.00–2.06 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.67–2.83 (4H, m), 3.13–3.28 (4H, m), 4.18 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.39 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.61 (2H, m), 5.08–5.23 (2H, m), 5.87–6.09 (1H, m), 6.11 (1H, s), 6.75 (1H, dd, $J=0.6$ Hz, 7.5 Hz), 7.25–7.37 (1H, m), 7.40–7.43 (2H, m), 7.65 (1H, d, $J=8.0$ Hz).
1179		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 0.91 (3H, t, $J=7.5$ Hz), 1.38 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.72–1.93 (2H, m), 1.98–2.13 (2H, m), 2.61 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.67–2.83 (4H, m), 3.09–3.28 (4H, m), 4.01 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 4.18 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.39 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.08 (1H, s), 6.90 (1H, dd, $J=0.7$ Hz, 7.5 Hz), 7.25–7.30 (1H, m), 7.37–7.43 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.0$ Hz).

(386)

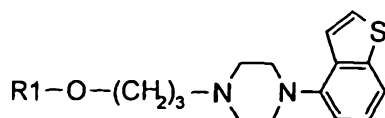
[表144]

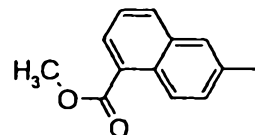
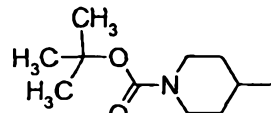
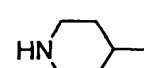
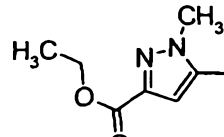
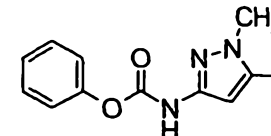


實例	R1	NMR
1180		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 1.51 (9H, s), 1.97–2.12 (2H, m), 2.52–2.67 (2H, m), 2.67–2.80 (4H, m), 3.07–3.29 (4H, m), 4.38 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$ ), 6.52 (1H, br), 6.90 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.03 (1H, br), 7.21–7.33 (1H, m), 7.40 (2H, dd, $J=5.6\text{ Hz}$ , $7.3\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$ ).
1181		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 1.95–2.13 (2H, m), 2.65–2.83 (6H, m), 3.09–3.27 (4H, m), 4.33 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$ ), 6.89 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.20–7.32 (1H, m), 7.40 (1H, dd, $J=5.6\text{ Hz}$ , $9.0\text{ Hz}$ ), 7.54 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.71–7.80 (2H, m), 7.80–7.90 (2H, m).
1182		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 0.10 (6H, s), 0.92 (9H, s), 1.93–2.13 (2H, m), 2.62 (2H, t, $J=7.5\text{ Hz}$ ), 2.70–2.83 (4H, m), 3.09–3.28 (4H, m), 3.59 (3H, s), 4.13 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$ ), 4.60 (2H, s), 5.54 (1H, s), 6.90 (1H, dd, $J=0.7\text{ Hz}$ , $7.5\text{ Hz}$ ), 7.20–7.33 (1H, m), 7.35–7.48 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$ ).
1183		$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm: 1.50 (9H, s), 1.94–2.12 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.0\text{ Hz}$ ), 2.66–2.80 (4H, m), 3.10–3.27 (4H, m), 3.52 (3H, s), 4.15 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$ ), 5.85 (1H, s), 6.81–6.97 (2H, m), 7.20–7.33 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$ ).

(387)

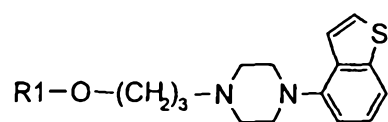
[表145]

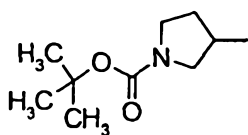
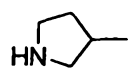


實例	R1	NMR
1184		$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 2.01–2.20 (2H, m), 2.62–2.87 (6H, m), 3.10–3.30 (4H, m), 3.99 (3H, s), 4.20 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 6.91 (1H, dd, $J=0.7$ Hz, 7.6 Hz), 7.20 (1H, d, $J=2.6$ Hz), 7.22–7.34 (2H, m), 7.35–7.50 (3H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.90 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.03 (1H, dd, $J=1.2$ Hz, 7.3 Hz), 8.83 (1H, d, $J=9.4$ Hz).
1185		$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.46 (9H, s), 1.45–1.60 (2H, m), 1.75–1.90 (4H, m), 2.50–2.60 (2H, m), 2.65–2.80 (4H, m), 3.05–3.25 (6H, m), 3.40–3.50 (1H, m), 3.53 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 3.70–3.80 (2H, m), 6.89 (1H, dd, $J=7.6$ , 0.7 Hz), 7.20–7.30 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.54 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 8.02 (1H, s).
1186		$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.30–1.60 (2H, m), 1.75–2.00 (4H, m), 2.50–2.75 (4H, m), 3.05–3.25 (6H, m), 3.30–3.40 (1H, m), 3.55 (2H, t, $J=6.5$ Hz), 6.90 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.20–7.30 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.1$ Hz).
1187		$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.38 (3H, t, $J=7.1$ Hz), 2.00–2.10 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.1$ Hz), 2.65–2.75 (4H, m), 3.15–3.25 (4H, m), 3.72 (3H, s), 4.17 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 4.38 (2H, q, $J=7.1$ Hz), 6.08 (1H, s), 6.89 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.20–7.30 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.54 (1H, d, $J=8.1$ Hz).
1188		$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.94–2.10 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.1$ Hz), 2.65–2.78 (4H, m), 3.10–3.25 (4H, m), 3.57 (3H, s), 4.15 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 5.93 (1H, s), 6.89 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.12–7.32 (3H, m), 7.33–7.45 (4H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.93 (1H, br).

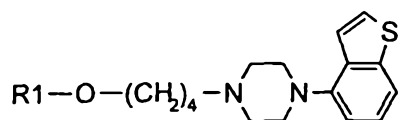
(388)

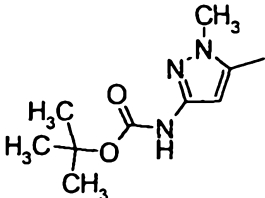
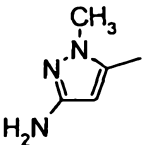
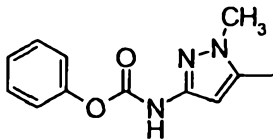
[表146]



實例	R1	NMR
1189		$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.75–2.00 (4H, m), 2.50–2.60 (2H, m), 2.70–2.75 (4H, m), 3.15–3.25 (4H, m), 3.35–3.80 (6H, m), 4.00–4.05 (1H, m), 6.91 (1H, dd, $J=7.6, 0.5$ Hz), 7.25–7.35 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.0$ Hz).
1190		$^1H$ -NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ ppm: 1.75–1.95 (4H, m), 2.51 (2H, t, $J=7.1$ Hz), 2.50–2.75 (8H, m), 3.10–3.20 (4H, m), 3.46 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.00–4.10 (1H, m), 6.88 (1H, d, $J=7.1$ Hz), 7.20–7.30 (1H, m), 7.30–7.45 (2H, m), 7.53 (1H, d, $J=8.0$ Hz).

[表147]

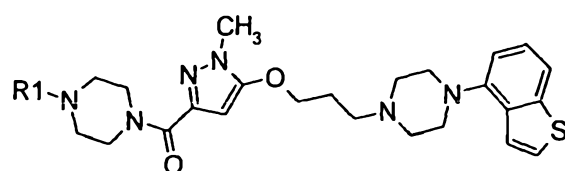


實例 R1	NMR
1191 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:: 1.50 (9H, s), 1.59–1.77 (2H, m), 1.77–1.93 (2H, m), 2.50 (2H, t, J=7.3Hz), 2.61–2.80 (4H, m), 3.11–3.27 (4H, m), 3.54 (3H, s), 4.09 (2H, t, J=6.3Hz), 5.85 (1H, s), 6.90 (1H, d, J=7.5Hz), 7.23–7.32 (1H, m), 7.36–7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.80 (1H, br).
1192 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:: 1.64–1.93 (4H, m), 2.51 (2H, t, J=7.3Hz), 2.61–2.79 (4H, m), 3.11–3.29 (4H, m), 3.46 (3H, s), 3.49 (2H, br), 4.02 (2H, t, J=6.2Hz), 4.94 (1H, s), 6.90 (1H, dd, J=0.7hz, 7.6Hz), 7.22–7.33 (1H, m), 7.35–7.46 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).
1193 	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:: 1.64–1.78 (2H, m), 1.78–1.94 (2H, m), 2.50 (2H, t, J=7.3Hz), 2.61–2.81 (4H, m), 3.10–3.28 (4H, m), 3.57 (3H, s), 4.09 (2H, t, J=6.3Hz), 5.92 (1H, s), 6.77–6.98 (4H, m), 7.11–7.32 (2H, m), 7.32–7.47 (4H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.47 (1H, br).



(390)

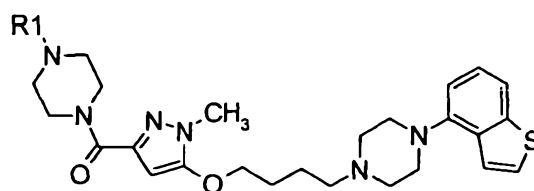
[表148]



實例	R1	MS(M+1)
1194	$-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	603
1195	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	541
1196	$-\text{COCH}_3$	511
1197	$-\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	569
1198	$-\text{COC}_6\text{H}_5$	573
1199	$-\text{COC}_3\text{H}_7$	539
1200		563

(391)

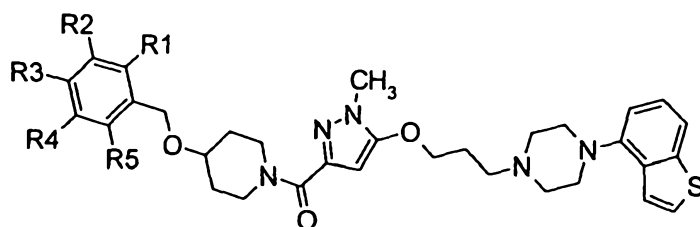
[表149]



實例	R1	MS(M+1)
1201	$-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	617
1202	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	555
1203	$-\text{COCH}_3$	525
1204	$-\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	583
1205	$-\text{COC}_6\text{H}_5$	587
1206	$-\text{COC}_3\text{H}_7$	553
1207		577

(392)

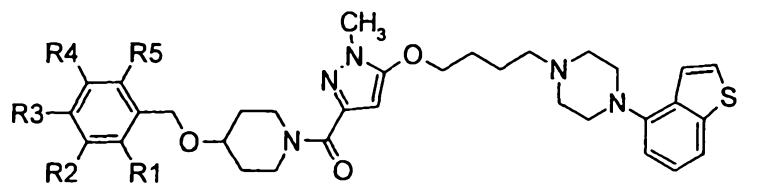
[表150]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1208	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
1209	-H	-H	-H	-H	-F	592
1210	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
1211	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	642
1212	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	604
1213	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	634
1214	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	588
1215	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	588
1216	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	588
1217	-H	-H	-F	-H	-H	592
1218	-H	-H	-H	-F	-H	592
1219	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	658
1220	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	658
1221	-H	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	658
1222	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-Cl	-H	638
1223	-H	-H	-H	-Br	-H	652
1224	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	604
1225	-H	-H	-H	-H	-H	574

(393)

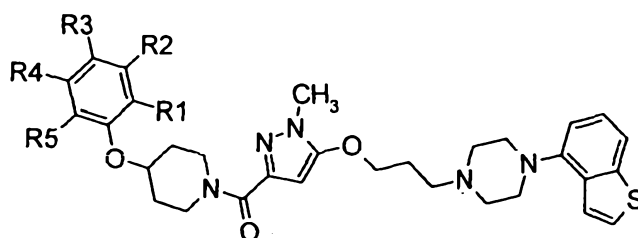
[表151]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1226	-H	-H	-H	-Cl	-H	622
1227	-H	-H	-H	-H	-F	606
1228	-H	-H	-H	-H	-Cl	622
1229	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	656
1230	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	618
1231	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	648
1232	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	602
1233	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	602
1234	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	602
1235	-H	-H	-F	-H	-H	606
1236	-H	-H	-H	-F	-H	606
1237	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	672
1238	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	672
1239	-H	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	672
1240	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-Cl	-H	652
1241	-H	-H	-H	-Br	-H	666
1242	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	618
1243	-H	-H	-H	-H	-H	588

(394)

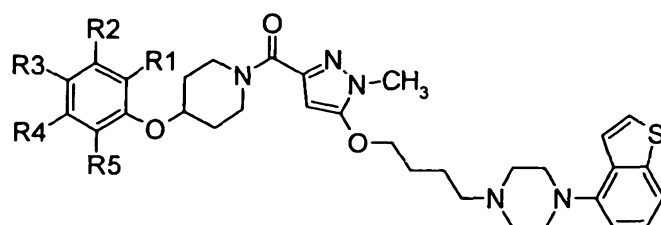
[表152]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1244	-H	-H	-CN	-H	-H	585
1245	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	590
1246	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	590
1247	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	590
1248	-H	-H	-H	-H	-H	560
1249	-H	-H	-H	-H	-Cl	594
1250	-H	-H	-H	-Cl	-H	594
1251	-H	-H	-Cl	-H	-H	594
1252	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	574
1253	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	574
1254	-H	-H	-F	-H	-H	578
1255	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	628

(395)

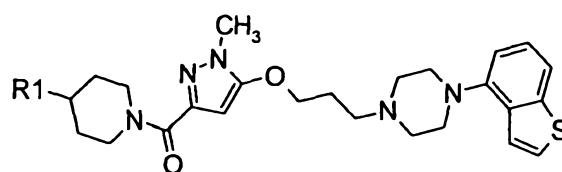
[表153]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1256	-H	-H	-CN	-H	-H	599
1257	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	604
1258	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	604
1259	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	604
1260	-H	-H	-H	-H	-H	574
1261	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
1262	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
1263	-H	-H	-Cl	-H	-H	608
1264	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	588
1265	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	588
1266	-H	-H	-F	-H	-H	592
1267	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	642

(396)

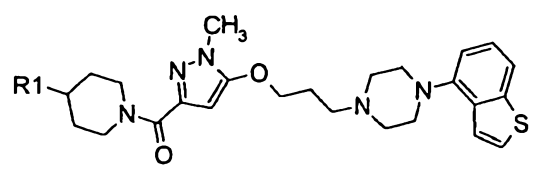
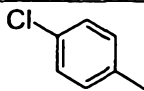
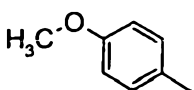
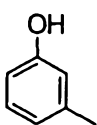
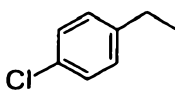
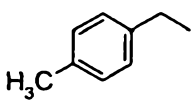
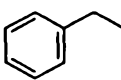
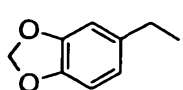
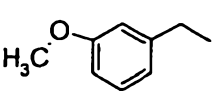
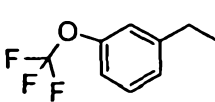
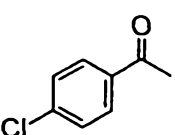
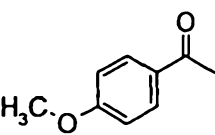
[表154]



實例	R1	MS(M+1)
1268	-OCH <sub>3</sub>	498
1269	-CH <sub>2</sub> CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	553
1270	-OH	484
1271	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	540
1272	-CONH <sub>2</sub>	511
1273	-CH <sub>2</sub> OH	498
1274	-N(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	597
1275	-NHCO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	583
1276	-CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	568
1277	-NHCOCH <sub>3</sub>	525
1278	-N(CH <sub>3</sub> )COCH <sub>3</sub>	539
1279	-COOH	512
1280	-N(CH <sub>3</sub> )CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	567
1281	-NHCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	553

(397)

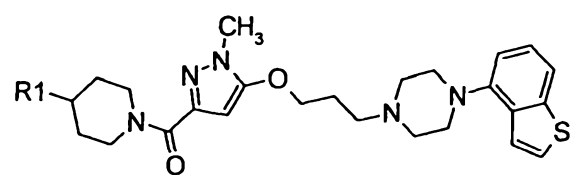
[表155]

		
實例	R1	MS(M+1)
1282		578
1283		574
1284		560
1285		592
1286		572
1287		558
1288		602
1289		588
1290		642
1291		606
1292		602



(398)

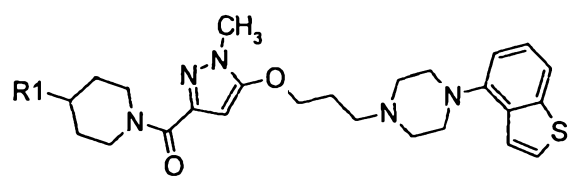
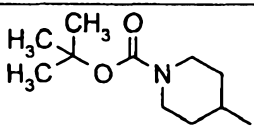
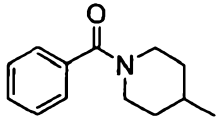
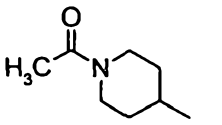
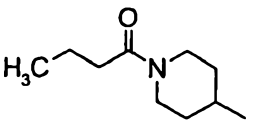
[表156]



實例	R1	MS(M+1)
1293		590
1294		572
1295		545
1296		561
1297		561
1298		575
1299		575
1300		587
1301		601

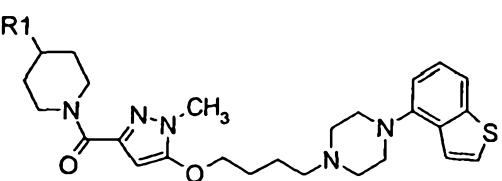
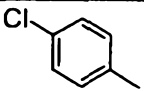
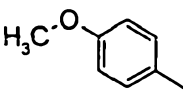
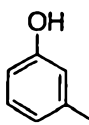
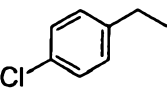
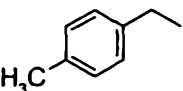
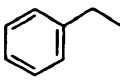
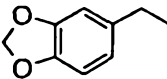
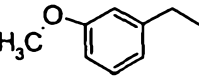
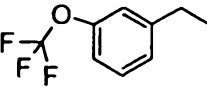
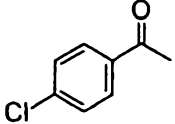
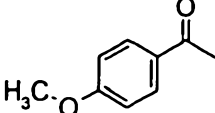
(399)

[表157]

		
實例	R1	MS(M+1)
1302		651
1303		655
1304		593
1305		621

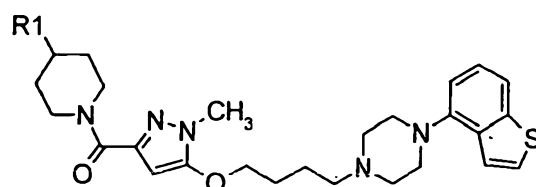
(400)

[表158]

		
實例	R1	MS(M+1)
1306		592
1307		588
1308		574
1309		606
1310		586
1311		572
1312		616
1313		602
1314		656
1315		620
1316		616

(401)

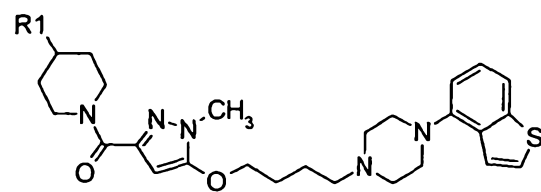
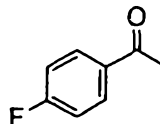
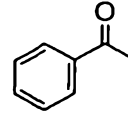

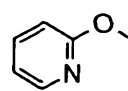
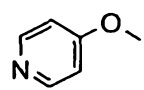
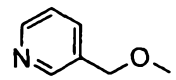
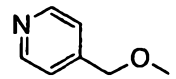
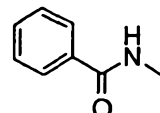
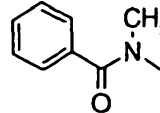
[表159]



實例	R1	MS(M+1)
1317	-OCH <sub>3</sub>	512
1318	-CH <sub>2</sub> CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	567
1319	-OH	498
1320	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	554
1321	-CONH <sub>2</sub>	525
1322	-CH <sub>2</sub> OH	512
1323	-N(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	611
1324	-NHCO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	597
1325	-CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	582
1326	-NHCOCH <sub>3</sub>	539
1327	-N(CH <sub>3</sub> )COCH <sub>3</sub>	553
1328	-N(CH <sub>3</sub> )CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	581
1329	-NHCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	567
1330	-COOH	526

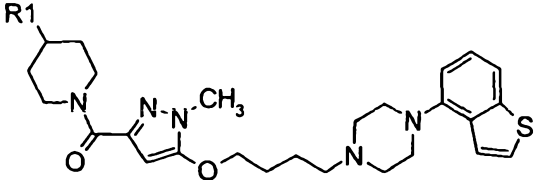
(402)

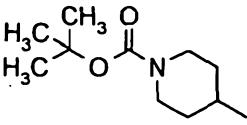
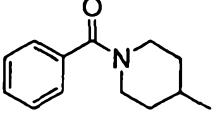
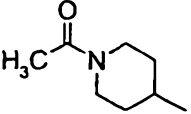
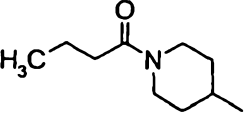
[表160]

		
實例	R1	MS(M+1)
1331		604
1332		586
1333		559
1334		575
1335		575
1336		589
1337		589
1338		601
1339		615

(403)

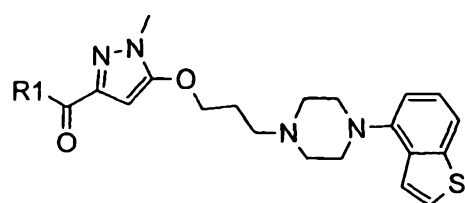
[表161]



實例	R1	MS(M+1)
1340		665
1341		669
1342		607
1343		635

(404)

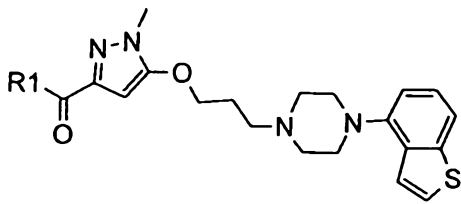
[表162]

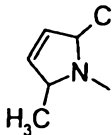

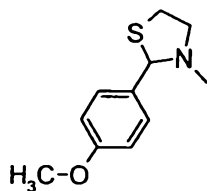
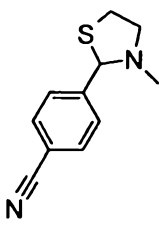
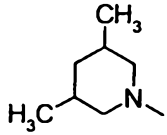
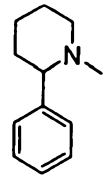
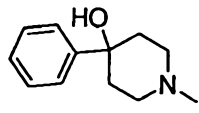
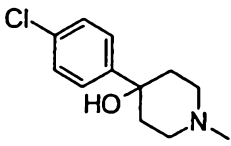


實例	R1	MS(M+1)
1344		644
1345		630
1346		497
1347		599
1348		511
1349		587
1350		573
1351		525
1352		553
1353		539

(405)

[表163]

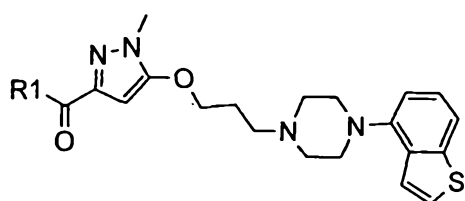


實例	R1	MS(M+1)
1354		480
1355		472
1356		578
1357		573
1358		496
1359		544
1360		560
1361		594



(406)

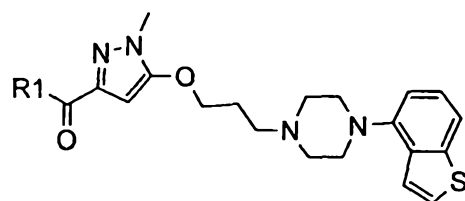
[表164]



實例	R1	MS(M+1)
1362		540
1363		600
1364		627
1365		484
1366		540
1367		512
1368		574
1369		526
1370		614

(407)

[表165]

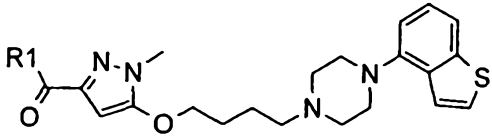
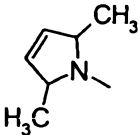

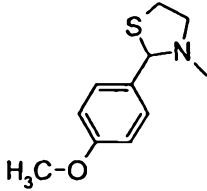
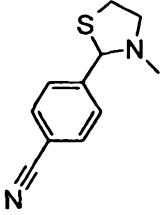
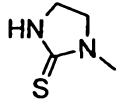
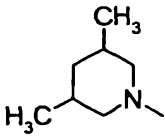
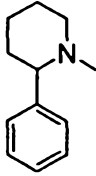
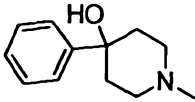
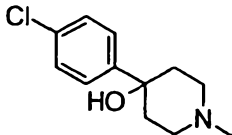


實例	R1	MS(M+1)
1371		543
1372		486
1373		470
1374		498
1375		546
1376		559
1377		539
1378		483
1379		593
1380		573



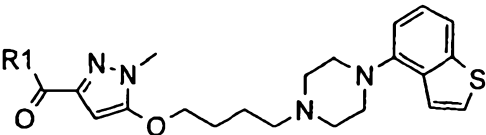
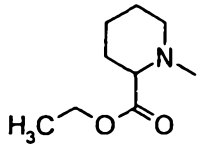
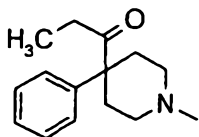
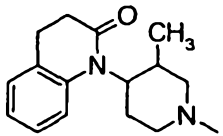
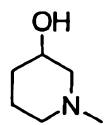
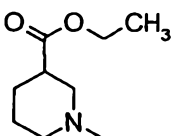
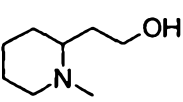
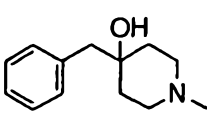
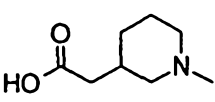
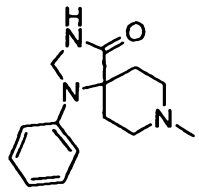
(409)

[表167]

		
實例	R1	MS(M+1)
1393		494
1394		486
1395		592
1396		587
1397		499
1398		510
1399		558
1400		574
1401		608

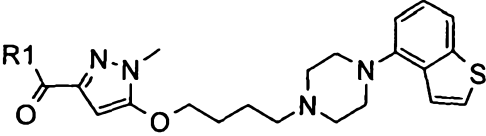
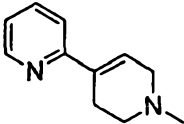
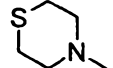
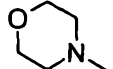
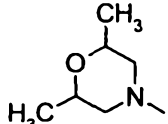
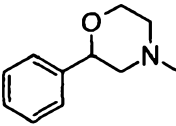
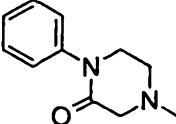
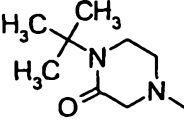
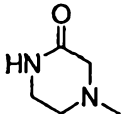
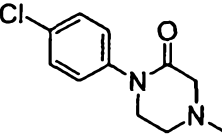
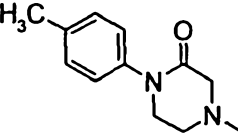
(410)

[表168]

		
實例	R1	MS(M+1)
1402		554
1403		614
1404		641
1405		498
1406		554
1407		526
1408		588
1409		540
1410		628

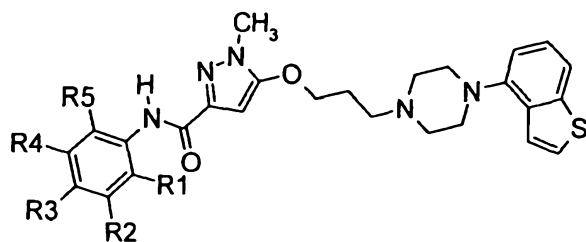
(411)

[表169]

		
實例	R1	MS(M+1)
1411		557
1412		500
1413		484
1414		512
1415		560
1416		573
1417		553
1418		497
1419		607
1420		587

(412)

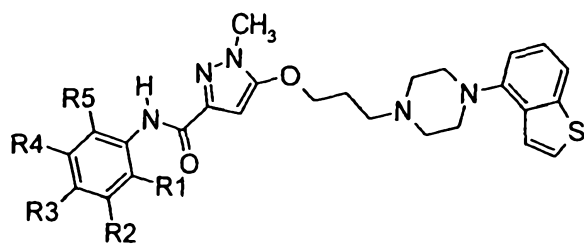
[表170]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1421	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	560
1422	-H	-H	-H	-H	-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	555
1423	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	506
1424	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	506
1425	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-H	518
1426	-H	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	534
1427	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	536
1428	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	536
1429	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	536
1430	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	563
1431	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	536
1432	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	519
1433	-H	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	518
1434	-H	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	533
1435	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	533
1436	-H	-CN	-H	-H	-H	501
1437	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	564
1438	-H	-H	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	568
1439	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	592
1440	-H	-H	-OH	-Cl	-H	526
1441	-Cl	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	567
1442	-H	-CN	-H	-H	-Cl	535
1443	-Cl	-H	-H	-CONH <sub>2</sub>	-H	553
1444	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	521
1445	-H	-H	-CN	-H	-H	501

(413)

[表171]

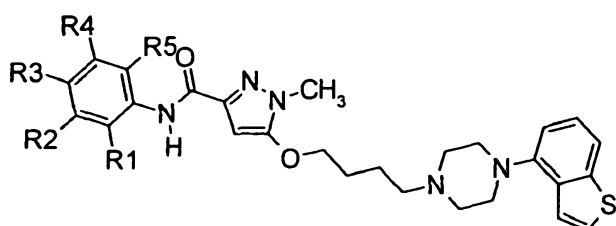


實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1446	-H	-H		-H	-H	558
1447	-H	-H		-H	-H	584
1448	-H	-H		-H	-H	561
1449	-H	-H		-H	-H	605
1450	-H	-H	-H		-H	587
1451	-H	-H	-H		-H	542



(414)

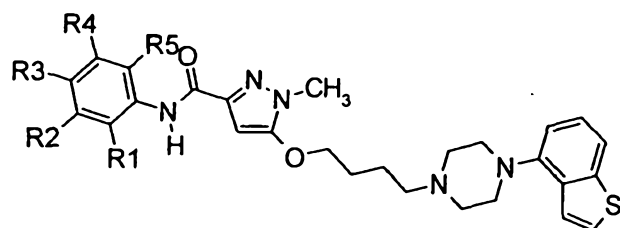
[表172]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1452	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	574
1453	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	520
1454	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	520
1455	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-H	532
1456	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	548
1457	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	550
1458	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	550
1459	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	550
1460	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	577
1461	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	550
1462	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	533
1463	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	532
1464	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	547
1465	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	547
1466	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	578
1467	-H	-H	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	582
1468	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	606
1469	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	550
1470	-H	-Cl	-OH	-H	-H	540
1471	-H	-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	596
1472	-H	-H	-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	583
1473	-H	-H	-CONHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	609
1474	-H	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-H	547
1475	-H	-H	-NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	581
1476	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-H	-H	534
1477	-H	-H	-CCH	-H	-H	514
1478	-H	-H	-COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-H	560
1479	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	547
1480	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	547

(415)

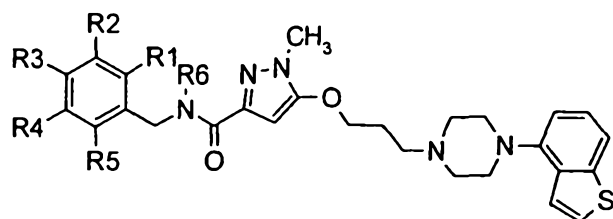
[表173]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1481	-H	-H		-H	-H	573
1482	-H	-H		-H	-H	572
1483	-H		-H	-H	-H	601
1484	-H		-H	-H	-H	556
1485	-H		-H	-H	-H	557

(416)

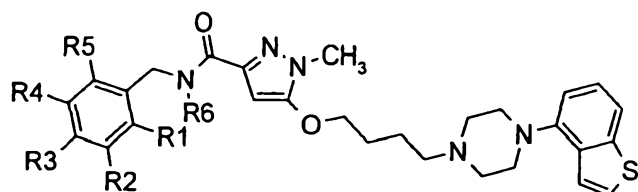
[表174]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1486	-H	-H	-H	-H	-H	-H	490
1487	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	524
1488	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	524
1489	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	524
1490	-H	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	561
1491	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	548
1492	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	564
1493	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	562
1494	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	520
1495	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	520
1496	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	588
1497	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	574
1498	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	550
1499	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	578
1500	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	520
1501	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	550
1502	-H	-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	634
1503	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	534
1504	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OH	548
1505	-H	-Cl	-OCHF <sub>2</sub>	-H	-H	-H	590
1506	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	574
1507	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	534

(417)

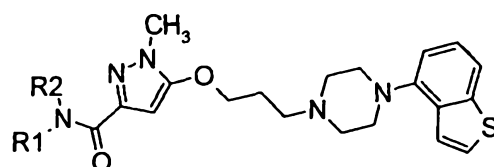
[表175]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1508	-H	-H	-H	-H	-H	-H	504
1509	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	538
1510	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	538
1511	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	538
1512	-H	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	575
1513	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	562
1514	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	578
1515	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	576
1516	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	534
1517	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	534
1518	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	602
1519	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	588
1520	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	564
1521	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	592
1522	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	534
1523	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	564
1524	-H	-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	648
1525	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	548
1526	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OH	562
1527	-H	-Cl	-OCHF <sub>2</sub>	-H	-H	-H	604
1528	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	588
1529	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	548

(418)

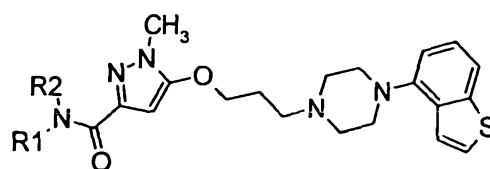
[表176]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1530	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-CH <sub>3</sub>	496
1531	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-H	482
1532	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	512
1533	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	488
1534	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	472
1535	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	526
1536	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	516
1537	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	456
1538	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	456
1539	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	456
1540	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-H	440
1541	-CH <sub>3</sub>	-H	414
1542	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	428
1543	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	456
1544	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	458
1545	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	472
1546	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	486
1547	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	520
1548	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-H	454
1549	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>	-H	485
1550	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> OH	-H	486
1551	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	504
1552	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	472
1553	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	-H	457
1554	-CH(CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	558
1555	-CH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	500
1556	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	486
1557	-CH <sub>2</sub> CCH	-H	438
1558	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	470
1559	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	528
1560	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	528
1561	-CH(CONH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	-H	500
1562	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	482
1563	-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	497
1564	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	428
1565	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	500

(419)

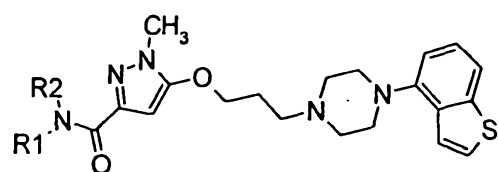
[表177]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1566	-CH <sub>2</sub> CN	-H	439
1567	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	486
1568	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	486
1569	-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	472
1570	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	-H	446
1571	-CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> OH	-H	474
1572	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	-H	471
1573	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	-H	474
1574	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-H	444
1575	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	-H	484
1576	-CH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	499
1577	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )COCH <sub>3</sub>	-H	499
1578	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	527

(420)

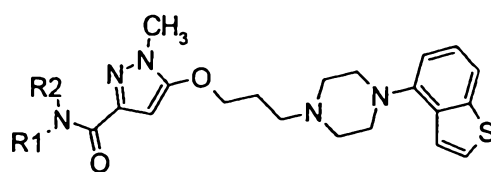
[表178]

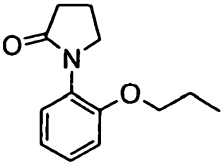
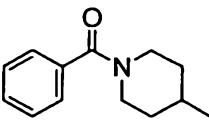
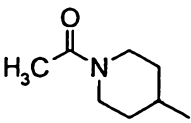
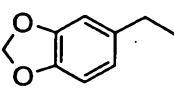
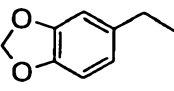
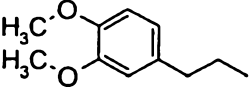
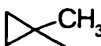
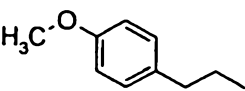
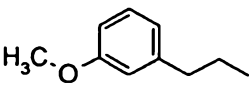
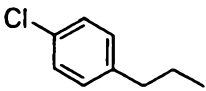
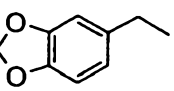
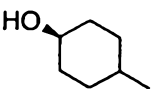
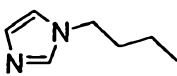


實例	R1	R2	MS(M+1)
1579		-CH <sub>3</sub>	519
1580		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	526
1581		-H	518
1582		-H	491
1583		-H	491
1584		-H	491
1585		-H	480
1586		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	533
1587		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	578
1588		-CH <sub>3</sub>	534
1589		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	591
1590		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	633

(421)

[表179]

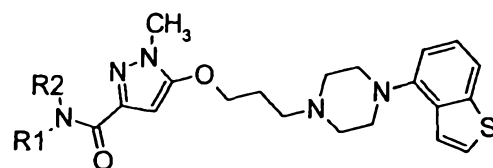


實例	R1	R2	MS(M+1)
1591		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	631
1592		-CH <sub>3</sub>	601
1593		-CH <sub>3</sub>	539
1594		-CH <sub>3</sub>	548
1595		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	562
1596		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	592
1597		-H	454
1598		-H	534
1599		-H	534
1600		-H	538
1601		-H	534
1602		-H	498
1603		-H	508



(422)

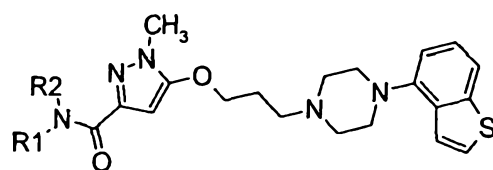
[表180]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1604		-H	562
1605		-H	548
1606		-H	578
1607		-H	514
1608		-H	528
1609		-H	537
1610		-H	499
1611		-H	547
1612		-H	601
1613		-H	552
1614		-H	484

(423)

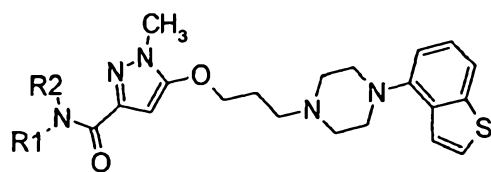
[表181]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1615		-H	471
1616		-H	485
1617		-CH <sub>3</sub>	577
1618		-CH <sub>3</sub>	561
1619		-H	534
1620		-H	518
1621		-H	518
1622		-H	545
1623		-H	559
1624		-H	505
1625		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	547
1626		-CH <sub>3</sub>	619

(424)

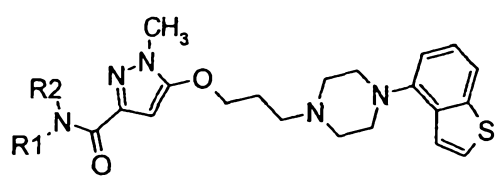
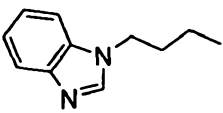
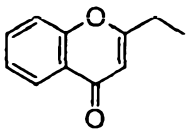
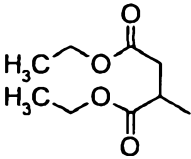
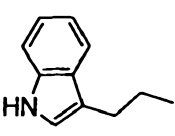
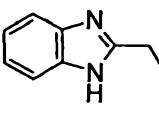
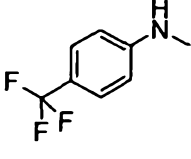
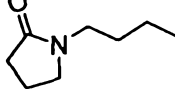
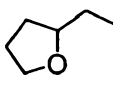
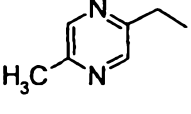
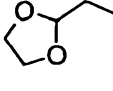
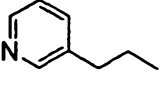
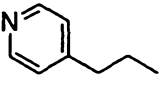
[表182]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1627		-CH <sub>3</sub>	615
1628		-CH <sub>3</sub>	615
1629		-CH <sub>3</sub>	615
1630		-CH <sub>3</sub>	635
1631		-CH <sub>3</sub>	635
1632		-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	657
1633		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	643
1634		-H	583
1635		-H	569
1636		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	573
1637		-H	540

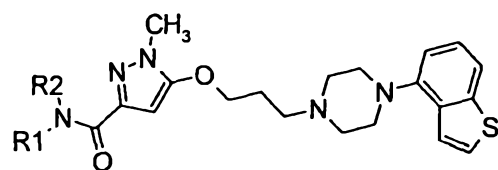
(425)

[表183]

					
實例	R1	R2	MS(M+1)	MW	
1638		-H	558	557.72	
1639		-H	558	557.68	
1640		-H	572	571.70	
1641		-H	543	542.71	
1642		-H	530	529.67	
1643		-H	559	558.63	
1644		-H	525	524.69	
1645		-H	484	483.64	
1646		-H	506	505.65	
1647		-H	486	485.61	
1648		-H	505	504.66	
1649		-H	505	504.66	

(426)

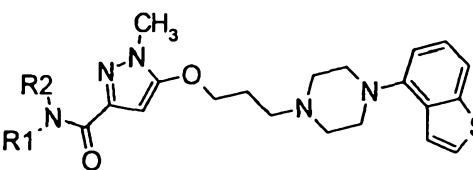
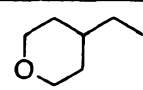
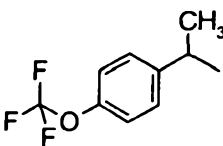
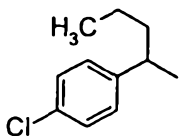
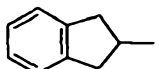
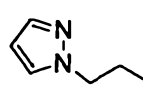
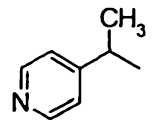
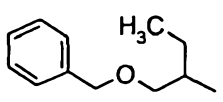
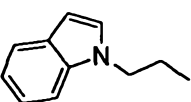
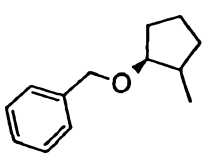
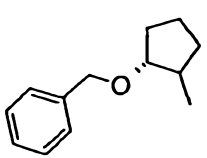
[表184]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1650		-H	494
1651		-H	494
1652		-H	493
1653		-H	522
1654		-H	508
1655		-H	508
1656		-H	480
1657		-H	497
1658		-H	510
1659		-H	532
1660		-H	454
1661		-H	524

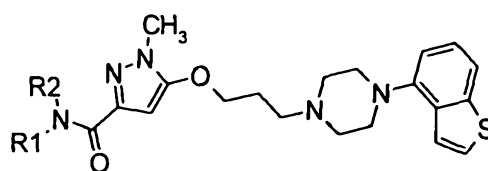
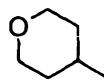
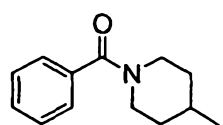
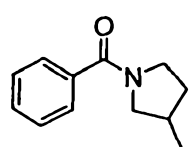
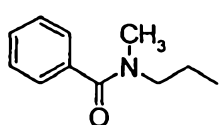
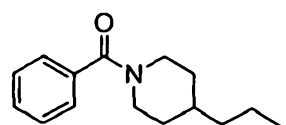
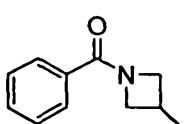
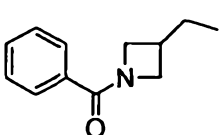
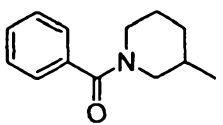
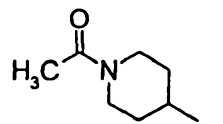
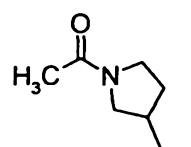
(427)

[表185]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1662		-H	498
1663		-H	588
1664		-CH <sub>3</sub>	580
1665		-H	516
1666		-H	494
1667		-H	505
1668		-H	562
1669		-H	543
1670		-H	574
1671		-H	574

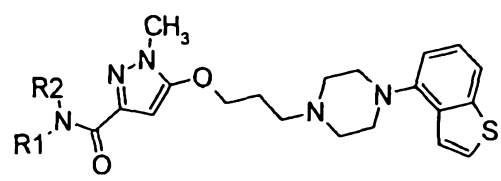
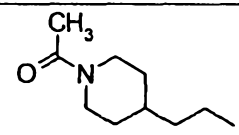
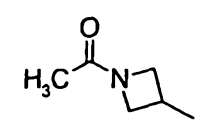
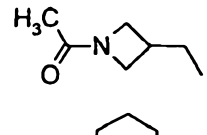
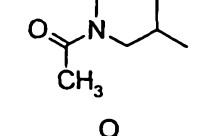
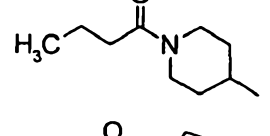
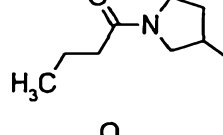
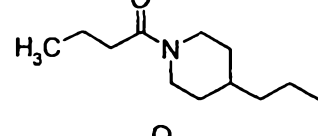
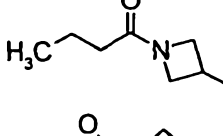
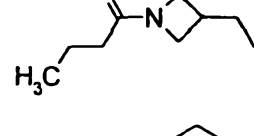
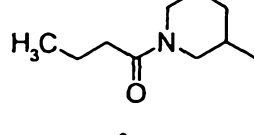
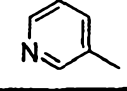
(428)

[表186]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1672		-H	484
1673		-H	587
1674		-H	573
1675		-H	561
1676		-H	615
1677		-H	559
1678		-H	573
1679		-H	587
1680		-H	525
1681		-H	511

(429)

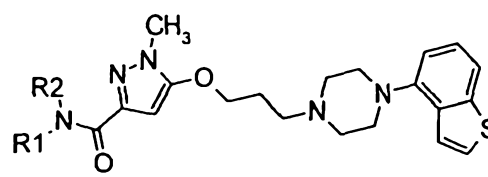
[表187]

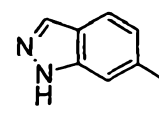
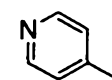
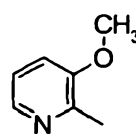
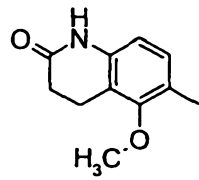
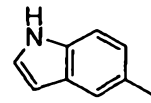
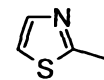
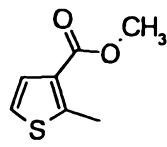
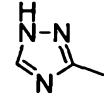
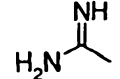
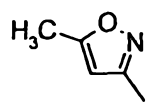
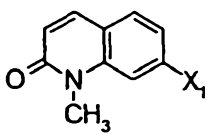
				
實例	R1	R2	MS(M+1)	
1682		-H	553	
1683		-H	497	
1684		-H	511	
1685		-H	525	
1686		-H	553	
1687		-H	539	
1688		-H	581	
1689		-H	525	
1690		-H	539	
1691		-H	553	
1692		-H	477	



(430)

[表188]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1693		-H	516
1694		-H	477
1695		-H	507
1696		-H	575
1697		-H	515
1698		-H	483
1699		-H	540
1700		-H	467
1701		-H	443
1702		-H	481
1703		-H	557

(431)

[表189]

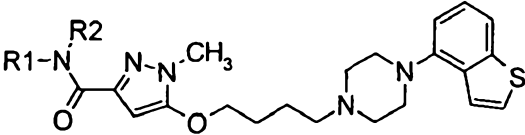
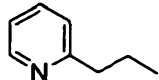
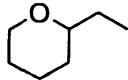
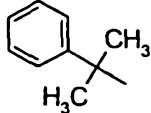
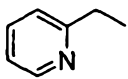
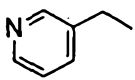
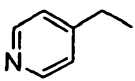
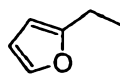
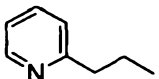
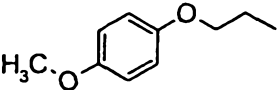
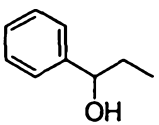
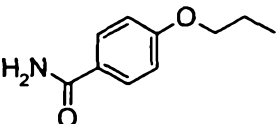
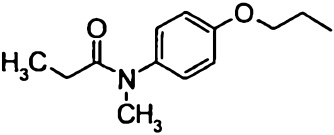
實例	R1	R2	MS(M+1)
1704		-H	531
1705		-H	540
1706		-H	527
1707		-H	498
1708		-H	509
1709		-H	532
1710		-H	481
1711		-H	480
1712		-H	497
1713		-H	467





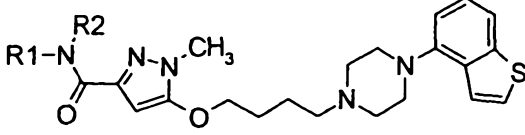
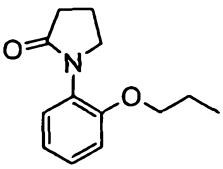
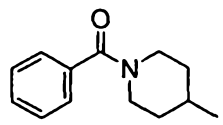
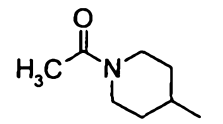
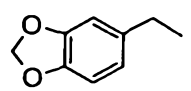
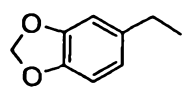
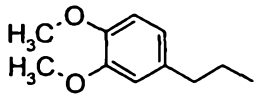
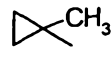
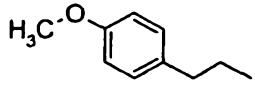
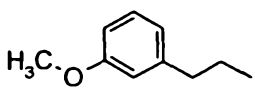
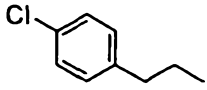
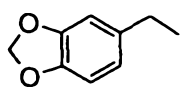
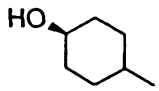
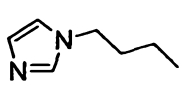
(434)

[表192]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1767		-CH <sub>3</sub>	533
1768		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	540
1769		-H	532
1770		-H	505
1771		-H	505
1772		-H	505
1773		-H	494
1774		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	547
1775		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	592
1776		-CH <sub>3</sub>	548
1777		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	605
1778		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	647

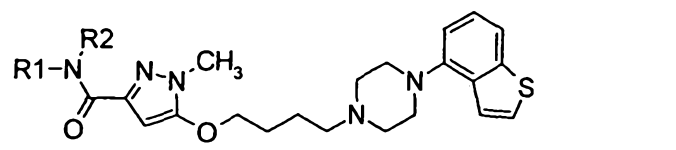
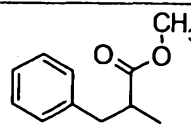
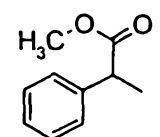
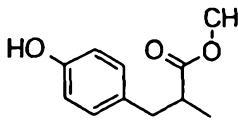
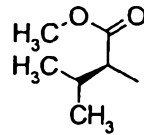
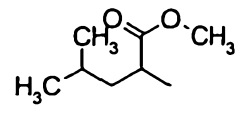
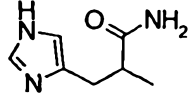
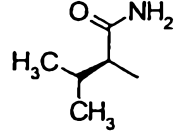
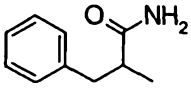
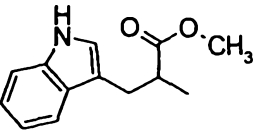
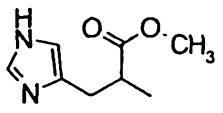
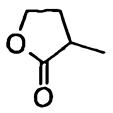
(435)

[表193]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1779		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	645
1780		-CH <sub>3</sub>	615
1781		-CH <sub>3</sub>	553
1782		-CH <sub>3</sub>	562
1783		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	576
1784		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	606
1785		-H	468
1786		-H	548
1787		-H	548
1788		-H	552
1789		-H	548
1790		-H	512
1791		-H	522

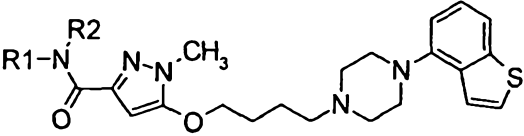
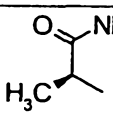
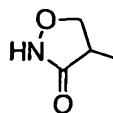
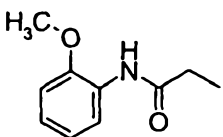
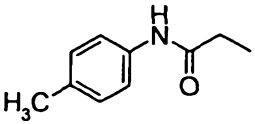
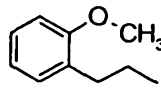
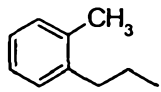
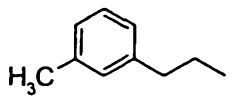
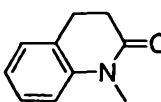
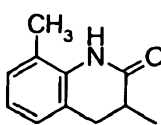
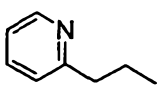
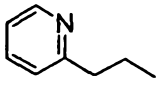
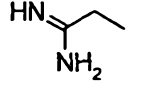
(436)

[表194]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1792		-H	576
1793		-H	562
1794		-H	592
1795		-H	528
1796		-H	542
1797		-H	551
1798		-H	513
1799		-H	561
1800		-H	615
1801		-H	566
1802		-H	498

(437)

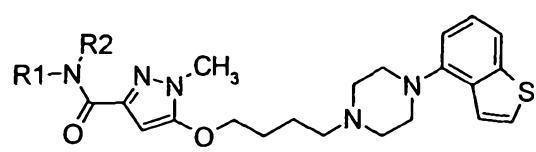
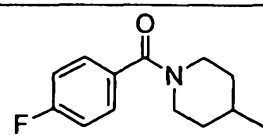
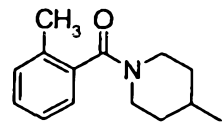
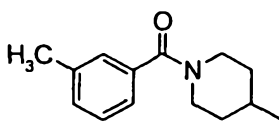
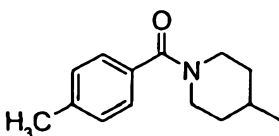
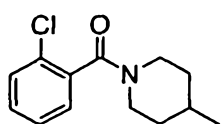
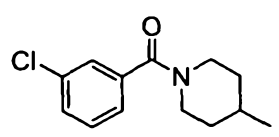
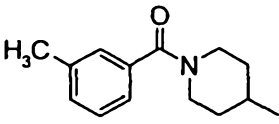
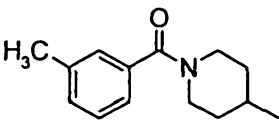
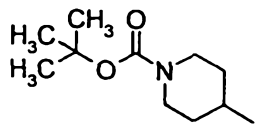
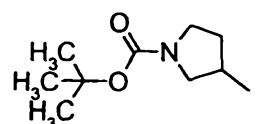
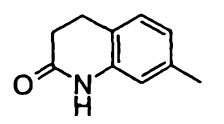
[表195]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1803		-H	485
1804		-H	499
1805		-CH <sub>3</sub>	591
1806		-CH <sub>3</sub>	575
1807		-H	548
1808		-H	532
1809		-H	532
1810		-H	559
1811		-H	573
1812		-H	519
1813		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	561
1814		-H	470



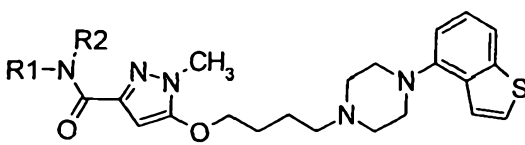
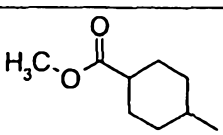
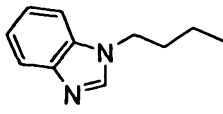
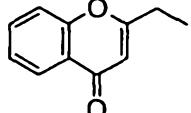
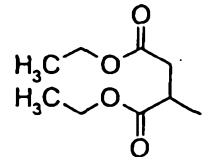
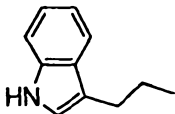
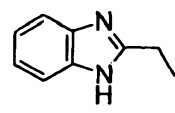
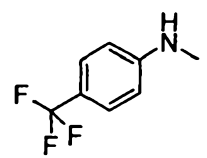
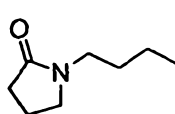
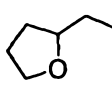
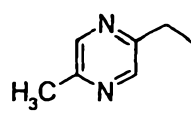
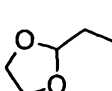
(438)

[表196]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1815		-CH <sub>3</sub>	633
1816		-CH <sub>3</sub>	629
1817		-CH <sub>3</sub>	629
1818		-CH <sub>3</sub>	629
1819		-CH <sub>3</sub>	649
1820		-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	649
1821		-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	671
1822		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	657
1823		-H	597
1824		-H	583
1825		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	587

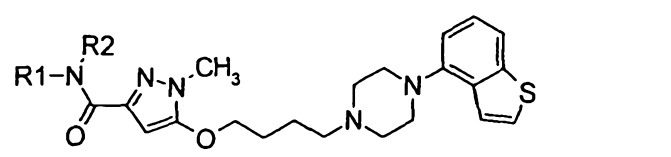
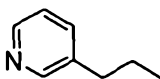
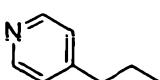
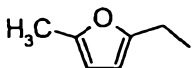
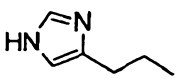
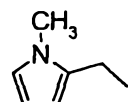
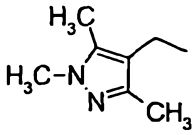
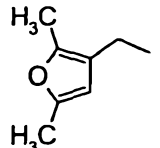
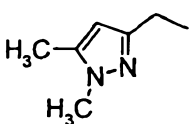
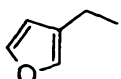
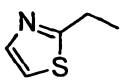
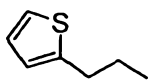
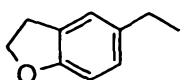
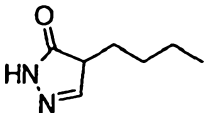
(439)

[表197]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1826		-H	554
1827		-H	572
1828		-H	572
1829		-H	586
1830		-H	557
1831		-H	544
1832		-H	573
1833		-H	539
1834		-H	498
1835		-H	520
1836		-H	500

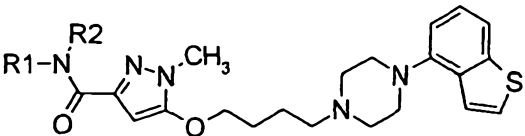
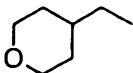
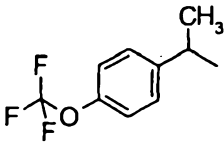
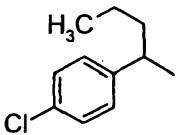
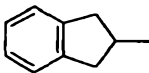
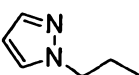
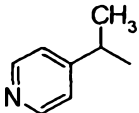
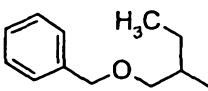
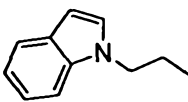
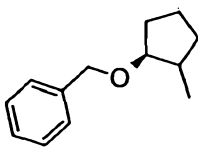
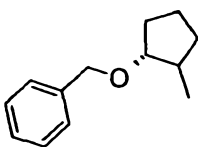
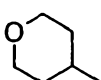
(440)

[表198]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1837		-H	519
1838		-H	519
1839		-H	508
1840		-H	508
1841		-H	507
1842		-H	536
1843		-H	522
1844		-H	522
1845		-H	494
1846		-H	511
1847		-H	524
1848		-H	546
1849		-H	538

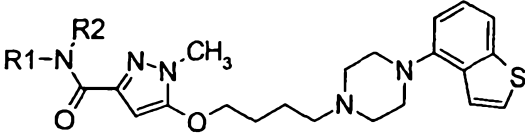
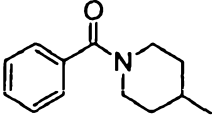
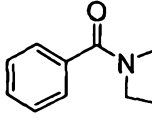
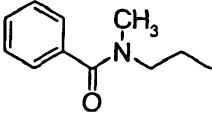
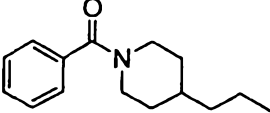
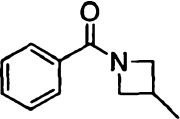
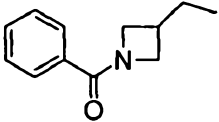
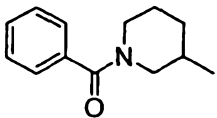
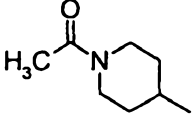
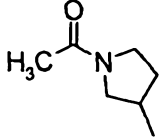
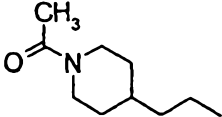
(441)

[表199]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1850		-H	512
1851		-H	602
1852		-CH <sub>3</sub>	594
1853		-H	530
1854		-H	508
1855		-H	519
1856		-H	576
1857		-H	557
1858		-H	588
1859		-H	588
1860		-H	498

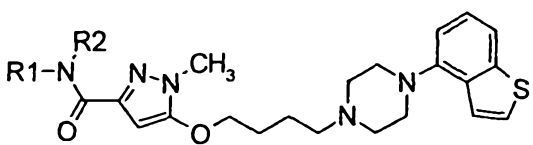
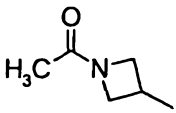
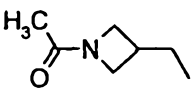
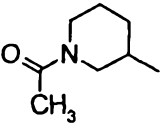
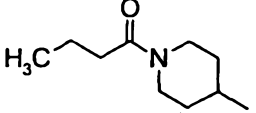
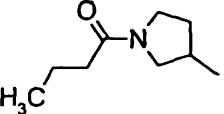
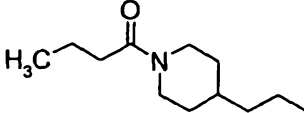
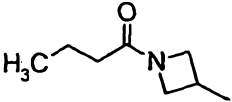
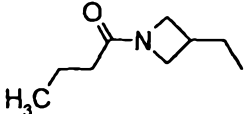
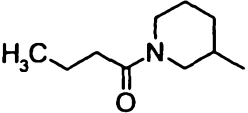
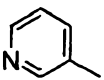
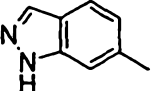
(442)

[表200]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1861		-H	601
1862		-H	587
1863		-H	575
1864		-H	629
1865		-H	573
1866		-H	587
1867		-H	601
1868		-H	539
1869		-H	525
1870		-H	567

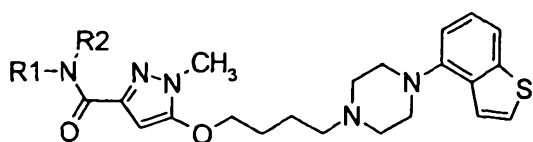
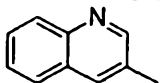
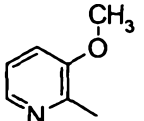
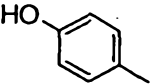
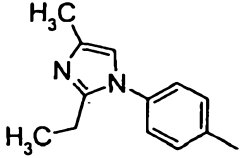
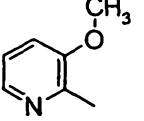
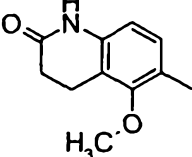
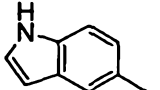

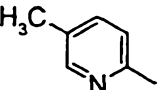

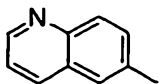
(443)

[表201]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1871		-H	511
1872		-H	525
1873		-H	539
1874		-H	567
1875		-H	553
1876		-H	595
1877		-H	539
1878		-H	553
1879		-H	567
1880		-H	491
1881		-H	530

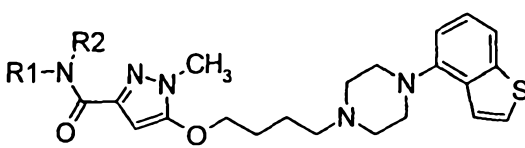
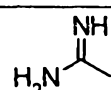
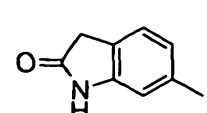
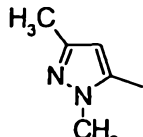
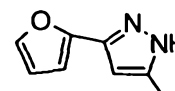
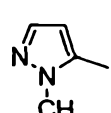
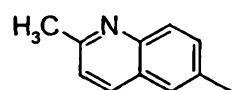
(444)

[表202]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1882		-H	541
1883		-H	505
1884		-CH <sub>3</sub>	520
1885		-CH <sub>3</sub>	612
1886		-H	521
1887		-H	589
1888		-H	529
1889		-H	577
1890		-H	505
1891		-H	497
1892		-H	541

(445)

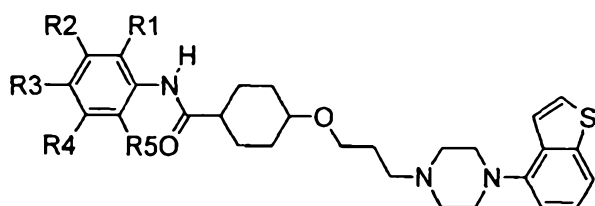
[表203]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
1893		-H	456
1894		-H	545
1895		-H	508
1896		-H	546
1897		-H	494
1898		-H	555



(446)

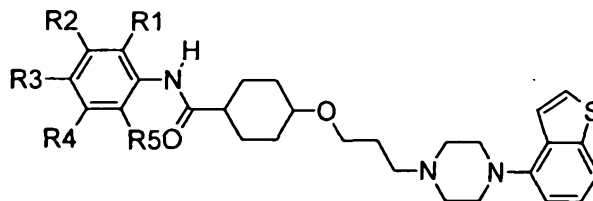
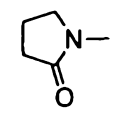
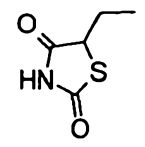
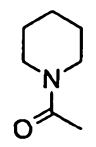

[表204]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1899	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	562
1900	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	508
1901	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	508
1902	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	538
1903	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	538
1904	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	538
1905	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	565
1906	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	538
1907	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	521
1908	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	520
1909	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	535
1910	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	535
1911	-H	-H	-H	-CN	-H	503
1912	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	566
1913	-H	-H	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	570
1914	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	594
1915	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	538
1916	-H	-Cl	-OH	-H	-H	528
1917	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	-Cl	584
1918	-H	-H	-CN	-H	-H	503
1919	-H	-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	584
1920	-H	-H	-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	571
1921	-H	-H	-CONHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	597
1922	-H	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-H	535
1923	-H	-H	-NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	569
1924	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-H	-H	522
1925	-H	-H	-C≡CH	-H	-H	502
1926	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	535
1927	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	535

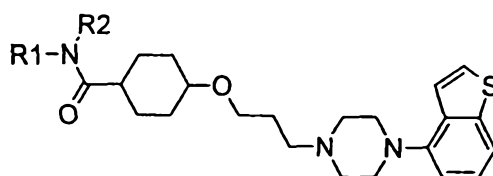
(447)

[表205]

						
實例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1928	-H	-H		-H	-H	561
1929	-H	-H		-H	-H	607
1930	-H		-H	-H	-H	589
1931	-H		-H	-H	-H	545

(448)

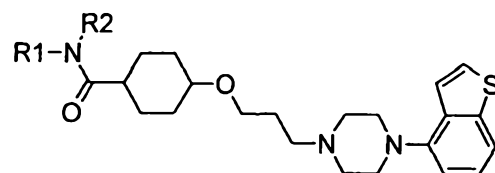
[表206]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1932	-CH <sub>3</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	498
1933	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-H	484
1934	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	514
1935	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	514
1936	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	490
1937	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	474
1938	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	528
1939	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	518
1940	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	498
1941	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	510
1942	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	458
1943	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	458
1944	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	458
1945	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-H	442
1946	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	430
1947	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	460
1948	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	486
1949	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	474
1950	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	488
1951	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	-H	470
1952	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-H	456
1953	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-H	498
1954	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>	-H	487
1955	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> OH	-H	488
1956	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	-H	459
1957	-CH <sub>2</sub> C≡CH	-H	440
1958	-CH <sub>3</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	458
1959	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	472
1960	-CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	486
1961	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	472
1962	-CH <sub>2</sub> CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	486
1963	-CH(CONH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	-H	502
1964	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	470
1965	-CH(CONH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	-H	499

(449)

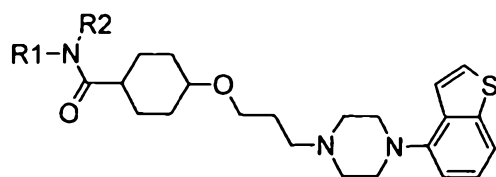
[表207]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1966	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	430
1967	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	502
1968	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	486
1969	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	472
1970	-CH <sub>2</sub> CN	-H	441
1971	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	474
1972	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	488
1973	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	488
1974	-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-H	474
1975	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	-H	448
1976	-CH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> OH	-H	476
1977	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	-H	473
1978	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	-H	476
1979	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-H	446
1980	-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-H	466
1981	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	-H	486
1982	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCONH <sub>2</sub>	-H	488

(450)

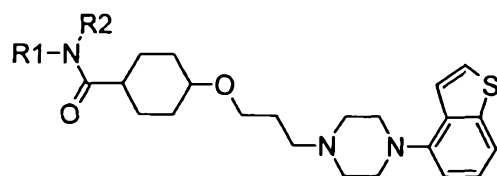
[表208]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1983		-CH <sub>3</sub>	508
1984		-H	479
1985		-H	479
1986		-H	479
1987		-H	493
1988		-H	509
1989		-H	493
1990		-H	485
1991		-H	486
1992		-H	500
1993		-H	470
1994		-H	496
1995		-H	529

(451)

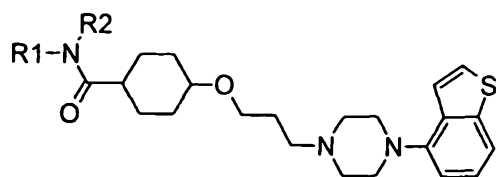
[表209]



實例	R1	R2	MS(M+1)
1996		-H	511
1997		-H	469
1998		-H	518
1999		-H	517
2000		-H	533
2001		-H	518
2002		-H	551
2003		-H	529
2004		-H	529
2005		-H	543
2006		-H	577

(452)

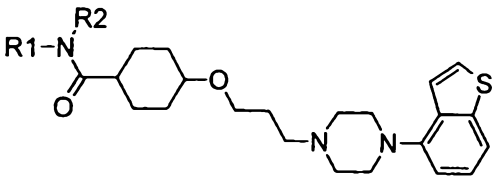
[表210]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2007		-H	565
2008		-H	561
2009		-H	444
2010		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	528
2011		-H	482
2012		-H	456
2013		-H	484
2014		-H	500
2015		-H	510
2016		-H	473
2017		-H	487
2018		-H	472
2019		-H	498

(453)

[表211]

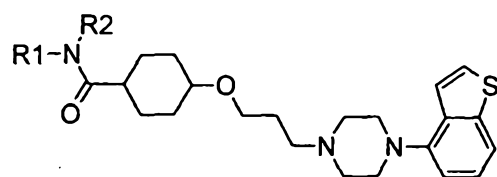


實例	R1	R2	MS(M+1)
2020		-H	498
2021		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	484
2022		-H	527
2023		-H	486
2024		-H	488
2025		-H	502
2026		-H	496
2027		-H	496
2028		-H	495
2029		-H	524
2030		-H	524
2031		-H	510
2032		-H	510



(454)

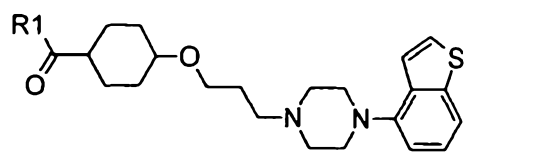
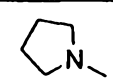
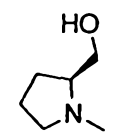
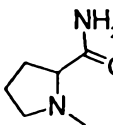
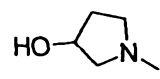
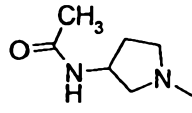
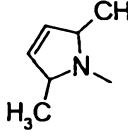
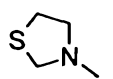
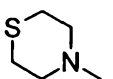
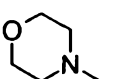
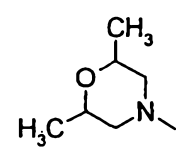
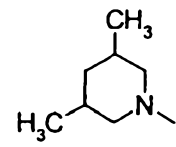
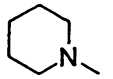
[表212]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2033		-H	512
2034		-H	498
2035		-H	482
2036		-H	499
2037		-H	512
2038		-H	456
2039		-H	500
2040		-H	482
2041		-H	496
2042		-H	486
2043		-CH <sub>3</sub>	510
2044		-CH <sub>3</sub>	524
2045		-CH <sub>3</sub>	525
2046		-H	510

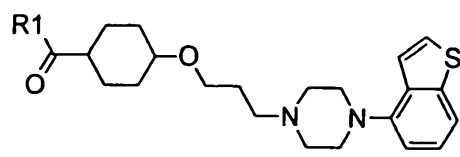
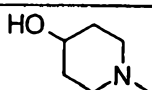
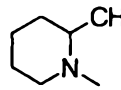
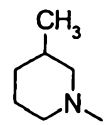
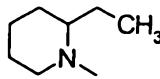
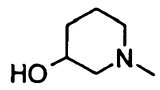
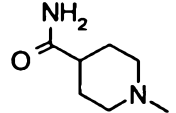
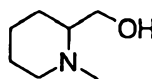
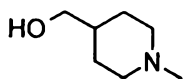
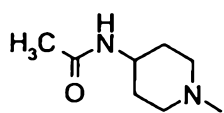
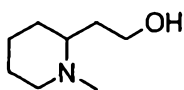
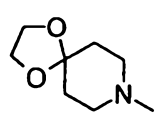
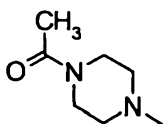
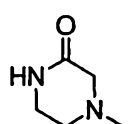
(455)

[表213]

		
實例	R1	MS(M+1)
2047		456
2048		486
2049		499
2050		472
2051		513
2052		482
2053		474
2054		488
2055		472
2056		500
2057		498
2058		470

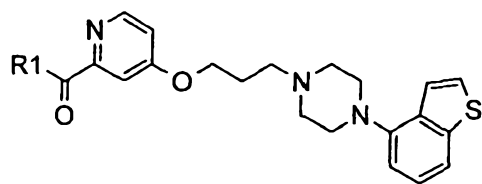
(456)

[表214]

		
實例	R1	MS(M+1)
2059		486
2060		484
2061		484
2062		498
2063		486
2064		513
2065		500
2066		500
2067		527
2068		514
2069		528
2070		513
2071		485

(457)

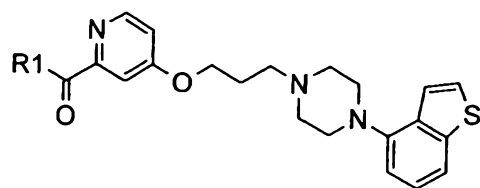
[表215]



實例	R1	MS(M+1)
2072		523
2073		483
2074		477
2075		469
2076		467
2077		495
2078		556
2079		513
2080		552
2081		494

(458)

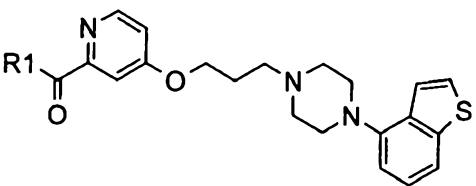
[表216]

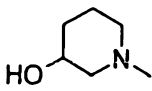
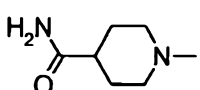
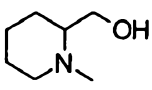
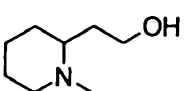
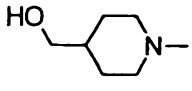
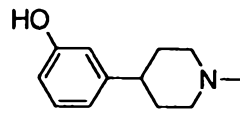
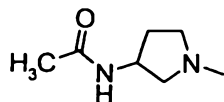
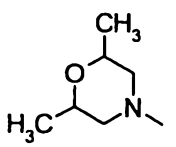
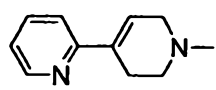


實例	R1	MS(M+1)
2082		557
2083		591
2084		591
2085		571
2086		571
2087		575
2088		510
2089		508
2090		479
2091		479

(459)

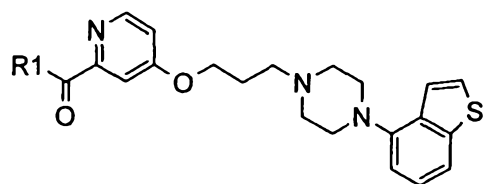
[表217]



實例	R1	MS(M+1)
2092		481
2093		508
2094		495
2095		509
2096		495
2097		557
2098		508
2099		495
2100		540

(460)

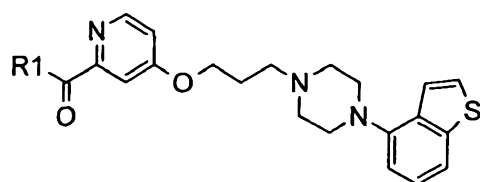
[表218]



實例	R1	MS(M+1)
2101		564
2102		550
2103		481
2104		494
2105		499
2106		527
2107		550
2108		545
2109		575

(461)

[表219]

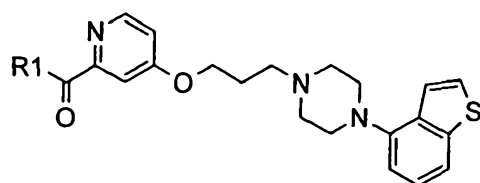


實例	R1	MS(M+1)
2110		570
2111		563
2112		493
2113		522
2114		523
2115		480
2116		557
2117		520
2118		533



(462)

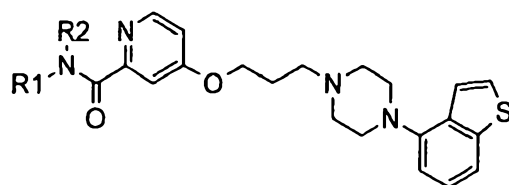
[表220]



實例	R1	MS(M+1)
2119		560
2120		481
2121		543
2122		542
2123		542

(463)

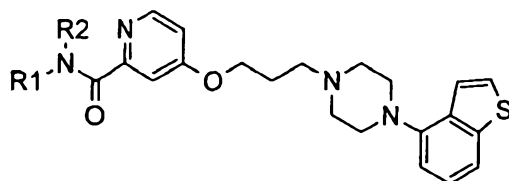
[表221]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2124	-CH <sub>3</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	493
2125	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	479
2126	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	485
2127	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	482
2128	-H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	453
2129	-H	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	437
2130	-H	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	487
2131	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	501
2132	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	467
2133	-H	-CH <sub>3</sub>	411
2134	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	425
2135	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	439
2136	-H	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	453
2137	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	455
2138	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	469
2139	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	517
2140	-H	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	465
2141	-H	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	493
2142	-H	-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	501
2143	-H	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	454

(464)

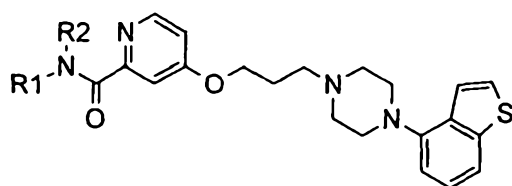
[表222]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2144	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	439
2145	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	453
2146	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> OH	483
2147	-H	-CH <sub>2</sub> CCH	435
2148	-CH <sub>3</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	453
2149	-H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	467
2150	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	468
2151	-H	-CH(CONH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	497
2152	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	465
2153	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	510
2154	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	479
2155	-H	-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	494
2156	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	425
2157	-H	-CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	485
2158	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	497
2159	-H	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	467
2160	-H	-CH <sub>2</sub> CN	436
2161	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	483
2162	-H	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	483
2163	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	443
2164	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	468
2165	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	471
2166	-H	-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	461
2167	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>	512

(465)

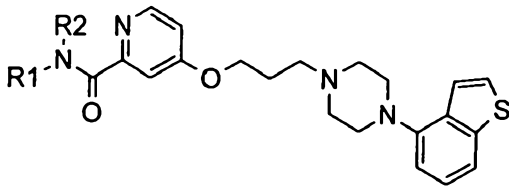
[表223]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2168	-CH <sub>3</sub>	H <sub>3</sub> C-N<img alt="piperidine ring" data-bbox="445 285 515 315"/>	508
2169	-H	<img alt="1-phenylpropan-2-yl group" data-bbox="415 325 505 370"/>	515
2170	-H	<img alt="1-(2-chlorophenyl)ethyl group" data-bbox="415 380 500 415"/>	521
2171	-H	<img alt="1-(3-chlorophenyl)ethyl group" data-bbox="400 425 510 460"/>	521
2172	-H	<img alt="1-(4-chlorophenyl)ethyl group" data-bbox="400 470 510 505"/>	521
2173	-H	<img alt="1-(2-pyridyl)ethyl group" data-bbox="415 515 495 550"/>	488
2174	-H	<img alt="1-(3-pyridyl)ethyl group" data-bbox="410 560 495 595"/>	488
2175	-H	<img alt="1-(4-pyridyl)ethyl group" data-bbox="410 605 495 640"/>	488
2176	-H	<img alt="1-(2-furyl)ethyl group" data-bbox="415 650 495 685"/>	477
2177	-CH <sub>3</sub>	H <sub>3</sub> C-C(=O)-N<img alt="piperidine ring" data-bbox="445 695 515 725"/>	536

(466)

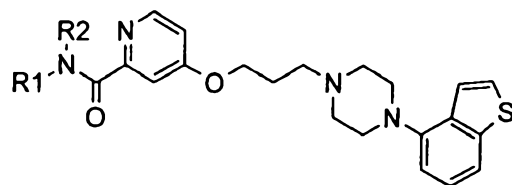
[表224]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2178	-CH <sub>3</sub>		531
2179	-H		451
2180	-H		517
2181	-H		517
2182	-H		555
2183	-H		571
2184	-H		531
2185	-H		552
2186	-H		495
2187	-H		505

(467)

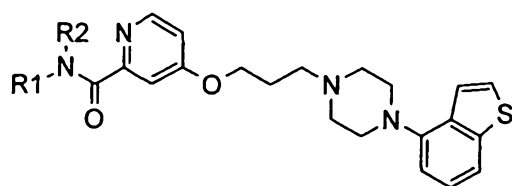
[表225]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2188	-H		547
2189	-H		501
2190	-H		505
2191	-H		496
2192	-H		544
2193	-H		481
2194	-H		468
2195	-H		517
2196	-H		508

(468)

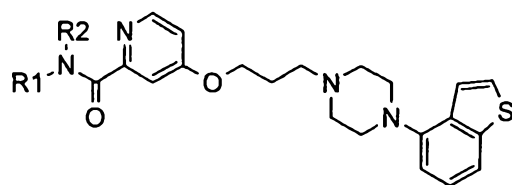
[表226]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2197	-H		508
2198	-H		494
2199	-H		510
2200	-H		453
2201	-H		467
2202	-H		555
2203	-H		537
2204	-H		527
2205	-H		527
2206	-H		493

(469)

[表227]

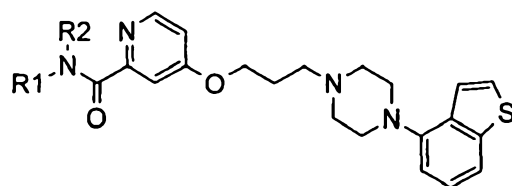


實例	R1	R2	MS(M+1)
2207	-H		556
2208	-H		555
2209	-H		555
2210	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		479
2211	-H		522
2212	-H		481
2213	-H		503
2214	-H		483
2215	-H		497



(470)

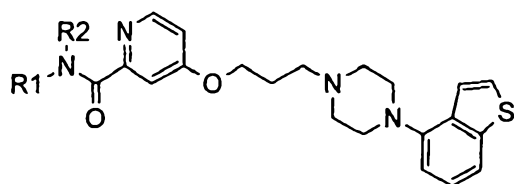
[表228]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2216	-H		491
2217	-H		491
2218	-H		490
2219	-H		519
2220	-H		505
2221	-H		505
2222	-H		507
2223	-H		493

(471)

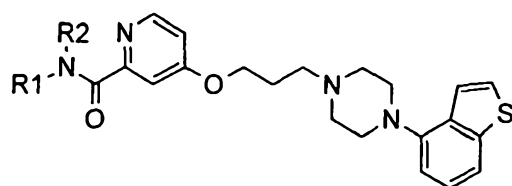
[表229]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2224	-H		477
2225	-H		494
2226	-H		529
2227	-H		451
2228	-H		495
2229	-H		505
2230	-H		519
2231	-H		519
2232	-H		519

(472)

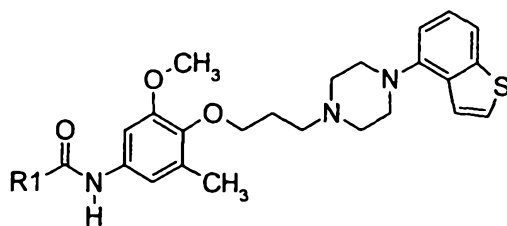
[表230]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2233	-H		537
2234	-H		543
2235	-H		513
2236	-H		513
2237	-H		502
2238	-H		506

(473)

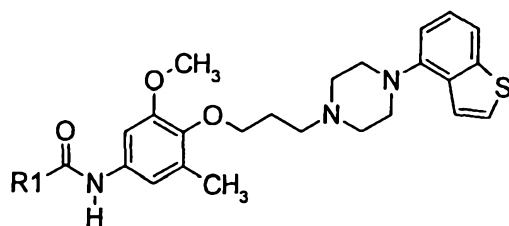
[表231]



實例	R1	MS(M+1)
2239	-2-PYRIDYL	517
2240	-3-PYRIDYL	517
2241	-4-PYRIDYL	517
2242	-2-FURYL	506
2243	-2-THIENYL	522
2244	-3-FURYL	506
2245	-3-THIENYL	522
2246	-CH <sub>3</sub>	454
2247	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	468
2248	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	482
2249	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	482
2250	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	480
2251	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	508
2252	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	522
2253	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	494
2254	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	536
2255	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	484
2256	-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	497
2257	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	525
2258	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	539
2259	-CH <sub>2</sub> NHCHO	497
2260	-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH) <sub>2</sub>	557
2261	-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	583
2262	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> NHCO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	597
2263	-CH <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>	483
2264	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> NH <sub>2</sub>	497
2265	-CH <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>	511

(474)

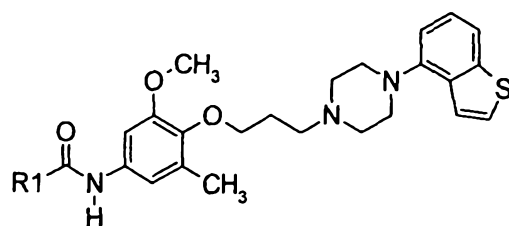
[表232]



實例	R1	MS(M+1)
2266		547
2267		551
2268		585
2269		563
2270		551
2271		533
2272		567
2273		551
2274		505

(475)

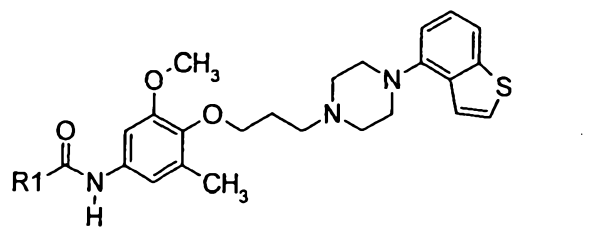
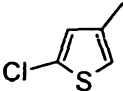
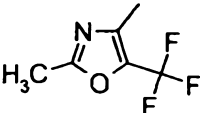
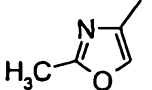
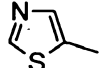
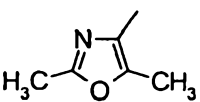
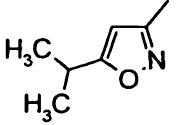
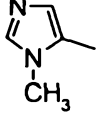
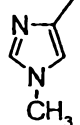
[表233]



實例	R1	MS(M+1)
2275		556
2276		551
2277		519
2278		535
2279		518
2280		532
2281		523
2282		534
2283		590

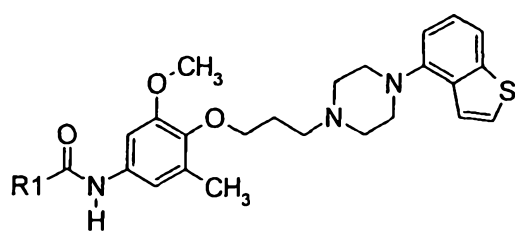
(476)

[表234]

		
實例	R1	MS(M+1)
2284		556
2285		589
2286		521
2287		523
2288		535
2289		549
2290		520
2291		520

(477)

[表235]

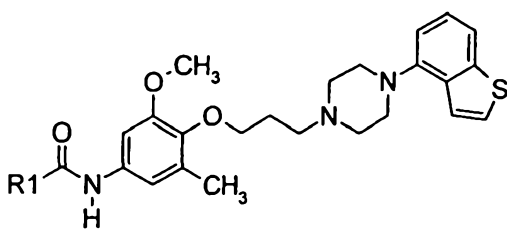
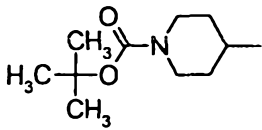
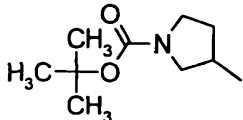
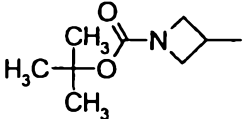
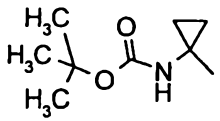
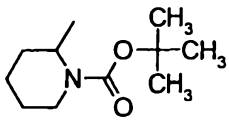
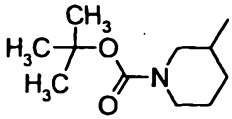
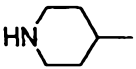
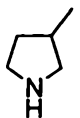
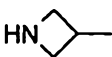


實例	R1	MS(M+1)
2292		520
2293		521
2294		521
2295		565
2296		579
2297		523
2298		541
2299		510
2300		524



(478)

[表236]

		
實例	R1	MS(M+1)
2301		623
2302		609
2303		595
2304		595
2305		623
2306		623
2307		523
2308		509
2309		495

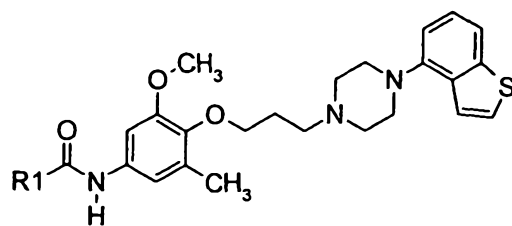
(479)

[表237]

實例	R1	MS(M+1)
2310		495
2311		523
2312		523

(480)

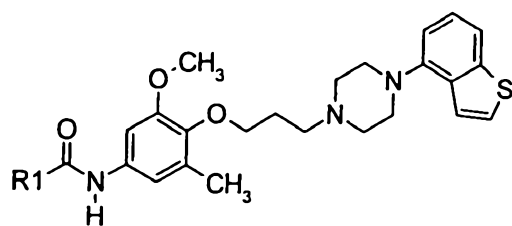
[表238]



實例	R1	MS(M+1)
2313		545
2314		531
2315		531
2316		531
2317		536
2318		536
2319		522
2320		551
2321		543

(481)

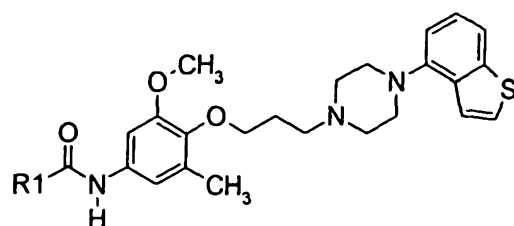
[表239]



實例	R1	MS(M+1)
2322		543
2323		563
2324		543
2325		556
2326		551
2327		532
2328		582
2329		520
2330		522

(482)

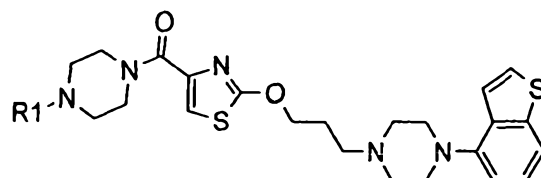
[表240]



實例	R1	MS(M+1)
2331		538
2332		532
2333		637
2334		651
2335		673
2336		537
2337		551
2338		573

(483)

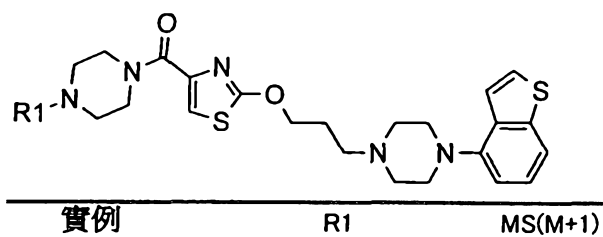
[表241]



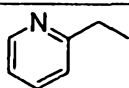
實例	R1	MS(M+1)
2339	-2-PYRIDYL	549
2340	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	528
2341	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	514
2342	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	543
2343	-4-PYRIDYL	549
2344	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	548
2345	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	514
2346	-CH <sub>3</sub>	486
2347	-3-PYRIDYL	549
2348	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	556
2349	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	500
2350	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	516
2351	-COCH <sub>3</sub>	514
2352	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	554
2353	-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	564

(484)

[表242]

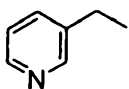


2354



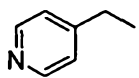
563

2355



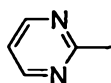
563

2356



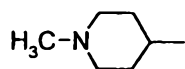
563

2357



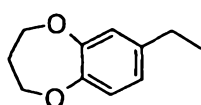
550

2358



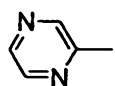
569

2359



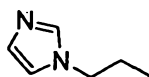
634

2360



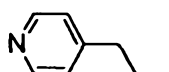
550

2361



566

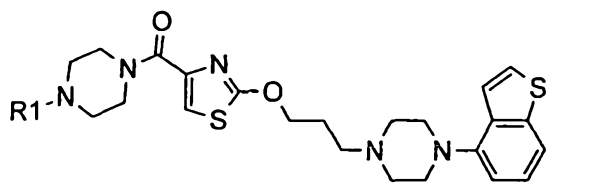
2362

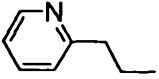
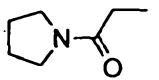
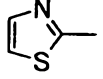
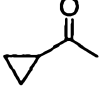


577

(485)

[表243]

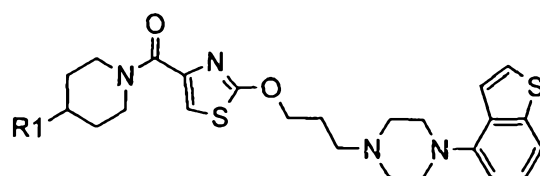


實例	R1	MS(M+1)
2363		577
2364		583
2365		555
2366		540



(486)

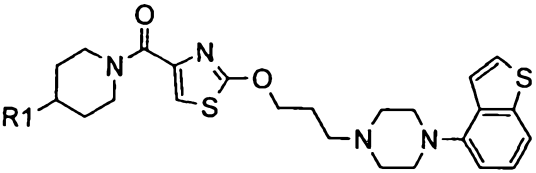
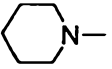
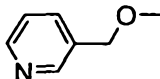
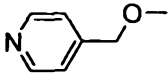
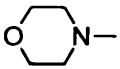
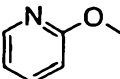
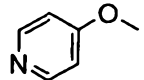
[表244]



實例	R1	MS(M+1)
2367	-OCH <sub>3</sub>	501
2368	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	553
2369	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	547
2370	-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	577
2371	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	563
2372	-OH	487
2373	-CONH <sub>2</sub>	514
2374	-CH <sub>2</sub> OH	501
2375	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	499
2376	-NHCOCH <sub>3</sub>	528
2377	-COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	575
2378	-2-PYRIDYL	548

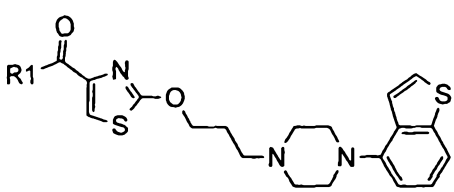
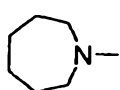
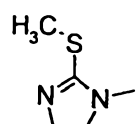
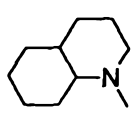
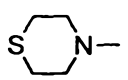
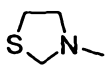
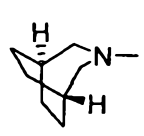

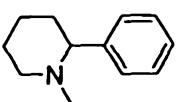
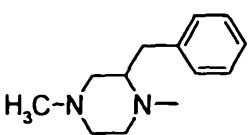
(487)

[表245]

		
實例	R1	MS(M+1)
2379		554
2380		578
2381		578
2382		556
2383		564
2384		564

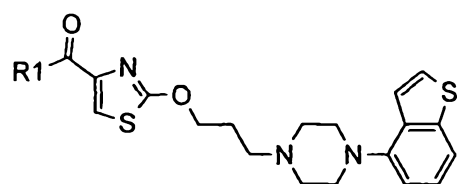
(488)

[表246]

		
實例	R1	MS(M+1)
2385		485
2386		502
2387		525
2388		489
2389		475
2390		511
2391		539
2392		547
2393		576

(489)

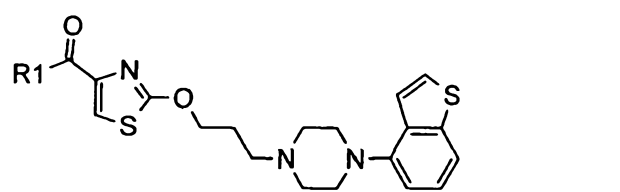
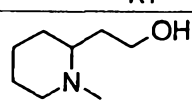
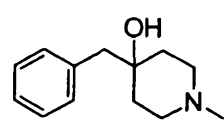
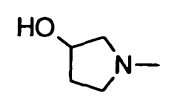
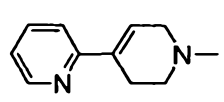
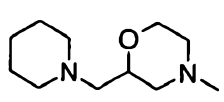
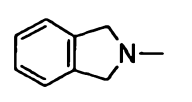
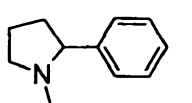
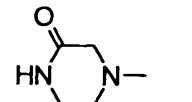
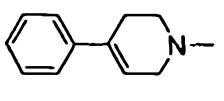
[表247]



實例	R1	MS(M+1)
2394		519
2395		563
2396		558
2397		519
2398		505
2399		500
2400		548
2401		563
2402		487

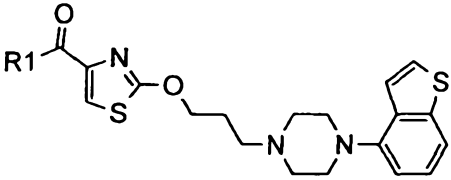
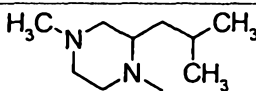
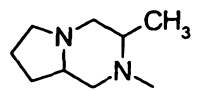
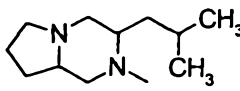
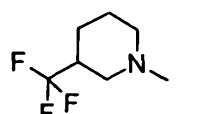
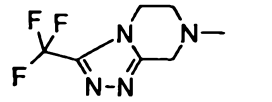
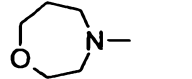
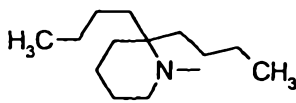
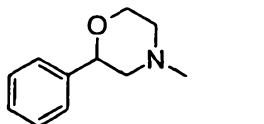
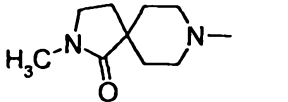
(490)

[表248]

		
實例	R1	MS(M+1)
2403		515
2404		577
2405		473
2406		546
2407		570
2408		505
2409		533
2410		486
2411		545

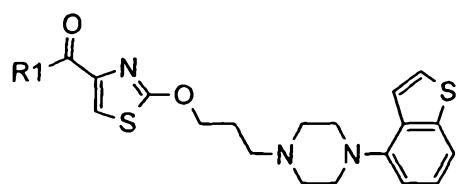
(491)

[表249]

		
實例	R1	MS(M+1)
2412		542
2413		526
2414		568
2415		539
2416		578
2417		487
2418		583
2419		549
2420		554

(492)

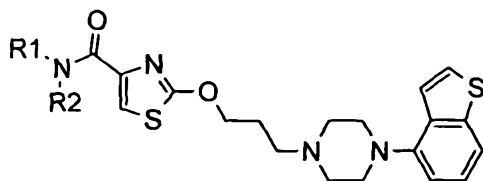
[表250]



實例	R1	MS(M+1)
2421		548
2422		546
2423		553
2424		561
2425		526
2426		443

(493)

[表251]

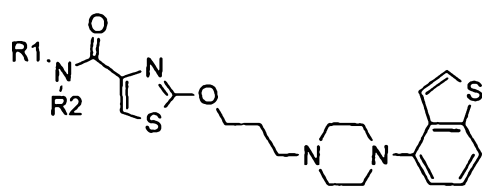


實例	R1	R2	MS(M+1)
2427	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-CH <sub>3</sub>	499
2428	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	485
2429	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	445
2430	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	515
2431	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	515
2432	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	491
2433	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	475
2434	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	571
2435	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	488
2436	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	529
2437	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	519
2438	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	573
2439	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	530
2440	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	511
2441	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	459
2442	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	459
2443	-H	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	443
2444	-H	-cyclo-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	499
2445	-H	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	493
2446	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	563
2447	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	564
2448	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	575
2449	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	521
2450	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	507
2451	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	564
2452	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	563



(494)

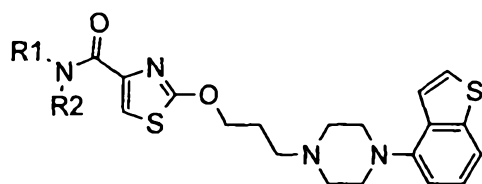
[表252]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2453	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	583
2454	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	521
2455	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	535
2456	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	546
2457	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	537
2458	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	513
2459	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	473
2460	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	431
2461	-H	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	459
2462	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	461
2463	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	487
2464	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	475
2465	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	489
2466	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	569
2467	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	507
2468	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	561
2469	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	532
2470	-2-PYRIDYL	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	508
2471	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	479
2472	-H	-3-PYRIDYL	480
2473	-H	-2-PYRIDYL	480
2474	-H	-4-PYRIDYL	480
2475	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	493
2476	-H	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	499
2477	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	521
2478	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>	488
2479	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> OH	489

(495)

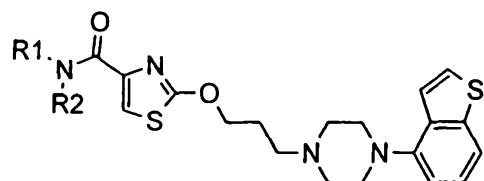
[表253]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2480	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	507
2481	-H	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	460
2482	-H	-CH <sub>2</sub> CCH	441
2483	-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	-CH <sub>3</sub>	487
2484	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	473
2485	-H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	473
2486	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	474
2487	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OH	551
2488	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	471
2489	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	485
2490	-H	-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	500
2491	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	431
2492	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	503
2493	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	487
2494	-H	-CH <sub>2</sub> CN	442
2495	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	475
2496	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	489
2497	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	456
2498	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	474
2499	-H	-(CH <sub>2</sub> )SCH <sub>3</sub>	477
2500	-H	-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	467
2501	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	447
2502	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	487
2503	-CH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	502
2504	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	551
2505	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCONH <sub>2</sub>	489

(496)

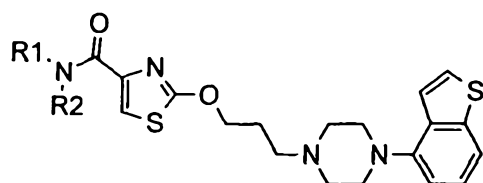
[表254]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2506		-CH <sub>3</sub>	522
2507		-CH <sub>3</sub>	514
2508		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	529
2509		-H	494
2510		-H	494
2511		-H	494
2512		-H	483
2513		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	536
2514		-CH <sub>3</sub>	542
2515		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	547

(497)

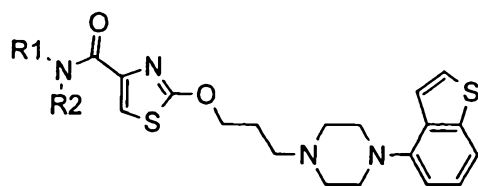
[表255]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2516		-CH <sub>3</sub>	564
2517		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	522
2518		-H	457
2519		-H	485
2520		-CH <sub>3</sub>	507
2521		-H	509
2522		-H	521
2523		-H	529
2524		-H	544
2525		-H	519

(498)

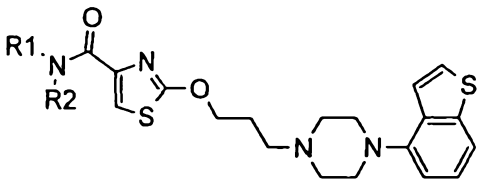
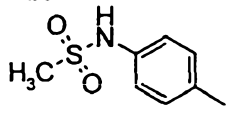
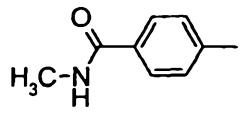
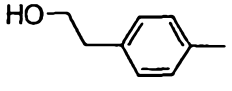
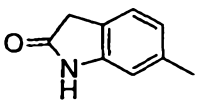
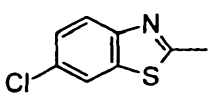
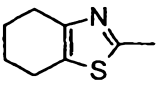
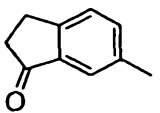
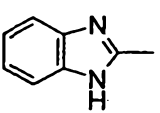
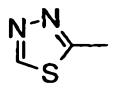
[表256]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2526		-H	530
2527		-H	530
2528		-H	571
2529		-H	518
2530		-H	558
2531		-H	486
2532		-H	552
2533		-H	471
2534		-H	562

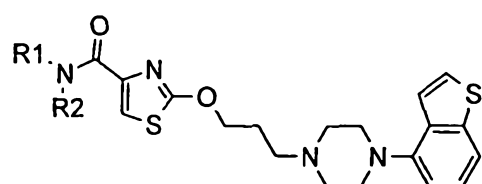
(499)

[表257]

				
實例	R1	R2	MS(M+1)	
2535		-H	572	
2536		-H	536	
2537		-H	523	
2538		-H	534	
2539		-H	570	
2540		-H	540	
2541		-H	533	
2542		-H	519	
2543		-H	487	

(500)

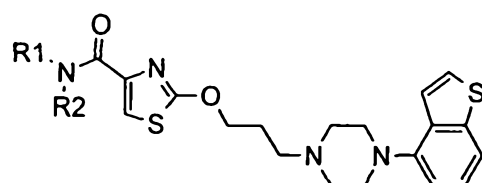
[表258]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2544		-H	497
2545		-H	501
2546		-H	545
2547		-H	535
2548		-H	545
2549		-H	546
2550		-H	530
2551		-H	483

(501)

[表259]

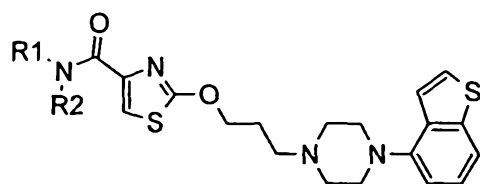


實例	R1	R2	MS(M+1)
2552		-H	562
2553		-H	532
2554		-H	545
2555		-H	560
2556		-H	559
2557		-H	559
2558		-H	546
2559		-H	511
2560		-H	530



(502)

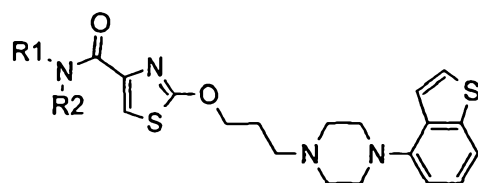
[表260]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2561		-H	508
2562		-H	514
2563		-H	514
2564		-H	500
2565		-H	514
2566		-H	516
2567		-H	530
2568		-H	561
2569		-H	543
2570		-H	546

(503)

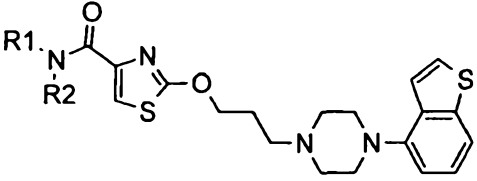
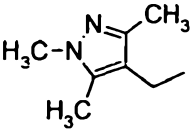
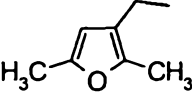
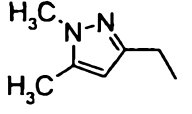
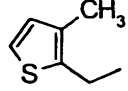
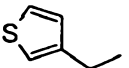
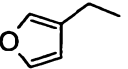
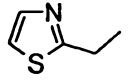
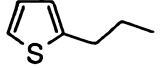
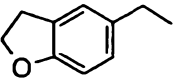
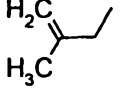
[表261]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2571		-H	533
2572		-H	499
2573		-H	528
2574		-H	487
2575		-H	509
2576		-H	508
2577		-H	508
2578		-H	497
2579		-H	497
2580		-H	496

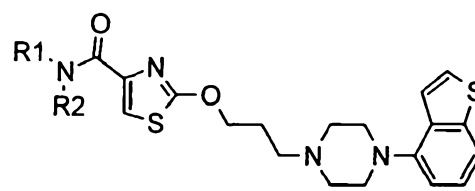
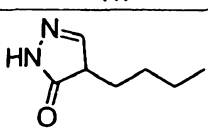
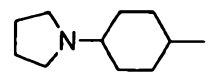
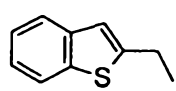
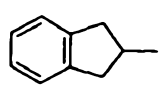
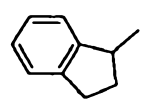
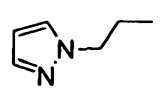
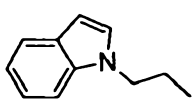
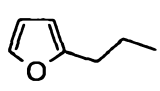
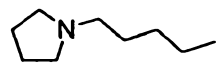
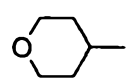
(504)

[表262]

				
實例	R1	R2	MS(M+1)	
2581		-H	525	
2582		-H	511	
2583		-H	511	
2584		-H	513	
2585		-H	499	
2586		-H	483	
2587		-H	500	
2588		-H	513	
2589		-H	535	
2590		-H	457	

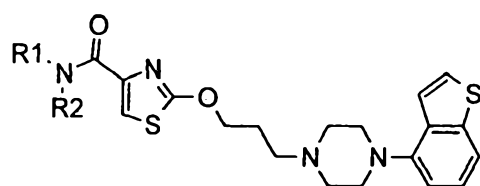
(505)

[表263]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2591		-H	527
2592		-H	554
2593		-H	549
2594		-H	519
2595		-H	519
2596		-H	497
2597		-H	546
2598		-H	497
2599		-H	528
2600		-H	487

(506)

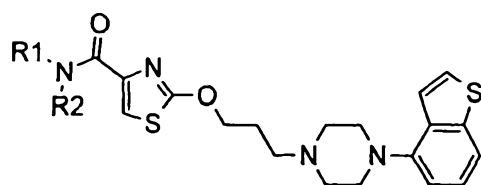
[表264]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2601		-H	575
2602		-CH <sub>3</sub>	511
2603		-CH <sub>3</sub>	525
2604		-CH <sub>3</sub>	557
2605		-CH <sub>3</sub>	528
2606		-CH <sub>3</sub>	544
2607		-H	547
2608		-CH <sub>3</sub>	526
2609		-CH <sub>3</sub>	564

(507)

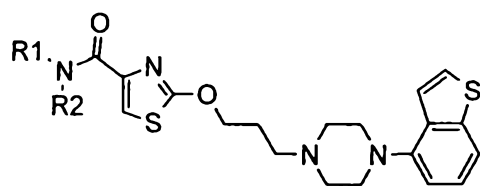
[表265]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2610		-CH <sub>3</sub>	574
2611		-CH <sub>3</sub>	547
2612		-H	511
2613		-CH <sub>3</sub>	561
2614		-CH <sub>3</sub>	564
2615		-H	512
2616		-H	515
2617		-CH <sub>3</sub>	560
2618		-H	566

(508)

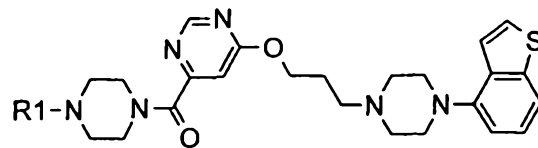
[表266]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2619		-H	573
2620		-CH <sub>3</sub>	571
2621		-CH <sub>3</sub>	584
2622		-CH <sub>3</sub>	587
2623		-H	560
2624		-H	547
2625		-H	549

(509)

[表267]

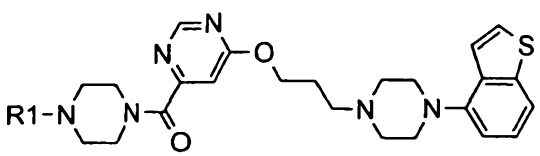
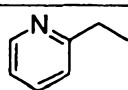
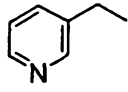
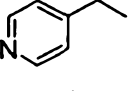
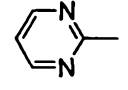
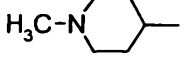
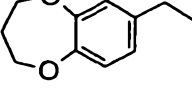
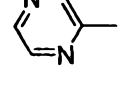
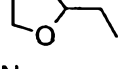
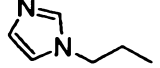


實例	R1	MS(M+1)
2626	-2-PYRIDYL	544
2627	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	523
2628	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	509
2629	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	538
2630	-4-PYRIDYL	544
2631	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	543
2632	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	509
2633	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	525
2634	-CH <sub>3</sub>	481
2635	-3-PYRIDYL	544
2636	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	551
2637	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	495
2638	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	511
2639	-COCH <sub>3</sub>	509
2640	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	549
2641	-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	559



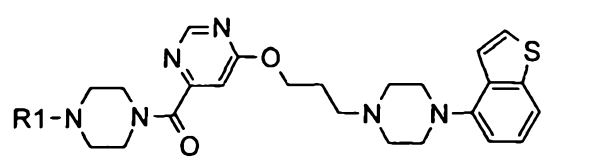
(510)

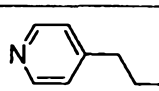
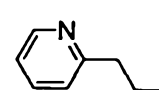
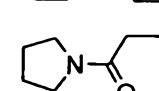
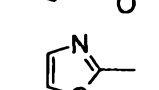
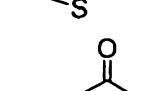
[表268]

		
實例	R1	MS(M+1)
2642		558
2643		558
2644		558
2645		545
2646		564
2647		629
2648		545
2649		551
2650		561

(511)

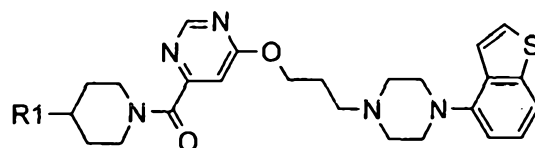
[表269]



實例	R1	MS(M+1)
2651		572
2652		572
2653		578
2654		550
2655		535

(512)

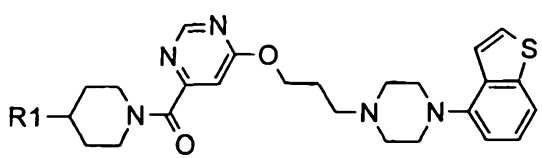
[表270]

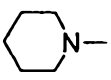
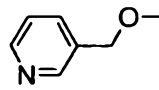
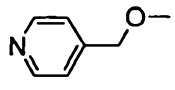
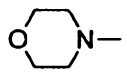
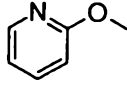
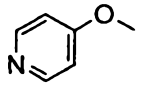


實例	R1	MS(M+1)
2656	-OCH <sub>3</sub>	496
2657	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	548
2658	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	542
2659	-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	572
2660	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	558
2661	-OH	482
2662	-CONH <sub>2</sub>	509
2663	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	494
2664	-NHCOCH <sub>3</sub>	523
2665	-COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	570
2666	-2-PYRIDYL	543

(513)

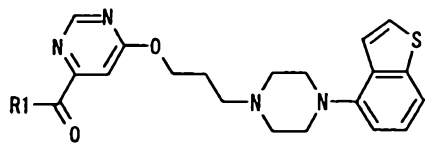
[表271]



實例	R1	MS(M+1)
2667		549
2668		573
2669		573
2670		551
2671		559
2672		559

(514)

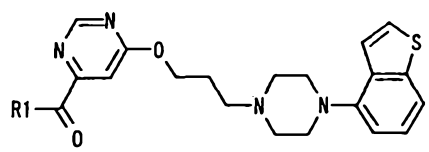
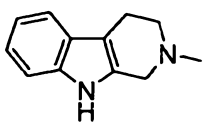
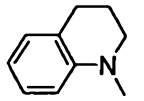
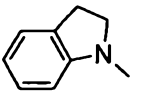
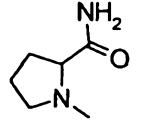
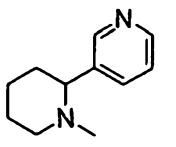
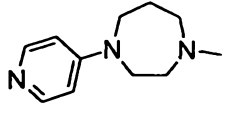
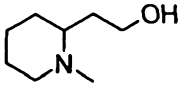
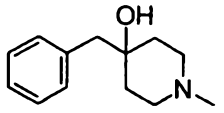
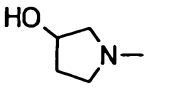
[表272]



實例	R1	MS(M+1)
2673		480
2674		520
2675		484
2676		470
2677		506
2678		534
2679		542
2680		571
2681		514
2682		558

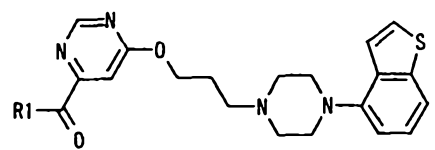
(515)

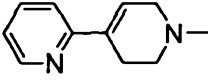
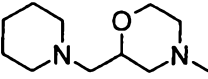
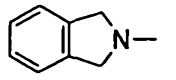
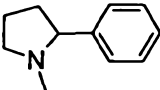
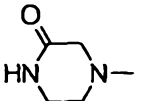
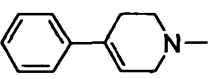
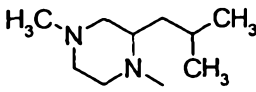
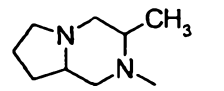
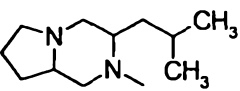
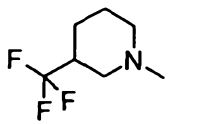
[表273]

		
實例	R1	MS(M+1)
2683		553
2684		514
2685		500
2686		495
2687		543
2688		558
2689		510
2690		572
2691		468

(516)

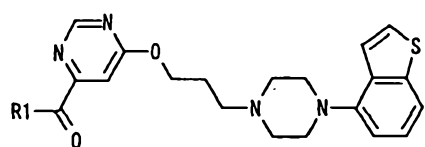
[表274]



實例	R1	MS(M+1)
2692		541
2693		565
2694		500
2695		528
2696		481
2697		540
2698		537
2699		521
2700		563
2701		534

(517)

[表275]

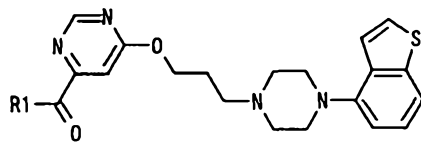


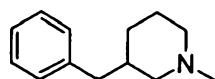
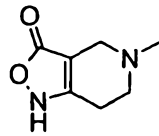

實例	R1	MS(M+1)
2702		573
2703		482
2704		578
2705		544
2706		549
2707		543
2708		541
2709		548



(518)

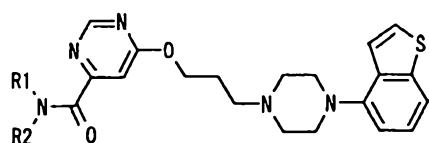
[表276]



實例	R1	MS(M+1)
2710		556
2711		521
2712		438

(519)

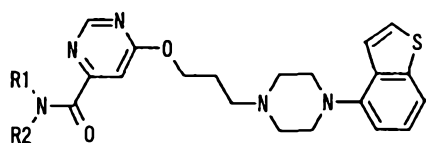
[表277]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2713	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-CH <sub>3</sub>	494
2714	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	440
2715	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	510
2716	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	510
2717	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	486
2718	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	566
2719	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	483
2720	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	514
2721	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	568
2722	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	525
2723	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	506
2724	-H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	454
2725	-H	-cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	438
2726	-H	-cyclo-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	494
2727	-H	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	488
2728	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	558
2729	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	559
2730	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	570
2731	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	516
2732	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	502
2733	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	559
2734	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	558
2735	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	578
2736	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	516
2737	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	530
2738	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	541
2739	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	532
2740	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	508

(520)

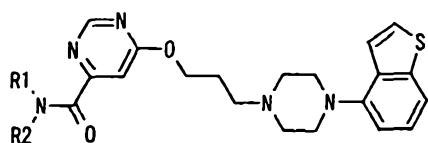
[表278]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2741	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	468
2742	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	426
2743	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	440
2744	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	456
2745	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	522
2746	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	482
2747	-H	-1-CH <sub>3</sub> -CYCLOHEXYL	494
2748	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	518
2749	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	564
2750	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	518
2751	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	502
2752	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	527
2753	-2-PYRIDYL	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	503
2754	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	474
2755	-H	-3-PYRIDYL	475
2756	-H	-2-PYRIDYL	475
2757	-H	-4-PYRIDYL	475
2758	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	488
2759	-H	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	494
2760	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	516
2761	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	502
2762	-H	-CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	455
2763	-H	-CH <sub>2</sub> CCH	436
2764	-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	-CH <sub>3</sub>	482
2765	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	454
2766	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	468
2767	-H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	468
2768	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	469

(521)

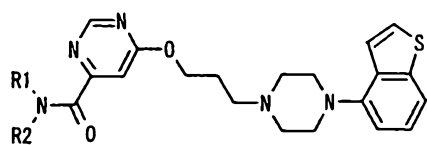
[表279]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2769	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OH	546
2770	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	466
2771	-H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	480
2772	-H	-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	495
2773	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	426
2774	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	498
2775	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	482
2776	-H	-CH <sub>2</sub> CN	437
2777	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	470
2778	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	484
2779	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	451
2780	-H	-CH <sub>2</sub> CONHCH <sub>3</sub>	469
2781	-H	-(CH <sub>2</sub> )SCH <sub>3</sub>	472
2782	-H	-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	462
2783	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	482
2784	-CH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	497
2785	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	546
2786	-H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHCONH <sub>2</sub>	484

(522)

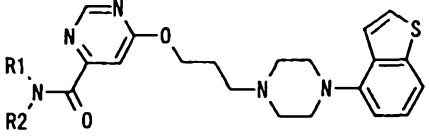
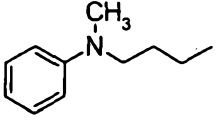
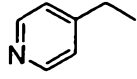
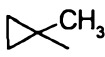
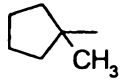
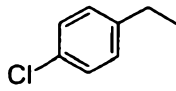
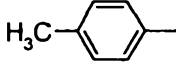
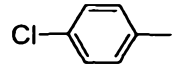
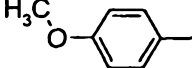
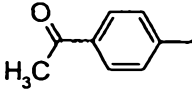
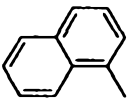
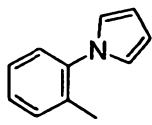
[表280]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2787		-CH <sub>3</sub>	517
2788		-CH <sub>3</sub>	509
2789		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	524
2790		-H	489
2791		-H	489
2792		-H	489
2793		-H	478
2794		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	531
2795		-CH <sub>3</sub>	537
2796		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	542

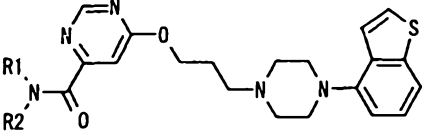
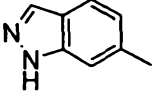
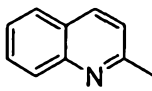
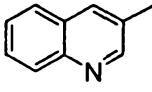
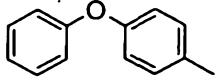
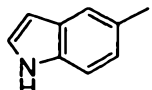
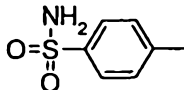
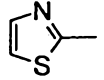
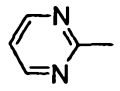
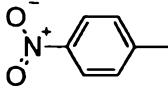
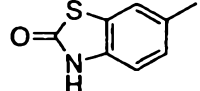
(523)

[表281]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2797		-CH <sub>3</sub>	559
2798		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	517
2799		-H	452
2800		-H	480
2801		-CH <sub>3</sub>	536
2802		-CH <sub>3</sub>	502
2803		-H	508
2804		-H	504
2805		-H	516
2806		-H	524
2807		-H	539

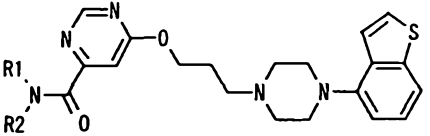
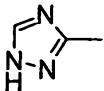
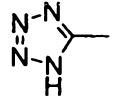
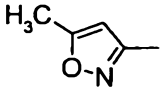
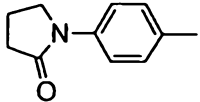
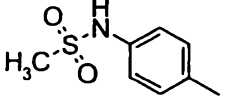
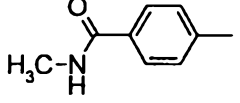
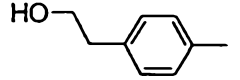
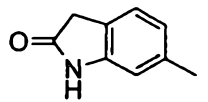
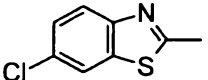
(524)

[表282]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2808		-H	514
2809		-H	525
2810		-H	525
2811		-H	566
2812		-H	513
2813		-H	553
2814		-H	481
2815		-H	476
2816		-H	519
2817		-H	547

(525)

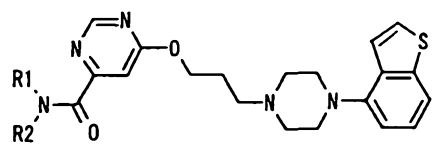
[表283]

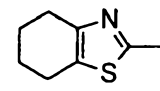
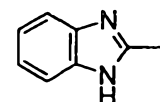
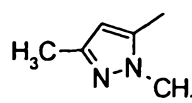
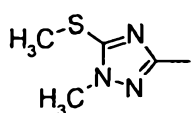
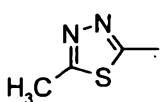
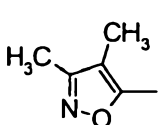
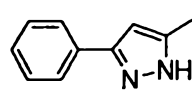
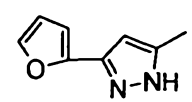
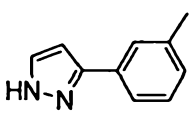
			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2818		-H	465
2819		-H	466
2820		-H	479
2821		-H	557
2822		-H	567
2823		-H	531
2824		-H	518
2825		-H	529
2826		-H	565



(526)

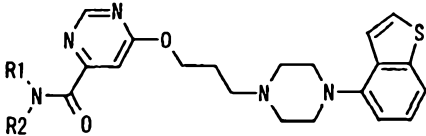
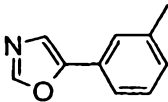
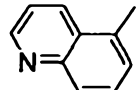
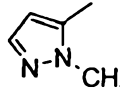
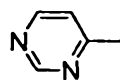
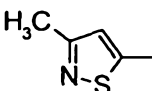
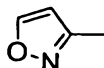
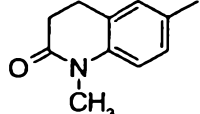
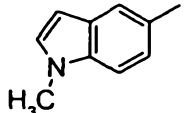
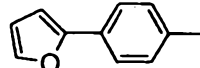
[表284]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2827		-H	535
2828		-H	514
2829		-H	492
2830		-H	525
2831		-H	496
2832		-H	493
2833		-H	540
2834		-H	530
2835		-H	540

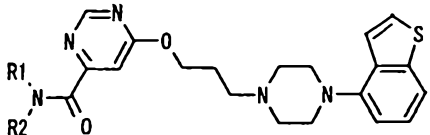
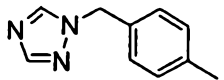
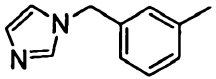
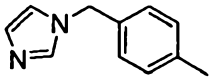
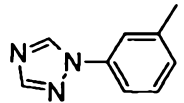
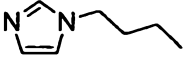
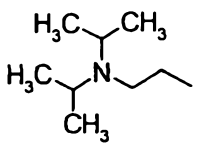
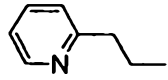
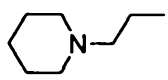
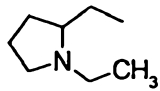
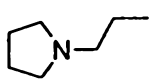
(527)

[表285]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2836		-H	541
2837		-H	525
2838		-H	478
2839		-H	476
2840		-H	495
2841		-H	465
2842		-H	557
2843		-H	527
2844		-H	540

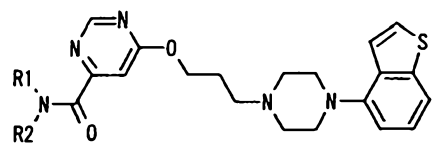
(528)

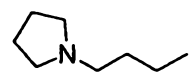
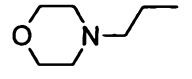
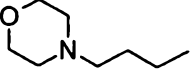
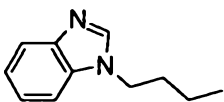
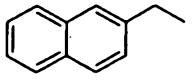
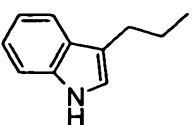
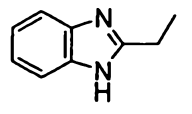
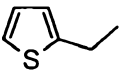
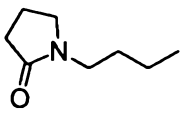
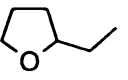
[表286]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2845		-H	555
2846		-H	554
2847		-H	554
2848		-H	541
2849		-H	506
2850		-H	525
2851		-H	503
2852		-H	509
2853		-H	509
2854		-H	495

(529)

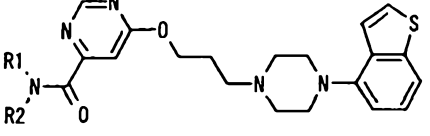
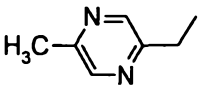
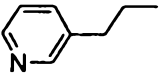
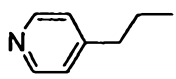
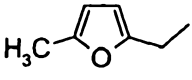
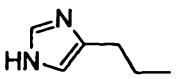
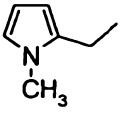
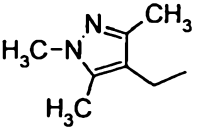
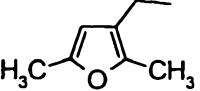
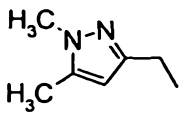
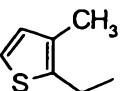
[表287]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2855		-H	509
2856		-H	511
2857		-H	525
2858		-H	556
2859		-H	538
2860		-H	541
2861		-H	528
2862		-H	494
2863		-H	523
2864		-H	482

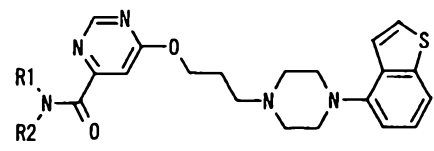
(530)

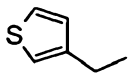
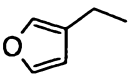
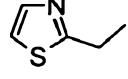
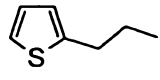
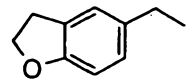
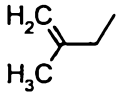
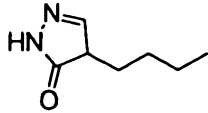
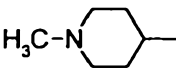
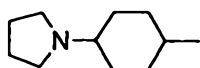
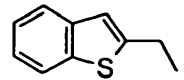
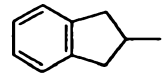
[表288]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2865		-H	504
2866		-H	503
2867		-H	503
2868		-H	492
2869		-H	492
2870		-H	491
2871		-H	520
2872		-H	506
2873		-H	506
2874		-H	508

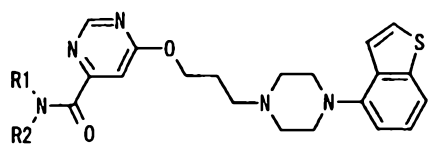
(531)

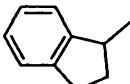
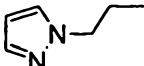
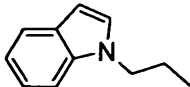
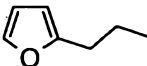
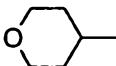
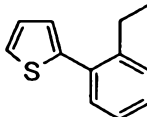
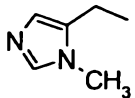
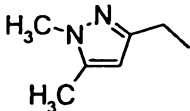
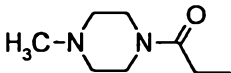
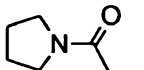
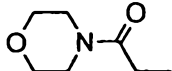
[表289]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2875		-H	494
2876		-H	478
2877		-H	495
2878		-H	508
2879		-H	530
2880		-H	452
2881		-H	522
2882		-H	495
2883		-H	549
2884		-H	544
2885		-H	514

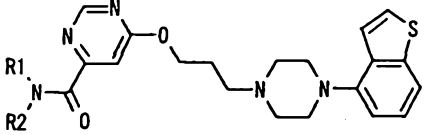
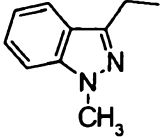
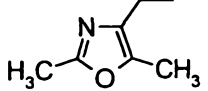
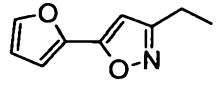
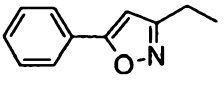
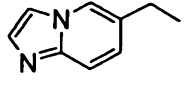
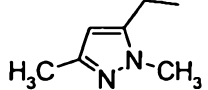
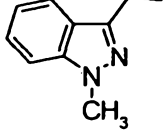
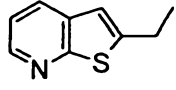
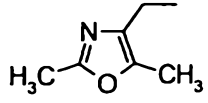
[表290]



實例	R1	R2	MS(M+1)
2886		-H	514
2887		-H	492
2888		-H	541
2889		-H	492
2890		-H	482
2891		-H	570
2892		-CH <sub>3</sub>	506
2893		-CH <sub>3</sub>	520
2894		-CH <sub>3</sub>	552
2895		-CH <sub>3</sub>	523
2896		-CH <sub>3</sub>	539

(533)

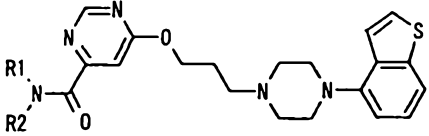
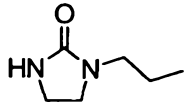
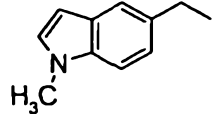
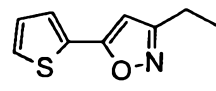
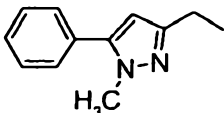
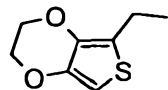
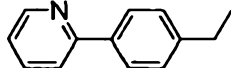
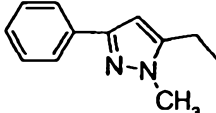
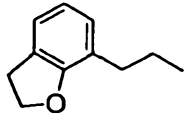
[表291]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2897		-H	542
2898		-CH <sub>3</sub>	521
2899		-CH <sub>3</sub>	559
2900		-CH <sub>3</sub>	569
2901		-CH <sub>3</sub>	542
2902		-H	506
2903		-CH <sub>3</sub>	556
2904		-CH <sub>3</sub>	559
2905		-H	507

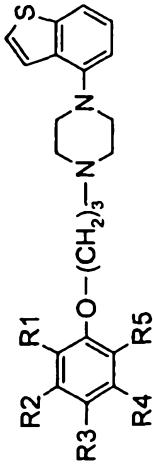


(534)

[表292]

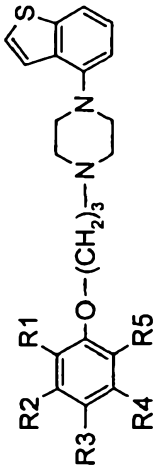
			
實例	R1	R2	MS(M+1)
2906		-H	510
2907		-CH <sub>3</sub>	555
2908		-H	561
2909		-H	568
2910		-CH <sub>3</sub>	566
2911		-CH <sub>3</sub>	579
2912		-CH <sub>3</sub>	582
2913		-H	544

[表293]



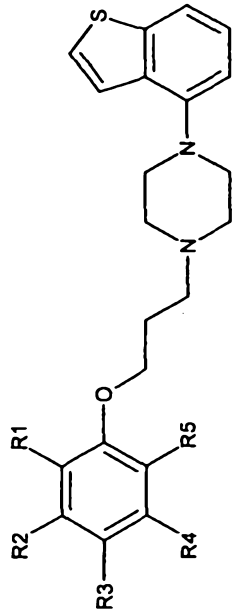
實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2914	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	230.0 (分解)	氫氨酸鹽
2915	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>			
2916	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	235.0 (分解)	氫氨酸鹽
2917	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	227.0 (分解)	氫氨酸鹽
2918	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	240.0 (分解)	氫氨酸鹽
2919	-OCH <sub>3</sub>	-H		-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	211.0-213.5	氫氨酸鹽

[表294]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2920	-OCH <sub>3</sub>	-H	<p>Chemical structure: A morpholine ring with a methyl group (-CH<sub>3</sub>) at the 3-position and a carbonyl group (-C(=O)-) at the 4-position.</p>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	207.5-210.0	氫氨酸鹽
2921	-OCH <sub>3</sub>	-H	<p>Chemical structure: A morpholine ring with a methyl group (-CH<sub>3</sub>) at the 3-position and a carbonyl group (-C(=O)-) at the 4-position.</p>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	247.0 (分解)	—
2922	-CH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	白色粉末 (乙醇)	178.5-179.5	氫氨酸鹽
2923	-OCH <sub>3</sub>	-H	<p>Chemical structure: A morpholine ring with a methyl group (-CH<sub>3</sub>) at the 3-position and a carbonyl group (-C(=O)-) at the 4-position.</p>	-H	-CH <sub>3</sub>			氫氨酸鹽
2924	-OCH <sub>3</sub>	-H	<p>Chemical structure: A morpholine ring with a methyl group (-CH<sub>3</sub>) at the 3-position and a carbonyl group (-C(=O)-) at the 4-position.</p>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙酸乙酯)	248.5-257.5	氫氨酸鹽

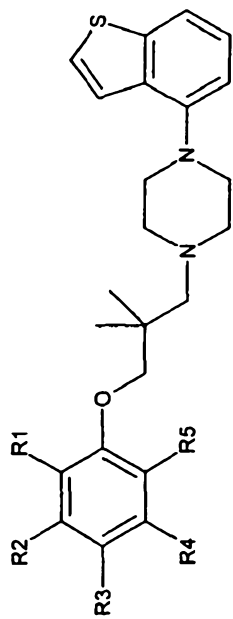
[表295]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
2925	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm : 1.36-1.65(4H, m), 1.88-2.11 (3H, m), 2.25(3H, s), 2.47(3H, s), 2.60-2.82(8H, m), 3.12-3.29(4H, m), 3.47-3.63(2H, m), 3.82(3H, s), 3.93( 2H, t, J=6.4Hz ), 6.34(1H, d, J=2.7Hz), 6.40(1H, d, J=2.7Hz), 6.90(1H, d, J=7.1Hz), 7.21-7.34(1H, m), 7.40 ( 2H, dd, J=5.5Hz, 9.9Hz ), 7.55(1H, d, J=8.0Hz). <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm : 1.48(9H, s), 1.67-1.92(4H, m), 1.95-2.11 (2H, m ), 2.25(3H, s), 2.61-2.87(12H, m), 3.11-3.28(4H, m), 3.54-3.70(2H, m), 3.83(3H, s), 3.94( 2H, t, J=6.3Hz ), 6.34(1H, d, J=2.6Hz), 6.39(1H, d, J=2.6Hz); 6.90(1H, d, J=6.9Hz), 7.17-7.34(1H, m), 7.35-7.47 ( 2H, m ), 7.55(1H, d, J=8.0Hz).
2926	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm : 1.96-2.11(2H, m), 2.27(3H, s), 2.57(4H, t, J=6.0Hz), 2.64-2.84(6H, m), 3.13-3.27(14H, m), 3.51(4H, t, J=6.0Hz), 3.84(3H, s), 3.96( 2H, t, J=6.4Hz ), 6.38(1H, d, J=2.7Hz), 6.20(1H, d, J=2.7Hz), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.21-7.32(1H, m), 7.40 ( 2H, dd, J=5.5Hz, 10.0Hz ), 7.55(1H, d, J=8.1Hz). <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm : 1.83-1.95 (4H, m ), 1.95-2.10(2H, m), 2.25(3H, s), 2.61-2.81(6H, m), 3.07-3.28(14H, m), 3.82(3H, s), 3.93( 2H, t, J=6.5Hz ), 6.30-6.43(2H, m), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.29-7.34(1H, m), 7.41 ( 2H, dd, J=6.0Hz, 10.0Hz ), 7.55(1H, d, J=7.9Hz).
2927	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm : 1.83-1.95 (4H, m ), 1.95-2.10(2H, m), 2.25(3H, s), 2.61-2.81(6H, m), 3.07-3.28(14H, m), 3.82(3H, s), 3.93( 2H, t, J=6.5Hz ), 6.30-6.43(2H, m), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.29-7.34(1H, m), 7.41 ( 2H, dd, J=6.0Hz, 10.0Hz ), 7.55(1H, d, J=7.9Hz).
2928	-CH <sub>3</sub>	-H		-H	-OCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm : 1.83-1.95 (4H, m ), 1.95-2.10(2H, m), 2.25(3H, s), 2.61-2.81(6H, m), 3.07-3.28(14H, m), 3.82(3H, s), 3.93( 2H, t, J=6.5Hz ), 6.30-6.43(2H, m), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.29-7.34(1H, m), 7.41 ( 2H, dd, J=6.0Hz, 10.0Hz ), 7.55(1H, d, J=7.9Hz).

(538)

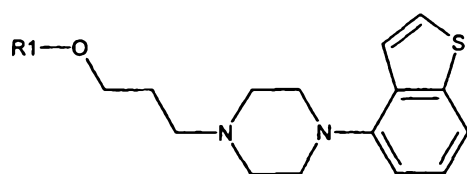
[表296]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2929	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CONH <sub>2</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (乙醇)	189.0-192.5	氫氨酸鹽
2930	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CONHCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	白色粉末 (異丙醇/水)	165.5-167.0	—

(539)

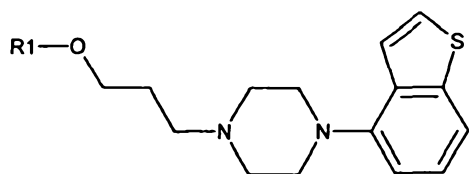
[表297]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2931		白色粉末 (乙酸乙酯/甲醇)	214-217	氫氨酸鹽
2932		白色粉末 (乙酸乙酯/甲醇)	218-222	1/2富馬酸鹽
2933		無色針形結晶 (乙醇)	195-196	—
2934		白色粉末 (乙酸乙酯)	145-146	—
2935		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	219-221	二氫氨酸鹽
2936		白色粉末 (乙酸乙酯)	162-164	—
2937		白色粉末 (乙醇/乙醚)	208.5-209.5	二氫氨酸鹽
2938		白色粉末 (正己烷/乙酸乙酯)	137-139	—
2939		白色粉末 (乙醇)	137-139	—
2940		白色粉末 (乙酸乙酯)	163-165	—
2941		白色粉末 (乙酸乙酯)	196-199	—

(540)

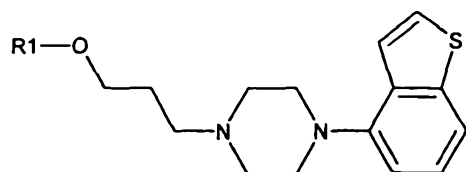
[表298]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2942		白色粉末 (乙酸乙酯)	197-199	—
2943		白色粉末 (乙醇)	232-233	二氫氨酸鹽
2944		白色粉末 (乙醇/乙醚)	255-257	氫氨酸鹽
2945		白色粉末 (乙醇)	169.5-172.5	—
2946		白色粉末 (乙醇)	195.0-196.5	—
2947		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	151.5-153.5	—
2948		白色粉末 (乙酸乙酯)	235.0 (分解)	氫氨酸鹽
2949				
2950		白色粉末 (乙酸乙酯)	224.0-227.5	氫氨酸鹽
2951		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	175.0-178.5	—

(541)

[表299]

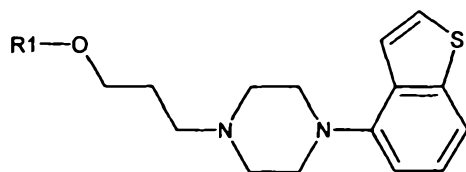


實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2952		白色粉末 (乙酸乙酯)	169.0-173.0	三氫氨酸鹽
2953				
2954		白色粉末 (乙酸乙酯)	210.0-217.0	二氫氨酸鹽
2955		白色粉末 (乙酸乙酯)	181.0-188.0	二氫氨酸鹽
2956		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	163.5-167.0	氫氨酸鹽
2957		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	172.5-176.5	氫氨酸鹽
2958		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	145.0-151.0	二氫氨酸鹽
2959		白色粉末 (乙醇/乙酸乙酯)	144.0-150.0	二氫氨酸鹽



(542)

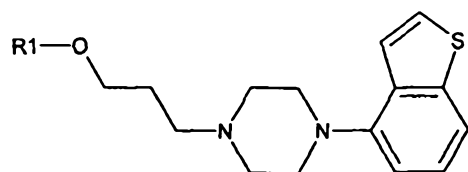
[表300]



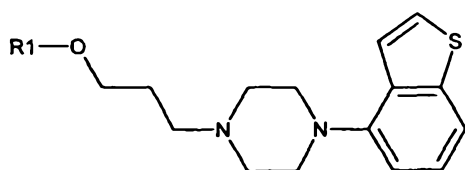
實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2960		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	177-182	二氫氨酸鹽
2961		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	198-201	氫氨酸鹽
2962		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	195-200	氫氨酸鹽
2963		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	215-218	氫氨酸鹽
2964		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	152-157	氫氨酸鹽
2965		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	158-161	氫氨酸鹽
2966		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	168-172	氫氨酸鹽
2967		白色粉末 (乙酸乙酯)	178.5-181.5	—
2968		白色粉末 (乙酸乙酯)	228.0 (分解)	氫氨酸鹽

(543)

[表301]



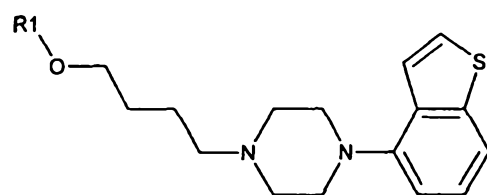
實例	R1	NMR	鹽
2969		<sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm: 1.95–2.10 (2H, m), 2.85–2.95 (2H, m), 3.00–3.15 (4H, m), 3.15–3.30 (4H, m), 4.41 (2H, t, J=5.8Hz), 6.89 (1H, d, J=5.0 Hz), 7.15 (1H, s), 7.26 (1H, t, J=7.9Hz), 7.43 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.63 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.71 (1H, d, J=5.5 Hz), 8.73 (1H, s).	—
2970		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.72–1.98 (4H, m), 2.30–2.46(1H, m), 2.46–2.58(2H, m), 2.62–2.77 (5H, m), 2.80(3H, d, J=5.1Hz), 3.04–3.29 (5H, m), 3.38–3.55 (2H, m), 3.83–4.04 (2H, m), 6.90 (1H, dd, J=0.5Hz, 7.6Hz), 7.22–7.34 (1H, m), 7.34–7.47 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.63(1H, br).	
2971		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm: 1.46 (9H, s), 1.70–1.89 (2H, m), 1.90–2.17(1H, m), 2.44–2.60(2H, m), 2.62–2.75 (4H, m), 2.81(3H, d, J=4.7Hz), 3.09–3.26 (4H, m), 3.39–3.57 (4H, m), 3.93–4.21 (1H, m), 4.21–4.46(1H, m), 6.65–6.95(1H, br), 6.90 (1H, d, J=7.0 Hz), 7.20–7.34 (1H, m), 7.35–7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).	



實例	R1	MS(M+1)	鹽
2972		440	氫氨酸鹽
2973		360	馬來酸鹽

(544)

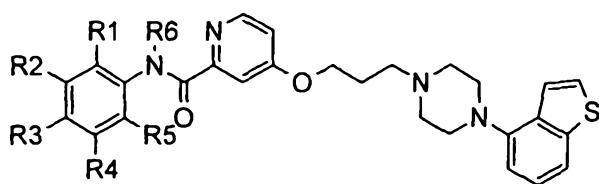
[表302]



實例	R1	結晶形式 (再結晶溶劑)	熔點(°C)	鹽
2974		白色粉末 (乙酸乙酯/乙醚)	215.5-216.5	氫氨酸鹽
2975				
2976		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	132.5-135.0	-
2977		白色粉末 (2-丙醇/水)	180.0-182.0	-
2978		白色粉末 (乙酸乙酯)	216.0-220.2	氫氨酸鹽
2979		白色粉末 (乙酸乙酯)	203.0-207.0	氫氨酸鹽
2980		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	146.5-148.0	-
2981		白色粉末 (乙酸乙酯)	197.0-201.0	氫氨酸鹽
2982		白色粉末 (乙酸乙酯 /異丙醚)	133.0-134.5	-

(545)

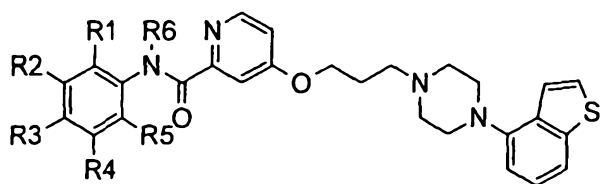
[表303]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2983	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	517
2984	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	501
2985	-H	-H	-Cl	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	521
2986	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	519
2987	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	519
2988	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	541
2989	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	557
2990	-H	-H	-H	-H	-H	-H	473
2991	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	507
2992	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	503
2993	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	503
2994	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	503
2995	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	507
2996	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	507
2997	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	487
2998	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	533
2999	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	516
3000	-1-PYRRYL	-H	-H	-H	-H	-H	538
3001	-H	-Cl	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	537
3002	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	533
3003	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	533
3004	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	517
3005	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	533
3006	-C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	513
3007	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	557
3008	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	487
3009	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	487
3010	-F	-H	-H	-H	-H	-H	491

(546)

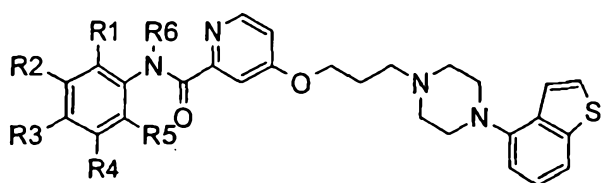
[表304]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
3011	-H	-H	-F	-H	-H	-H	491
3012	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	516
3013	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-H	516
3014	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	541
3015	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	541
3016	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	530
3017	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	530
3018	-H	-H	-H	-H	-CN	-H	498
3019	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	498
3020	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	501
3021	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	501
3022	-H	-Cl	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	521
3023	-H	-H	-OH	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	503
3024	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	501
3025	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	501
3026	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	501
3027	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	501
3028	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	501
3029	-F	-F	-H	-H	-H	-H	509
3030	-H	-F	-F	-H	-H	-H	509
3031	-H	-F	-H	-F	-H	-H	509
3032	-H	-F	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	521
3033	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	517
3034	-H	-Cl	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	537
3035	-H	-Cl	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	521
3036	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	533
3037	-H	-Cl	-OH	-H	-H	-H	523
3038	-Cl	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	521

(547)

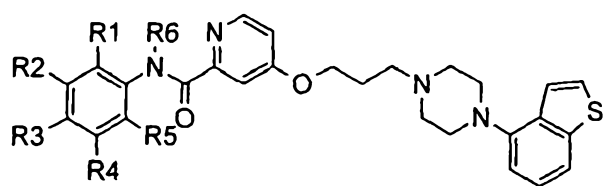
[表305]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
3039	-H	-CONH <sub>2</sub>	-H	-H	-Cl	-H	550
3040	-CH <sub>3</sub>	-H	-Br	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	579
3041	-H	-H	-CN	-H	-H	-H	498
3042	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	519
3043	-H	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-H	515
3044	-H	-H	-2-FURYL	-H	-H	-H	539

(548)

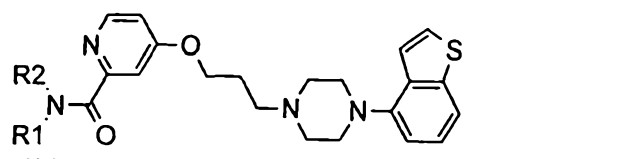
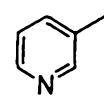
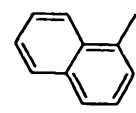
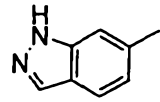
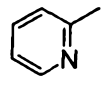
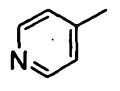
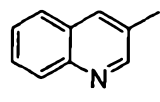
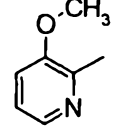
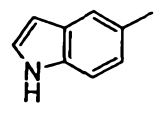
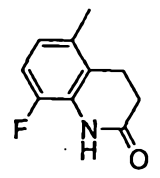
[表306]



實例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
3045	-H		-H	-H	-H	-H	539
3046	-H		-H	-H	-H	-H	540
3047	-H		-H	-H	-H	-H	542
3048	-H	-H		-H	-H	-H	554
3049	-H		-H	-H	-H	-H	553
3050	-H	-H		-H	-H	-H	553
3051	-H		-H	-H	-H	-H	540

(549)

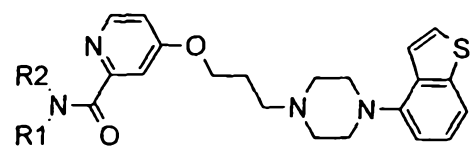
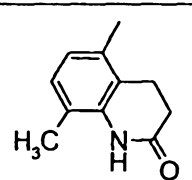
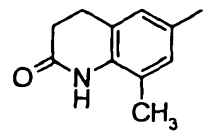
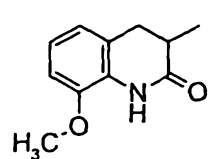
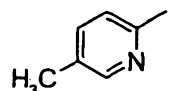
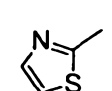
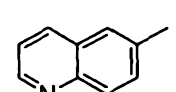
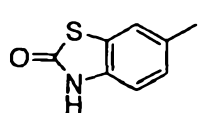
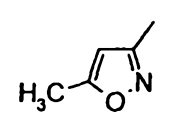
[表307]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
3052		-H	474
3053		-H	523
3054		-H	513
3055		-H	474
3056		-H	474
3057		-H	524
3058		-H	504
3059		-H	512
3060		-H	560



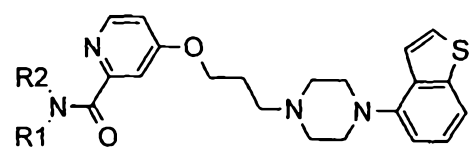
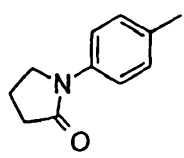
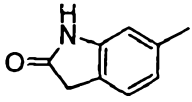
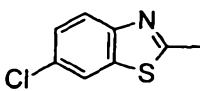
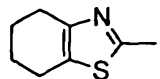
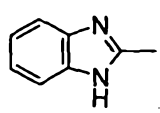
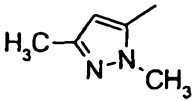
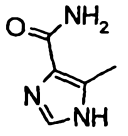
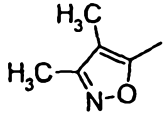
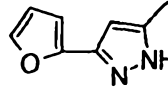
(550)

[表308]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
3061		-H	556
3062		-H	556
3063		-H	572
3064		-H	488
3065		-H	480
3066		-H	524
3067		-H	546
3068		-H	478

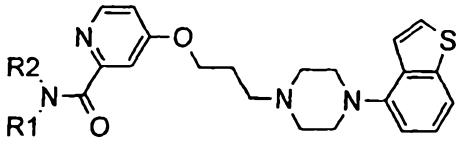
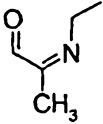
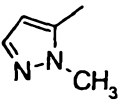
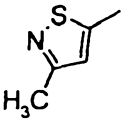

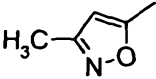
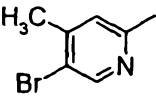
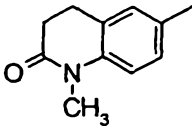
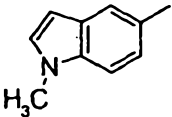
(551)

[表309]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
3069		-H	556
3070		-H	528
3071		-H	564
3072		-H	534
3073		-H	513
3074		-H	491
3075		-H	506
3076		-H	492
3077		-H	529

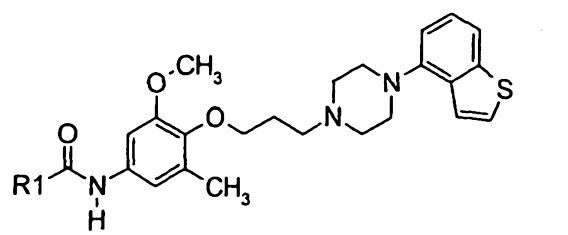
(552)

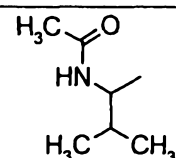
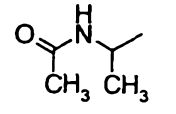
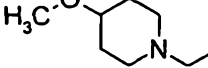
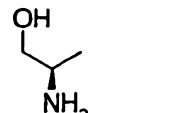
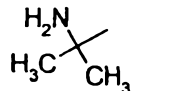
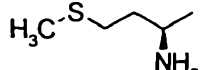
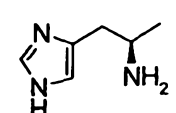
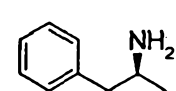
[表310]

			
實例	R1	R2	MS(M+1)
3078		-H	480
3079		-H	477
3080		-H	494
3081		-H	464
3082		-H	478
3083		-H	566
3084		-H	556
3085		-H	526

(553)

[表311]



實例	R1	MS(M+1)
3086		553
3087		525
3088		567
3089		499
3090		497
3091		543
3092		549
3093		559

(554)

## 實例 3094

3-胺基-4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-N-乙基-苯醯胺之合成

將 5 % 鈀碳 ( 0.8 克 ) 加至 4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-N-乙基-3-硝基苯醯胺 ( 1.0 克, 2.1 毫莫耳 ) 之乙醇溶液 ( 30 毫升 ) 中, 再令混合物於室溫下於常壓下進行催化性還原作用。藉過濾法將催化劑移除, 再將濾液於減壓下濃縮。而後將水加至餘留物中, 再將溶液以乙酸乙酯萃取。將有機層於無水硫酸鈉上乾燥, 其後於減壓下濃縮。再將餘留物藉矽膠管柱層析 ( 二氯甲烷 : 甲醇 = 30 : 1 → 20 : 1 ) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮, 即得黃色無定形固狀之 3-胺基-4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-N-乙基-苯醯胺 ( 0.78 克, 83 % 產率 )。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm : 1.23 ( 3H, t,  $J=7.4\text{Hz}$  ), 2.00-2.15 ( 2H, m ), 2.67 ( 2H, t,  $J=7.3\text{Hz}$  ), 2.75 ( 4H, brs ), 3.21 ( 4H, brs ), 3.40-3.50 ( 2H, m ), 3.50-4.30 ( 2H, br ), 4.13 ( 2H, t,  $J=6.5\text{Hz}$  ), 5.99 ( 1H, brs ), 6.80 ( 1H, d,  $J=8.4\text{Hz}$  ), 6.90 ( 1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$  ), 7.08 ( 1H, dd,  $J=2.1, 8.3\text{Hz}$  ), 7.19 ( 1H, d,  $J=2.1\text{Hz}$  ), 7.25-7.30 ( 1H, m ), 7.35-7.45 ( 2H, m ), 7.55 ( 1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$  )。

## 實例 3095

(555)

1-苯並[b]噻吩-4-基-4-[3-(1-乙醯基六氫吡啶-4-基氧基)丙基]六氫吡啶氫氨酸鹽之合成

將三乙胺(0.28毫升, 2.0毫莫耳)加至1-苯並[b]噻吩-4-基-4-[3-(六氫吡啶-4-基氧基)丙基]六氫吡啶(0.45克, 1.25毫莫耳)之二氯甲烷溶液(15毫升)中, 再將混合物於冰浴中冷卻。而後將乙醯氯(0.1毫升, 1.4毫莫耳)加入, 再將混合物於室溫下攪拌過夜。繼而將水加至反應溶液中, 其後以二氯甲烷萃取。將有機層於無水硫酸鈉上乾燥, 其後於減壓下濃縮。將餘留物藉矽膠管柱層析(二氯甲烷: 甲醇=30: 1)予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮。再將0.5N 氫氨酸-甲醇溶液(3毫升)加至餘留物。藉過濾法以得所產生之結晶, 再予乾燥, 即得白色粉狀之1-苯並[b]噻吩-4-基-4-[3-(1-乙醯基六氫吡啶-4-基氧基)丙基]六氫吡啶氫氨酸鹽(0.36克, 66%產率)。

熔點: 208-210℃

#### 實例 3096

1-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]吡咯啶-2,5-二酮氫氨酸鹽之合成

將PS-三苯膦(3毫莫耳/克, 1.80克), 偶氮二羧酸二第三丁酯(1.27克, 5.4毫莫耳)及N-羥基琥珀醯亞胺(510毫克, 4.3毫莫耳)加至3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙醇(1.00克, 3.6毫莫耳)之四氫呋喃溶

(556)

液 ( 50 毫升 ) 中 , 再將混合物於室溫下攪拌 4 小時。而後藉過濾法將樹脂移除 , 再將濾液於減壓下濃縮。將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 1 : 2 ) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮以得白色無定形固狀物 ( 762 毫克 , 47 % 產率 ) 。令 157 毫克白色無定形固狀物溶於乙醇中。再將 1N 氫氨酸 - 乙醇溶液 ( 0.42 毫升 ) 加入 , 繼而進一步將乙醚加入。將溶液於冰箱中靜置。再將所產生之結晶過濾並予乾燥 , 即得白色粉狀之 1-[3-(4-苯並 [b] 噻吩 -4-基 - 六氫吡啶 -1-基 ) 丙氧基 ] 吡咯啶 -2,5-二酮氫氨酸鹽 ( 158 毫克 ) 。

熔點 : 255.0-257.0°C

#### 實例 3097

6-[3-(4-苯並 [b] 噻吩 -4-基 - 六氫吡啶 -1-基 ) 丙氧基 ] 萘 -1-羧酸醯胺之合成

將三乙胺 ( 0.24 毫升 , 1.7 毫莫耳 ) 及氫甲酸異丁酯 ( 0.19 毫升 , 1.4 毫莫耳 ) 加至於冰冷卻下之 6-[3-(4-苯並 [b] 噻吩 -4-基 - 六氫吡啶 -1-基 ) 丙氧基 ] 萘 -1-羧酸 ( 0.52 克 , 1.2 毫莫耳 ) 之乙腈溶液 ( 10 毫升 ) 中 , 再將混合物攪拌 20 分鐘。而後將 28 % 氨水 ( 0.5 毫升 ) 加至反應溶液中 , 再將混合物於室溫下攪拌 20 分鐘。繼而將乙酸乙酯加至反應溶液中 , 再將溶液以水清洗。而後將有機層於無水硫酸鎂上乾燥 , 其後於減壓下濃縮。將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 ( 正己烷 : 乙酸乙酯 = 2 : 1 → 0 : 1 ) 予以純

(557)

化。而後將純化產物於減壓下濃縮，再將餘留物由乙酸乙酯-異丙醚之溶劑混合液中予以再結晶，即得白色粉狀之 6-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-1-萘-1-羧酸醯胺 (0.27 克，53 %產率)。

熔點：167.0-169.0℃

### 實例 3098

1-烯丙基-5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-1H-吡啶-3-羧酸甲醯胺之合成

將 40 %甲胺甲醇溶液 (5 毫升) 加至 1-烯丙基-5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-1H-吡啶-3-羧酸乙酯 (0.5 克，1.1 毫莫耳) 之甲醇溶液 (5 毫升) 中，再將混合物於室溫下攪拌 3 天。而後將溶液於減壓下濃縮，再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 (正己烷：乙酸乙酯 = 5 : 1 → 0 : 1) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，再將餘留物由乙酸乙酯-異丙醚之溶劑混合液中予以再結晶，即得白色粉狀之 1-烯丙基-5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-1H-吡啶-3-羧酸甲醯胺 (0.32 克，67 %產率)。

熔點：138.5-140.5℃

### 實例 3099

4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-環己烷羧酸醯胺之合成



(558)

將氨水（28%，0.5 毫升），1-（3-二甲氨基丙基）-3-乙基碳化二亞胺氫氨酸鹽（WSC）（0.36 克，1.9 毫莫耳）及 4-二甲氨基吡啶（DMAP）（0.05 克，0.4 毫莫耳）加至 4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-環己烷羧酸（0.5 克，1.2 毫莫耳）之二氯甲烷溶液（10 毫升）中，再將混合物於室溫下攪拌 19 小時。而後將二氯甲烷加至反應溶液中，再將混合物以水清洗。繼而將有機層於無水硫酸鎂上乾燥，其後於減壓下濃縮。再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=3：1→0：1）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，再將餘留物由乙酸乙酯-異丙醚之溶劑混合液中予以再結晶，即得白色粉狀之 4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-環己烷羧酸醯胺（0.1 克，22%產率）。  
 熔點：107.5-108.5℃

#### 實例 3100

乙磺酸{4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基-苯基}醯胺氫氨酸鹽之合成

將 4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基）丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基胺（0.2 克，0.49 毫莫耳）之二氯甲烷溶液（4 毫升）於冰上冷卻。再將 N-乙基二異丙胺（0.15 毫升，0.87 毫莫耳）及乙磺醯氯（0.07 毫升，0.73 毫莫耳）加入，而後將混合物於室溫下攪拌一小時。繼而進一步將 N-乙基二異丙胺（0.15 毫升，0.87 毫莫耳）及

(559)

乙磺醯氯 (0.07 毫升, 0.73 毫莫耳) 加入, 再將混合物於室溫下攪拌 19 小時。而後將水性 6N-氫氧化鈉溶液 (0.5 毫升) 及乙醇 (2 毫升) 加入, 再將混合物於室溫下攪拌過夜。繼而將二氯甲烷加至反應溶液中, 而後以水清洗。將有機層於無水硫酸鎂上乾燥, 其後於減壓下濃縮。再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯 = 2: 1 → 0: 1) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮。將 4N-氫氨酸 / 乙酸乙酯溶液加至餘留物中。將所產生之結晶過濾並予乾燥, 即得白色粉狀之乙磺酸 {4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基) 丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基-苯基} 醯胺氫氨酸鹽 (222 毫克, 85 % 產率)。

熔點: 235.5-237.5°C

#### 實例 3101

5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基) 丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基}-胺基甲酸甲酯之合成

將 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基) 丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基-胺 (0.17 克, 0.47 毫莫耳) 之二氯甲烷溶液 (2 毫升) 於冰上冷卻。再將吡啶 (0.08 毫升, 0.94 毫莫耳) 及氯甲酸甲酯 (0.04 毫升, 0.52 毫莫耳) 加入, 而後將混合物於室溫下攪拌 17 小時。繼而將乙酸乙酯加至反應溶液中, 再將反應混合物以水清洗。而後將水層以乙酸乙酯萃取。再將有機層結合, 於無水硫酸鎂上乾燥, 其後於減壓下濃縮。再將餘留物藉鹼性矽膠管

(560)

柱層析（正己烷：乙酸乙酯 = 2 : 1 → 1 : 1）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，再將餘留物由乙酸乙酯-異丙醚之溶劑混合液中予以再結晶，即得白色粉狀之 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基}-胺基甲酸甲酯（0.10 克，51 % 產率）。

熔點：162.5-165.0℃

#### 實例 3102

3-{5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基}-1,1-二甲基-脲氫氨酸鹽之合成

將 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基-胺（0.27 克，0.73 毫莫耳）之二氯甲烷溶液（5 毫升）於冰上冷卻。再將三乙胺（0.36 毫升，2.5 毫莫耳）及吡啶（0.06 毫升，0.73 毫莫耳）加入，而後將混合物於室溫下攪拌過夜。繼而將水加至反應溶液中，再將反應溶液以乙酸乙酯萃取。將有機層於無水硫酸鎂上乾燥，其後於減壓下濃縮。再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯 = 3 : 1 → 0 : 1）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，令餘留物溶於乙酸乙酯中，繼而將 4N-氫氨酸/乙酸乙酯溶液加入。將所產生之結晶過濾並予乾燥，即得淡黃色粉狀之 3-{5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基}-1,1-二甲基-脲氫氨酸鹽（0.10 克，30 % 產率）。

熔點：174.0-176.5℃

(561)

## 實例 3103

3-{5-[4-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡嘧-1-基)丁氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基}-1,1-二甲基-脲氫氨酸鹽之合成

將水性二甲胺溶液 (50 %, 0.16 毫升, 1.6 毫莫耳) 加至 5-[4-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡嘧-1-基)丁氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基胺基甲酸苯酯 (0.26 克, 0.52 毫莫耳) 之二甲基甲醯胺 (DMF) (3 毫升) 溶液中, 再將混合物於室溫下攪拌 16 小時。而後將水加至反應溶液中, 繼而以乙酸乙酯萃取。將有機層於無水硫酸鎂上乾燥, 其後於減壓下濃縮。再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯 = 7: 3 → 0: 1) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮, 令餘留物溶於乙酸乙酯中。繼而將 1N-氫氨酸/乙醇溶液加入, 將所產生之結晶過濾並予乾燥, 即得白色粉狀之 3-{5-[4-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡嘧-1-基)丁氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基}-1,1-二甲基-脲氫氨酸鹽 (95 毫克, 37 %產率)。

熔點: 186.0-187.5 °C

## 實例 3104

N-{5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡嘧-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡啶-3-基}-乙醯胺之合成

將乙酸酐 (1 毫升) 及三乙胺 (0.09 毫升, 0.65 毫莫耳) 加至 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡嘧-1-基)丙

(562)

氧基]-1-甲基-1H-吡唑-3-基-胺 (0.20 克, 0.54 毫莫耳) 之二氯甲烷溶液 (4 毫升) 中, 再將混合物於室溫下攪拌 6 小時。而後將水性碳酸鉀溶液加至反應溶液中, 繼而以乙酸乙酯萃取。將有機層於無水硫酸鎂上乾燥, 其後於減壓下濃縮。再將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 (正己烷: 乙酸乙酯 = 2: 1 → 0: 1) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮, 再將餘留物由乙酸乙酯-異丙醚之溶劑混合液中予以再結晶, 即得白色粉狀之 N-{5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基) 丙氧基]-1-甲基-1H-吡唑-3-基}-乙醯胺 (0.19 克, 89 % 產率)。

熔點: 137.0-139.0°C

#### 實例 3105

3-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基) 丙氧基]-3-羥甲基-5-甲氧基-苯基}噁唑啉-2-酮氫氯酸鹽之合成

首先, 將 2-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基) 丙氧基]-3-甲氧基-5-(2-酮基-噁唑啉-3-基) 苯甲醛氫氯酸鹽 (1.28 克, 2.4 毫莫耳) 加至水性氫氯酸鉀溶液中。再將混合物以二氯甲烷萃取。而後將萃取之溶液於減壓下濃縮並令餘留物溶於四氫呋喃 (15 毫升) 中。將氫硼化鈉 (0.05 克, 1.2 毫莫耳) 於冰冷卻下加至此溶液中, 再將混合物於室溫下攪拌 3 小時。繼而將 10 % 氫氯酸加至於冰冷卻下之此混合物中以將過量存在之試劑分解。將水性 6N 氫氧化鈉溶液加至此溶液中使其成為鹼性溶液

(563)

後，將其以乙酸乙酯萃取。再將有機層於無水硫酸鎂上乾燥，其後於減壓下濃縮。將餘留物藉矽膠管柱層析（二氯甲烷：乙酸乙酯=3：7 → 二氯甲烷：甲醇=100：3）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，令餘留物溶於乙醇中。再將 1N 氫氨酸/乙醇溶液加入。而後將所產生之結晶由乙醇中予以再結晶，即得白色粉狀之 3-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-羥甲基-5-甲氧基-苯基}噁唑啉-2-酮氫氨酸鹽（0.52 克，41 %產率）。

熔點：224.0-226.5℃（分解）

#### 實例 3106

1-乙醯基-4-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲苯基}六氫吡啶氫氨酸鹽之合成

將 1-苯並[b]噻吩-4-基-4-[3-(4-溴基-2-甲氧基-6-甲基苯氧基)丙基]六氫吡啶氫氨酸鹽（0.5 克，0.98 毫莫耳），1-乙醯基六氫吡啶（0.15 克，1.2 毫莫耳），乙酸鈮（11 毫克，0.048 毫莫耳），2,2'-雙（二苯膦基）-1,1'-聯萘（BINAP）（63 毫克，0.098 毫莫耳）及第三丁醇鈉（0.23 克，2.3 毫莫耳）加至甲苯（10 毫升）中，再將混合物於氫氣層下、於 90℃下攪拌 22 小時。而後將反應混合物冷卻至室溫並藉由賽力特矽藻土予以過濾。繼而將濾塊以乙酸乙酯清洗。再將濾液及清洗液結合，其後於減壓下濃縮。將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=11：1→1：1）予以純化。而後將純化產物於減壓

(564)

下濃縮，令餘留物溶於乙酸乙酯中。再將 1N 氫氨酸/乙醇溶液加入。而後將所產生之結晶過濾及乾燥，即得白色粉狀之 1-乙醯基-4-{4-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基)丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基}六氫吡咩氫氨酸鹽 (75 毫克，14 %產率)。

熔點：257.0-261.0℃ (分解)

#### 實例 3107

1-苯並[b]噻吩-4-基-4-[3-(4-咪唑-1-基-2-甲氧基-6-甲基-苯氧基)-丙基]-六氫吡咩二氫氨酸鹽之合成

將 1-苯並[b]噻吩-4-基-4-[3-(4-碘基-2-甲氧基-6-甲基-苯氧基)-丙基]-六氫吡咩 (0.6 克，0.69 毫莫耳)，咪唑 (0.07 克，1.03 毫莫耳)，碘化銅 (I) (13 毫克，0.069 毫莫耳)，反式-N,N'-二甲基-1,2-環己烷二胺 (0.02 毫升，0.14 毫莫耳) 及碳酸鉀 (0.47 克，1.38 毫莫耳) 加至 1,4-二噁烷 (6 毫升) 中，再邊於氬氣層下加熱邊迴流 50 小時。將所得反應混合物冷卻至室溫後，將水加至反應溶液中，而後以乙酸乙酯萃取。繼而將有機層於無水硫酸鎂上乾燥，其後於減壓下濃縮。將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析 (正己烷：乙酸乙酯 = 5：1 → 1：1) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，令餘留物溶於乙酸乙酯中。再將 1N 氫氨酸/乙醇溶液加入，而後將所產生之結晶過濾及乾燥，即得淡黃色粉狀之 1-苯並[b]噻吩-4-基-4-[3-(4-咪唑-1-基-2-甲氧基-6-甲基-苯氧基)-丙基]-六

(565)

氫吡咩二氫氨酸鹽（60 毫克，17 %產率）。

熔點：234.0-240.0℃（分解）

#### 實例 3108

4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基）丙氧基]-3,N-二甲基-5-（2,2,2-三氟乙氧基）苯醯胺氫氨酸鹽之合成

將碳酸鉀（0.34 克，0.99 毫莫耳）及 1,1,1-三氟基-2-碘基乙烷（0.05 毫升，0.47 毫莫耳）加至 4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基）丙氧基]-3-羥基-5,N-二甲基苯醯胺（188 毫克，0.39 毫莫耳）之二甲基甲醯胺溶液（2 毫升）中，再將混合物於 40℃下攪拌 2 小時。而後將 1,1,1-三氟基-2-碘基乙烷（0.1 毫升，0.94 毫莫耳）進一步加入，再將混合物於 40℃下攪拌 5 小時。將反應混合物冷卻至室溫後，將水加至反應溶液中，而後以乙酸乙酯萃取。繼而將有機層於無水硫酸鎂上乾燥，其後於減壓下濃縮。將餘留物藉鹼性矽膠管柱層析（正己烷：乙酸乙酯=3：1→0：1）予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮，令餘留物溶於異丙醇中。再將 1N 氫氨酸/乙醇溶液加入，其後於減壓下濃縮。將餘留物由異丙醇/乙酸乙酯之溶劑混合液中予以再結晶，即得淡黃色粉狀之 4-[3-（4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡咩-1-基）丙氧基]-3,N-二甲基-5-（2,2,2-三氟乙氧基）苯醯胺氫氨酸鹽（88 毫克，40 %產率）。

熔點：156.0-157.5℃



(566)

## 實例 3109

1-{5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡唑-3-基}-乙酮氫氨酸鹽之合成

將 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡唑-3-羧酸甲氧基甲醯胺氫氨酸鹽 (0.61 克, 1.3 毫莫耳) 加至水性氫氧化鈉溶液中, 再將混合溶液以二氯甲烷萃取。而後將萃取之溶液於減壓下濃縮, 再令餘留物溶於四氫呋喃 (12 毫升) 中。繼而將溶液冷卻至  $-78^{\circ}\text{C}$ , 再將 1N-甲基鋰乙醚溶液 (1.2 毫升) 加入, 而後將混合物於相同溫度下攪拌 2 小時。將水性氯化銨溶液加至反應溶液中, 再將溶液加熱至室溫。而後將氯化鉀加至溶液中, 其後以乙酸乙酯萃取。將有機層於無水硫酸鎂上乾燥, 其後於減壓下濃縮。將餘留物藉矽膠管柱層析 (二氯甲烷: 乙酸乙酯 = 3: 1  $\rightarrow$  0: 1) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮, 令餘留物溶於乙醇中。再將 1N 氫氨酸/乙醇溶液加入, 其後將所產生之結晶由含水之乙醇中予以再結晶, 即得白色粉狀之 1-{5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-1-甲基-1H-吡唑-3-基}-乙酮氫氨酸鹽 (0.22 克, 40 % 產率)。

熔點:  $245.0^{\circ}\text{C}$  (分解)

## 實例 3110

5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-羥

(567)

### 甲基-1-甲基-1H-吡啶之合成

將 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-(第三丁基-二甲基甲矽烷氧基甲基)-1-甲基-1H-吡啶 (0.75 克, 1.5 毫莫耳) 之四氫呋喃溶液 (8 毫升) 於冰上冷卻, 再將 1M 四丁銨化氟之四氫呋喃溶液 (1.7 毫升) 加入。而後將混合物於室溫下攪拌 16 小時。將乙酸乙酯加至反應溶液中, 再以水清洗。而後將有機層於無水硫酸鎂上乾燥, 其後於減壓下濃縮。將餘留物藉矽膠管柱層析 (二氯甲烷: 甲醇 = 1: 0 → 30: 1 → 15: 1) 予以純化。而後將純化產物於減壓下濃縮, 再將餘留物由含乙酸乙酯及異丙醚之溶劑混合液中予以再結晶, 即得白色粉狀之 5-[3-(4-苯並[b]噻吩-4-基-六氫吡啶-1-基)丙氧基]-3-經甲基-1-甲基-1H-吡啶 (0.46 克, 79 % 產率)。

熔點: 123.5-126.0°C

### 藥學試驗 1

#### 1) 多巴胺 D2 受體結合試驗

本分析係藉 Kohler 等人之方法 (Kohier C, Hall H, Ogren SO and Gawell L, Specific in vitro and in vivo binding of 3H-raclopride. A potent substituted benzamide drug with high affinity for dopamine D-2 receptors in the rat brain. Biochem. Pharmacol., 1985; 34: 2251-2259) 進行。

將 Wistar 雄性鼠斬首, 將腦立即拿出, 再將紋狀體取

(568)

出。使用具有高速旋轉葉片之均化器，將其於 50 倍於組織重之量之 50 mM 參（羥甲基）胺基甲烷（Tris）-氫氨酸緩衝液（pH 7.4）中均化，再於 4°C 下以 48,000×g 之速離心 10 分鐘。令所得沉澱物再度懸浮於 50 倍於組織重之量之上述緩衝液中，於 37°C 下保溫 10 分鐘後，於上述狀況下離心。令所得沉澱物懸浮於 25 倍於組織重之量之 50 mM（Tris）-氫氨酸緩衝液（含 120 mM 氯化鈉，5 mM 氯化鉀，2 mM 氯化鈣，1 mM 氯化鎂，pH 7.4）中，再於 -85°C 下冰凍保存直至供結合分析使用以作為膜樣品為止。

結合分析法係使用 40 微升膜樣品，20 微升 [<sup>3</sup>H]-雷氯必利（raclopride）（最終濃度 1 至 2 nM），20 微升測試藥物及 50 mM（Tris）-氫氨酸緩衝液（含 120 mM 氯化鈉，5 mM 氯化鉀，2 mM 氯化鈣，1 mM 氯化鎂，pH 7.4）進行以使總量為 200 微升（最終二甲亞砷濃度為 1 %）。再將反應於室溫下進行 1 小時，藉抽濾法（使用於玻璃纖維上之細胞採收器）予以終止。將玻璃纖維製成之濾板以 50 mM（Tris）-氫氨酸緩衝液（pH 7.4）清洗，乾燥後，將微盤液體閃爍劑加入，再以微盤液體閃爍計數器測量放射活性。於 10 μM（+）-布他拉莫（butaclamol）氫氨酸鹽存在下之放射活性則設定為非特異性結合。

IC<sub>50</sub> 值係使用非線性分析程式由濃度-依賴性反應中計算出。K<sub>i</sub> 值則使用 Cheng-Prusoff 式由 IC<sub>50</sub> 值中計算出。結果示於下表 312 中。

(569)

[表 312]

多巴胺 D2 受體結合試驗		
測試化合物		K <sub>i</sub> (nM)
實例 3	化合物	1.5
實例 4	化合物	1.9
實例 6	化合物	0.7
實例 7	化合物	0.8
實例 11	化合物	0.2
實例 14	化合物	0.3
實例 15	化合物	0.4
實例 17	化合物	0.6
實例 26	化合物	2.6
實例 27	化合物	1.5
實例 32	化合物	2.5
實例 40	化合物	3.1
實例 48	化合物	2.3
實例 58	化合物	2.0
實例 61	化合物	5.0
實例 62	化合物	1.6
實例 72	化合物	3.4
實例 73	化合物	1.3
實例 76	化合物	2.5
實例 80	化合物	1.6
實例 94	化合物	2.4
實例 95	化合物	1.9
實例 112	化合物	1.0
實例 115	化合物	1.6
實例 121	化合物	1.1
實例 123	化合物	0.7
實例 125	化合物	2.0
實例 127	化合物	0.4
實例 133	化合物	0.3
實例 144	化合物	0.4
實例 146	化合物	0.1
實例 160	化合物	0.4
實例 169	化合物	0.9
實例 170	化合物	1.0
實例 186	化合物	1.3
實例 190	化合物	1.2
實例 232	化合物	1.1
實例 241	化合物	0.4
實例 243	化合物	0.2
實例 252	化合物	0.3
實例 271	化合物	1.2

續 ...

(570)

[表 312]

多巴胺 D2 受體結合試驗			
測試化合物			Ki (nM)
實例 281	化合物		0.3
實例 286	化合物		0.2
實例 301	化合物		0.2
實例 303	化合物		1.0
實例 307	化合物		0.3
實例 313	化合物		0.7
實例 314	化合物		0.8
實例 323	化合物		1.5
實例 340	化合物		1.9
實例 343	化合物		0.9
實例 345	化合物		1.6
實例 354	化合物		0.2
實例 358	化合物		0.2
實例 359	化合物		0.2
實例 363	化合物		2.0
實例 368	化合物		0.4
實例 382	化合物		0.5
實例 394	化合物		3.8
實例 453	化合物		0.9
實例 462	化合物		0.4
實例 546	化合物		0.6
實例 650	化合物		1.2
實例 706	化合物		1.0
實例 802	化合物		0.6
實例 1014	化合物		3.3
實例 1016	化合物		2.2
實例 1026	化合物		1.9
實例 1027	化合物		1.9
實例 1034	化合物		2.1
實例 1059	化合物		0.4
實例 1060	化合物		0.1
實例 1061	化合物		0.1
實例 1071	化合物		0.1
實例 1076	化合物		1.2
實例 1079	化合物		0.4
實例 1080	化合物		0.6
實例 1083	化合物		0.3
實例 1084	化合物		0.1
實例 1086	化合物		1.0

續 ...

(571)

[表 312]

多巴胺 D2 受體結合試驗	
測試化合物	Ki(nM)
實例 1087 化合物	0.3
實例 1089 化合物	1.0
實例 1106 化合物	1.0
實例 1110 化合物	1.2
實例 1113 化合物	0.7
實例 1138 化合物	1.4

2) 血清素 5-HT<sub>2A</sub> 受體結合分析法

本分析係藉 Leysen 等人之方法 ( Leysen JE, Niemegeers CJE, Van Nueten JM and Laduron PM. [3H] Ketanserin (R 41 468), a selective 3H-ligand for serotonin 2 receptor binding sites. Mol. Pharmacol., 1982, 21: 301-314) 進行。

將 Wistar 雄性鼠斬首，將腦立即拿出，再將額葉皮質取出。使用鐵氟龍玻璃均化器，將其於 10 倍於組織重之量之 0.25M 蔗糖中均化，再於 4℃ 下以 1,000×g 之速離心 10 分鐘。將所得上層液轉移至另一離心管中，令其懸浮於 5 倍於組織重之量之 0.25M 蔗糖中，再將沉澱物於上述狀況下離心。而後將所得上層液與以上所得上層液結合，使用 50 mM Tris-氫氯酸緩衝液 ( pH 7.4 ) 調整成 40 倍於組織重之量，再於 4℃ 下以 35,000×g 之速離心 10 分鐘。令所得沉澱物再度懸浮 40 倍於組織重之量之上述緩衝液中，再於上述狀況下離心。令所得沉澱物懸浮於 20 倍於組織重之量之上述緩衝液中，再於 -85℃ 下冰凍保存直至供結合分析使用以作為膜樣品為止。

結合分析法係使用 40 微升膜樣品，20 微升 [<sup>3</sup>H]-酮色

(572)

林 ( Ketanserin ) ( 最終濃度 1 至 3 nM ) , 20 微升測試藥物及 50 mM Tris-氫氨酸緩衝液 ( pH 7.4 ) 進行以使總量為 200 微升 ( 最終二甲亞砷濃度為 1 % ) 。再將反應於 37 °C 下進行 20 分鐘 , 藉抽濾法 ( 使用於玻璃纖維上之細胞採收器 ) 予以終止。

將玻璃纖維製成之濾板以 50 mM Tris-氫氨酸緩衝液 ( pH 7.4 ) 清洗 , 乾燥後 , 將微盤液體閃爍劑加入 , 再以微盤液體閃爍計數器測量放射活性。於 10  $\mu$  M 螺旋丁苯 ( spiperone ) 存在下之放射活性則設定為非特異性結合。

IC<sub>50</sub> 值係使用非線性分析程式由濃度 - 依賴性反應中計算出。Ki 值則使用 Cheng-Prusoff 式由 IC<sub>50</sub> 值中計算出。結果示於下表 313 中。

(573)

[表 313]

血清素 5-HT <sub>2A</sub> 受體結合試驗	
測試化合物	Ki(nM)
實例 3 化合物	6.0
實例 4 化合物	7.7
實例 6 化合物	3.3
實例 7 化合物	2.9
實例 11 化合物	4.4
實例 14 化合物	2.4
實例 15 化合物	5.9
實例 17 化合物	3.4
實例 26 化合物	0.8
實例 27 化合物	1.0
實例 32 化合物	1.4
實例 40 化合物	0.6
實例 48 化合物	3.8
實例 58 化合物	4.9
實例 61 化合物	4.9
實例 62 化合物	4.7
實例 72 化合物	3.4
實例 73 化合物	5.6
實例 76 化合物	1.7
實例 80 化合物	3.3
實例 94 化合物	2.0
實例 95 化合物	2.3
實例 112 化合物	0.7
實例 115 化合物	3.7
實例 121 化合物	1.5
實例 123 化合物	1.4
實例 125 化合物	3.9
實例 127 化合物	2.4
實例 133 化合物	4.7
實例 144 化合物	1.4
實例 146 化合物	2.4
實例 160 化合物	0.6
實例 169 化合物	2.6
實例 170 化合物	3.3
實例 186 化合物	2.0
實例 190 化合物	0.6
實例 232 化合物	2.7
實例 241 化合物	0.7
實例 243 化合物	0.5
實例 252 化合物	0.3
實例 271 化合物	0.6

續 ...



(574)

[表 313]

血清素 5-HT <sub>2A</sub> 受體結合試驗		
測試化合物	Ki(nM)	
實例 281 化合物	0.6	
實例 286 化合物	0.8	
實例 301 化合物	0.4	
實例 303 化合物	2.5	
實例 307 化合物	0.7	
實例 313 化合物	1.1	
實例 314 化合物	0.8	
實例 323 化合物	0.7	
實例 340 化合物	4.8	
實例 343 化合物	0.5	
實例 345 化合物	1.9	
實例 354 化合物	0.6	
實例 358 化合物	1.1	
實例 359 化合物	1.1	
實例 363 化合物	1.1	
實例 368 化合物	0.7	
實例 382 化合物	0.6	
實例 394 化合物	4.7	
實例 453 化合物	1.2	
實例 462 化合物	1.7	
實例 546 化合物	0.7	
實例 650 化合物	0.6	
實例 706 化合物	0.9	
實例 802 化合物	1.4	
實例 1014 化合物	4.2	
實例 1016 化合物	2.3	
實例 1026 化合物	3.5	
實例 1027 化合物	2.0	
實例 1034 化合物	3.1	
實例 1059 化合物	3.8	
實例 1060 化合物	1.2	
實例 1061 化合物	1.2	
實例 1071 化合物	1.2	
實例 1076 化合物	12.4	
實例 1079 化合物	2.8	
實例 1080 化合物	3.4	
實例 1083 化合物	1.5	
實例 1084 化合物	1.4	
實例 1086 化合物	5.8	
實例 1087 化合物	2.6	
實例 1089 化合物	13.9	

續 ...

(575)

[表 313]

血清素 5-HT <sub>2A</sub> 受體結合試驗	
測試化合物	K <sub>i</sub> (nM)
實例 1106 化合物	7.1
實例 1110 化合物	4.9
實例 1136 化合物	5.0
實例 1138 化合物	19.7

### 3) 腎上腺素 $\alpha$ 1 受體結合試驗

本分析係藉 Groβ G 等人之方法 (Groβ G, Hanft G and Kolassa N. Urapidil and some analogues with hypotensive properties show high affinities for 5-hydroxytryptamine (5-HT) binding sites of the 5-HT<sub>1A</sub> subtype and for  $\alpha$  1-adrenoceptor binding sites. Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol., 1987, 336: 597-601) 進行。

將 Wistar 雄性鼠斬首，將腦立即拿出，再將大腦皮質取出。使用具有高速旋轉葉片之均化器，將其於 20 倍於組織重之量之 50 mM Tris-氫氨酸緩衝液 (100mM 氯化鈉，含 2mM 乙二胺四乙酸二氫二鈉，pH 7.4) 中均化，再於 4℃ 下以 80,000xg 之速離心 20 分鐘。令所得沉澱物懸浮於 20 倍於組織重之量之上述緩衝液中，於 37℃ 下保溫 10 分鐘後，於上述狀況下離心。令所得沉澱物再度懸浮於 20 倍於組織重之量之上述緩衝液中，再於上述狀況下離心。令所得沉澱物懸浮於 20 倍於組織重之量之 50 mM (Tris) -氫氨酸緩衝液 (含 1mM 乙二胺四乙酸二氫二鈉，pH 7.4) 中，再於 -85℃ 下冰凍保存直至供結合分析使用以作為膜樣品為止。

(576)

結合分析法係使用 40 微升膜樣品，20 微升 [ $^3\text{H}$ ]-哌唑啉 (prazosin) (最終濃度 0.2 至 0.5 nM)，20 微升測試藥物及 50 mM Tris-氫氨酸緩衝液 (含 1 mM 乙二胺四乙酸，pH 7.4) 進行以使總量為 200 微升 (最終二甲亞砷濃度為 1%)。再將反應於 30°C 下進行 45 小時，藉抽濾法 (使用於玻璃纖維上之細胞採收器) 予以終止。

將玻璃纖維製成之濾板以 50 mM Tris-氫氨酸緩衝液 (pH 7.4) 清洗，乾燥後，將微盤液體閃爍劑加入，再以微盤液體閃爍計數器測量放射活性。於 10  $\mu\text{M}$  酚妥拉明 (phentolamine) 氫氨酸鹽存在下之放射活性則設定為非特異性結合。

$\text{IC}_{50}$  值係使用非線性分析程式由濃度-依賴性反應中計算出。 $\text{K}_i$  值則使用 Cheng-Prusoff 式由  $\text{IC}_{50}$  值中計算出。

## 藥學試驗 2

使用  $\text{D}_2$  受體表現細胞進行之對多巴胺  $\text{D}_2$  受體之部分激動劑活性

對多巴胺  $\text{D}_2$  受體之部分激動劑活性係藉於多巴胺  $\text{D}_2$  受體表現細胞中定量地測定測試化合物之環 AMP 製造抑制效應來估測，其中腺苷 3',5'-環單磷酸 (環 AMP) 之製造係藉由毛喉鞘蕊花 (forskolin) 刺激作用來誘生。

將人類重組多巴胺  $\text{D}_2$  受體表現性中國倉鼠卵巢/DHFR (-) 細胞於培養基 (Iscove's 改良式杜氏 (Dulbecco's))

(577)

培養基 (IMDM 培養基) , 10 %胎牛血清 , 50 I.U./毫升青黴素 , 50 微克/毫升鏈黴素 , 200 微克/毫升健他黴素 , 0.1 mM 次黃嘌呤鈉 , 16  $\mu$ M 胸苷 ) 中 , 於 37℃ 及 5 %二氧化碳狀況下培養。將細胞以  $10^4$  個細胞/孔之量種至塗覆有多-L-賴胺酸之 96 孔式微滴定盤中 , 再令其於相同狀況下生長 2 天。將每一孔以 100 微升培養基 (IMDM 培養基 , 0.1 mM 次黃嘌呤鈉 , 16  $\mu$ M 胸苷) 清洗。再將培養基以已有 3 $\mu$ M 測試化合物溶於其中之 50 微升培養基 (IMDM 培養基 , 0.1 %抗壞血酸鈉 , 0.1 mM 次黃嘌呤鈉 , 16  $\mu$ M 胸苷) 替換。令其於 37℃ 及 5 %二氧化碳狀況下培養 20 分鐘後 , 將培養基以已有 3 $\mu$ M 測試化合物溶於其中之 100 微升毛喉鞘蕊花 (forskolin) 刺激性培養基 (IMDM 培養基 , 0.1 %抗壞血酸鈉 , 0.1 mM 次黃嘌呤鈉 , 16  $\mu$ M 胸苷 , 10  $\mu$ M 毛喉鞘蕊花 (forskolin) , 500 $\mu$ M 3-異丁基-1-甲基黃嘌呤) 替換 , 再於 37℃ 及 5 %二氧化碳狀況下培養 10 分鐘。移除培養基後 , 將 200 微升 Lysis 1B 水性溶液 (Amersham Bioscience, 接合至環 AMP biotrack 酵素免疫分析系統上之試劑) 分配 , 再搖動 10 分鐘。每一孔之水性溶液乃用以作為供測量之樣品。使用上述之酵素免疫分析系統 , 令經四倍稀釋之供測量之樣品接受環 AMP 量之測量。再計算個別化合物之抑制比 , 且設定未加入測試化合物中之孔中之環 AMP 之量為 100 %。在此經驗測試系統中 , 用以作為對照藥物之多巴胺可抑制環 AMP 之活性至約 10 %則為最大活性。

(578)

結果證實測試化合物於上述試驗中，對多巴胺 D<sub>2</sub> 受體具有部分激動活性。

既然測試化合物對多巴胺 D<sub>2</sub> 受體具有部分激動活性，彼等可使精神分裂症病患之多巴胺神經傳導作用安定化至正常狀況，結果顯現（例如）正面及負面狀況改善效應，知能障礙改善效應及其它症狀改善效應而不導致副作用。

### 藥學試驗 3

對鼠隻之阿樸嗎啡-誘導性定型行為之抑制效應

使用 Wistar 鼠（雄性，六-七星期大，Japan SLC, Inc.）作為測試動物。使用瑪瑙研鉢令測試化合物懸浮於 5 %阿拉伯膠 /（生理食鹽水或水）中，如有需要，再以相同之溶劑稀釋。

在試驗之前，令測試動物禁食過夜。將每一測試化合物經口投服（5 毫升/公斤）後，將阿樸嗎啡（0.7 毫克/公斤）由皮下投服（1 毫升/公斤）1 小時。在注射阿樸嗎啡後之 20，30 及 40 分鐘分別觀察定型行為 1 分鐘。

根據下列狀況來定量每一隻動物之定型行為，總結三個時點所得之分數，再評估抗-阿樸嗎啡效應。每一群使用六隻動物。

0：動物的外觀與經鹽水處理之鼠相同；

1：間斷之嗅吸，持續不斷之搜索活動；

2：持續之嗅吸，周期性搜索活動；

(579)

3：持續之嗅吸，間歇之咬，啃或舔。極短期之運動力。

4：持續之咬，啃或舔；無搜索活動。

非-臨床之統計分析系統乃供所有統計處理用。當顯著機率小於 0.05 時，則判定存在顯著差異。溶劑投服群與每一測試化合物投服群間之分數差異則使用威爾科克森 (Wilcoxon) 秩和檢驗或史帝耳 (Steel) 檢驗來分析。此外，亦使用線性回歸分析以供計算 50 %有效劑量 (95 %信賴區間)。

既然測試化合物顯示具有阿樸嗎啡-誘導性定型行為之抑制效應，故證實測試化合物具有 D<sub>2</sub> 受體拮抗效應。

#### 藥學試驗 4

對鼠隻之 (±) D-2,5-二甲氧基-4-碘基安非它命 (DOI) 誘導性頭部抽動之抑制效應

使用 Wistar 鼠 (雄性，六-七星期大，Japan SLC, Inc.) 作為測試動物。使用瑪瑙研鉢令測試化合物懸浮於 5 %阿拉伯膠 / (生理食鹽水或水) 中，如有需要，再以相同之溶劑稀釋。

在試驗之前，令測試動物禁食過夜。將每一測試化合物經口投服 (5 毫升/公斤) 後，將 DOI (5.0 毫克/公斤) 由皮下投服 (1 毫升/公斤) 1 小時。在注射 DOI 後，立刻計數頭抽動數 10 分鐘。每一群使用六隻測試動物。

非-臨床之統計分析系統乃供所有統計處理用。當顯

(580)

著機率小於 0.05 時，則判定存在顯著差異。溶劑投服群與每一測試化合物投服群間之頭抽動數之差異則使用 t-檢驗或唐那茲 (Dunnett's) 檢驗來分析。此外，亦使用線性回歸分析以供計算 50 %有效劑量 (95 %信賴區間)。

既然測試化合物顯示對 DOI 誘導性頭部抽動之抑制效應，故證實測試化合物具有血清素 5HT<sub>2A</sub> 受體拮抗效應。

## 藥學試驗 5

### 鼠隻之僵直症誘導效應

使用 Wistar 鼠 (雄性，六-七星期大，Japan SLC, Inc.) 作為測試動物。使用瑪瑙研鉢令測試化合物懸浮於 5 %阿拉伯膠 / (生理食鹽水或水) 中，如有需要，再以相同之溶劑稀釋。

在試驗之前，令測試動物禁食過夜。將每一測試化合物經口投服 (5 毫升/公斤) 後之 1, 2, 4, 6 及 8 小時進行對僵直症及脫垂症之觀察。每一群使用六隻測試動物。

將鼠之前爪置於鋼製小盒 (寬：6.5 公分，深：4.0 公分，高：7.2 公分) 之邊緣上 (不自然的姿勢)，當鼠保持此姿勢超過 30 秒時，則判定此案例為僵直症陽性。此觀察在每個時點進行三次，如果有至少有一例為陽性，則判定此個體發生僵直症。

結果顯示測試化合物之僵直症誘導效應與對阿撲嗎啡-誘導性定型行為之抑制效應並無關聯，因此降低了臨床上對錐體外副作用之憂慮。

(581)

## 藥學試驗 6

藉鼠腦之神經突觸體測量測試化合物之血清素 (5-HT) 吸收抑制活性

將 Wistar 雄性鼠斬首，將腦拿出，將額葉皮質解剖出，再使用波特 (Potter) 均化器將其於 20 倍於組織重之重之 0.32M 蔗糖溶液中均化。將均化物於 4°C 下以 1,000×g 之速離心 10 分鐘，將所得上層液進一步於 4°C 下以 20,000×g 之速離心 20 分鐘，令丸劑懸浮於保溫緩衝液 (20 mM Hepes 緩衝液 (pH 7.4)，內含 10 mM 葡萄糖，145 mM 氯化鈉，4.5 mM 氯化鉀，1.2 mM 氯化鎂，1.5 mM 氯化鈣) 中，其乃用以作為粗製之神經突觸體部分。

5-HT 吸收反應係以 200 微升之量，使用 96 孔式圓底盤進行，且於反應後立即將丙炔甲基苄胺 (最終濃度 10  $\mu$  M) 及抗壞血酸鈉 (最終濃度 0.2 毫克/毫升) 含於保溫緩衝液中並使用之。

將保溫緩衝液 (總計數)，未標記之 5-HT (最終濃度 10  $\mu$  M，非特異性之計數) 及經稀釋之測試化合物 (最終濃度 300 nM) 加至每一孔中。將佔最終量之十分之一量之神經突觸體部分加入，於 37°C 下預保溫 10 分鐘後，將標記氘之 5-HT 溶液 (最終濃度 8 nM) 加入，並於 37°C 下令吸收反應開始。吸收時間為 10 分鐘，且反應乃藉通過 96 孔式玻璃纖維濾紙盤中進行真空過濾予以終止，將濾紙以冷生理食鹽水清洗後，將其充分乾燥，將



(582)

Microscint0 ( Perkin-Elmer ) 加至濾紙中，再測量濾紙上所餘留之放射活性。

血清素吸收抑制活性 ( % ) 之算法係將總計數之放射活性設為 100 %，將非特異性計數設為 0 %，再由測試化合物所得之計數中計算出。

5-HT 之抑制作用 % ( % ) =  $100 - [ ( \text{測試化合物所得之計數} - \text{非特異性計數} ( \% \text{吸收率} ) ) / ( \text{總計數} ( 100 \% \text{吸收率} ) - \text{非特異性計數} ( \% \text{吸收率} ) ) ] \times 100$

結果乃示於下表 314 中。

(583)

[表 314]

測試化合物	血清素吸收抑率(%) (300nM)
實例 11 化合物	95.2
實例 15 化合物	95.3
實例 802 化合物	96.6
實例 1071 化合物	94.4
實例 1076 化合物	87.8
實例 1089 化合物	85.0
實例 1083 化合物	96.3
實例 1106 化合物	69.9
實例 1079 化合物	82.3
實例 1080 化合物	95.6
實例 1138 化合物	67.2
實例 1059 化合物	97.2
實例 1060 化合物	97.5
實例 1061 化合物	97.5
實例 1110 化合物	38.5
實例 1086 化合物	98.6
實例 1087 化合物	97.1
實例 1113 化合物	59.3

## 製備實例

將 100 克本發明化合物，40 克 Avicel (商標名 Asahi Chemical Industry Co., Ltd. 的產品)，30 克玉米澱粉及 2

(584)

克硬脂酸鎂混合及磨亮，再使用供醣外被（glycocalyx）R10 mm 用之杵予以製成片劑。

使用由 10 克 TC-5（商標名，Shin-Etsu Chemical Co., Ltd. 的產品，羥丙基甲基纖維素），3 克聚乙二醇 6000，40 克蓖麻油及適量乙醇所製之薄膜，將所得片劑包上此薄膜，即製得具有上示組份之薄膜衣片劑。

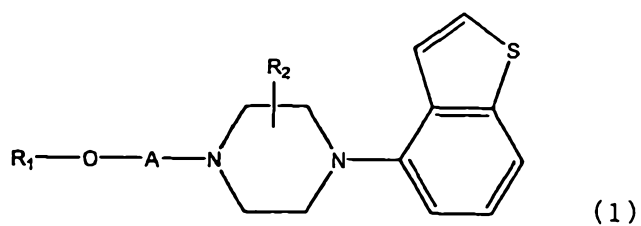
七、指定代表圖：

(一)、本案指定代表圖為：無

(二)、本代表圖之元件代表符號簡單說明：無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：式(1)

[式 1]



(此處由本局於收  
文時黏貼條碼)

公告本

## 發明專利說明書

99年4月27日修正頁

(本申請書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：95132016

※申請日期：95 年 08 月 30 日

※IPC 分類：

C07D 409/12 2006.01  
C07D 333/54 2006.01  
A61P 25/00 2006.01

## 一、發明名稱：

(中) (苯並 [b] 噻吩-4-基) 六氫吡啶化合物，含彼之藥學組成物，彼之用途以及彼之製造方法

(英) (Benzo[b]thiophen-4-yl)piperazine compounds, pharmaceutical compositions comprising the same, uses of the same and processes for preparing the same

## 二、申請人：(共 1 人)

1. 姓名：(中) 大塚製藥股份有限公司

(英) OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.

代表人：(中) 樋口達夫

(英) 1.HIGUCHI, TATSUO

地址：(中) 日本國東京都千代田區神田司町二丁目九番地

(英) 9, Kanda-Tsukasacho 2-chome, Chiyoda-ku, Tokyo, Japan

國籍：(中英) 日本 JAPAN

## 三、發明人：(共 15 人)

1. 姓名：(中) 山下博司

(英) YAMASHITA, HIROSHI

國籍：(中) 日本

(英) JAPAN

2. 姓名：(中) 黑田英明

(英) KURODA, HIDEAKI

國籍：(中) 日本

(英) JAPAN

3. 姓名：(中) 伊藤展明

(英) ITO, NOBUAKI

國籍：(中) 日本

(英) JAPAN

99-4月27日 第三替换页

4.姓 名：(中) 宮村伸  
(英) MIYAMURA, SHIN  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

5.姓 名：(中) 大島邦生  
(英) OSHIMA, KUNIO  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

6.姓 名：(中) 松原淳  
(英) MATSUBARA, JUN  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

7.姓 名：(中) 高橋永  
(英) TAKAHASHI, HARUKA  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

8.姓 名：(中) 福島多恵  
(英) FUKUSHIMA, TAE  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

9.姓 名：(中) 清水聰  
(英) SHIMIZU, SATOSHI  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

10.姓 名：(中) 近藤一見  
(英) KONDO, KAZUMI  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

11.姓 名：(中) 櫻井庸二  
(英) SAKURAI, YOHJI  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

12.姓 名：(中) 黒田武志  
(英) KURODA, TAKESHI  
國 籍：(中) 日本  
(英) JAPAN

99年4月27日修(更)正替換頁

13. 姓名: (中) 平良伸一  
(英) TAIRA, SHINICHI  
國籍: (中) 日本  
(英) JAPAN
14. 姓名: (中) 糸谷元宏  
(英) ITOTANI, MOTOHIRO  
國籍: (中) 日本  
(英) JAPAN
15. 姓名: (中) 田中達義  
(英) TANAKA, TATSUYOSHI  
國籍: (中) 日本  
(英) JAPAN

77-4月27日修(更)正審檢頁

762918

**四、聲明事項：**◎本案申請前已向下列國家（地區）申請專利 ☐ 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 日本 ; 2005/08/31 ; 2005-251055 ☒ 有主張優先權



(1)

99 4 27

## 九、發明說明

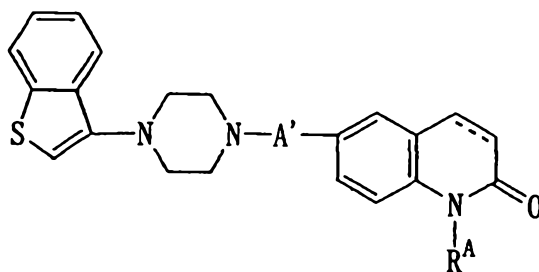
## 【發明所屬之技術領域】

本發明係關於新穎之雜環型化合物。

## 【先前技術】

既然精神分裂症以及躁鬱症，情感性病症及情緒性病症之致病因素為異源性，故期望藥物具有多重藥學效應以便能發展出廣效性治療。

WO2004/026864A1 揭示下式所代表之喹諾酮衍生物：



(其中 A' 為  $-(CH_2)_mCH_2-$ ， $-(CH_2)_mO-$  等；m 代表 1 至 4 之整數；且 R<sup>A</sup> 代表氫原子，可經 1 至 3 個氟原子取代之 C<sub>1-4</sub> 烷基團等) 具有 D<sub>2</sub> 受體拮抗活性及血清素 2A (5-HT<sub>2A</sub>) 受體拮抗活性，故有效以供治療精神分裂症及其它中樞神經系統病症。

然而 WO2004/026864A1 中並沒有說明文件中所述之喹諾酮衍生物具有 D<sub>2</sub> 受體部分激動劑活性，5-HT<sub>2A</sub> 受體拮抗劑活性， $\alpha_1$  受體拮抗劑活性及血清素吸收抑制活性且具有廣效性治療。

WO2005/019215 A1 揭示下式所代表之化合物：

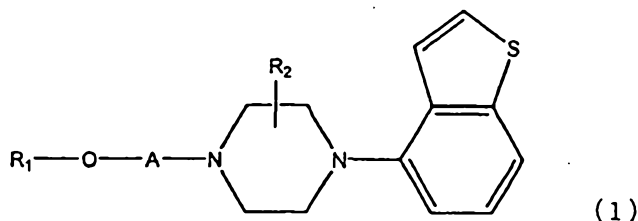
99427

## 五、中文發明摘要

發明之名稱：(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡嗪化合物，  
含彼之藥學組成物，彼之用途以及彼之製  
造方法

本發明係關於式(1)所代表之雜環型化合物或其  
鹽：

[式 1]



其中  $R^2$  代表氫原子或低級烷基團；

A 代表低級烷撐基團或低級烯撐基團；且

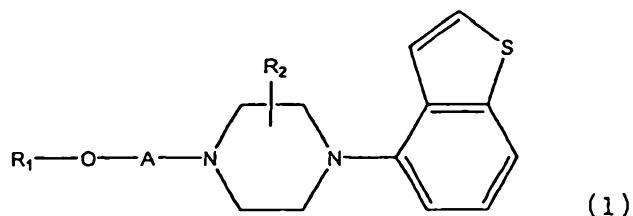
$R^1$  代表芳族基團或雜環型基團。本發明化合物對於精神病症包括中樞神經系統病症具有廣效性之治療，且無副作用並具有高度安全性。

## 六、英文發明摘要

發明之名稱：(Benzo[b]thiophen-4-yl)piperazine compounds, pharmaceutical compositions comprising the same, uses of the same and processes for preparing the same

A heterocyclic compound or a salt thereof  
represented by the formula (1):

[Formula 1]



where  $R^2$  represents a hydrogen atom or a lower alkyl group;

A represents a lower alkylene group or lower alkenylene group; and

$R^1$  represents an aromatic group or a heterocyclic group. The compound of the present invention has a wide treatment spectrum for mental disorders including central nervous system disorders, no side effects and high safety.

## 十、申請專利範圍

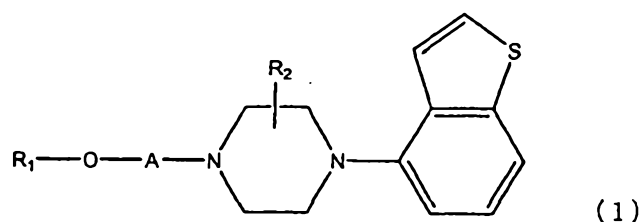
第 95132016 號 專 利 申 請 案

中文申請專利範圍修正本

民國 99 年 4 月 27 日 修正

1. 一種式 (1) 所代表之化合物或其鹽：

[式 1]

其中  $R^2$  代表氫原子或 C1-C6 烷基團；

A 代表 C1-C6 烷撐基團或 C2-C6 烯撐基團；且

$R^1$  代表擇自下列 (I) 至 (IV) 之環 C3-C8 烷基團、  
芳族基團或雜環型基團：

(I) 環 C3-C8 烷基團；

(II) 擇自苯基團、萘基團、二氫茚基團及四氫萘基  
團中之芳族基團；

(III) 具有 1 至 4 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中  
之雜原子之飽和或不飽和雜單環型基團；及

(IV) 具有 1 至 4 個擇自氮原子、氧原子及硫原子中  
之雜原子之苯稠合性雜環型基團，其擇自 (1) 四氫喹啉  
基團，(2) 四氫喹啉基團，(3) 二氫喹啉基團，  
(4) 吡啶基團，(5) 吡啶基團，(6) 異吡啶基

團，（7）苯並咪唑基團，（8）二氫苯並咪唑基團，（9）四氫苯並氮雜草基團，（10）四氫苯並二氮雜草基團，（11）六氫苯並吡辛因基團，（12）二氫苯並噁吡基團，（13）二氫苯並噁唑基團，（14）苯並異噁唑基團，（15）苯並噁二唑基團，（16）四氫苯並氧氮雜草基團，（17）二氫苯並噻吡基團，（18）苯並噻唑基團，（19）苯並噁噻基團，（20）吡烯基團，（21）二氫苯並呋喃基團，（22）吡唑基團，（23）二苯並呋喃基團及（24）喹噁啉基團；

其中至少有一個擇自下列（1）至（66）中之基團可存在於  $R^1$  所代表之環 C3-C8 烷基團、芳族基團及雜環型基團上以作為取代基：

- （1）C1-C6 烷基團，
- （2）C2-C6 烯基團，
- （3）經鹵素取代之 C1-C6 烷基團，
- （4）C1-C6 烷氧基團，
- （5）芳氧基團，
- （6）C1-C6 烷硫基團，
- （7）經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團，
- （8）羥基團，
- （9）經保護之羥基團，
- （10）羥基 C1-C6 烷基團，
- （11）經保護之羥基 C1-C6 烷基團，
- （12）鹵素原子，

( 13 ) 氰基團，

( 14 ) 芳基團，

( 15 ) 硝基團，

( 16 ) 胺基團，

( 17 ) 胺基團 ( 其具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷  
醯基團、C1-C6 烷氧羰基團、C1-C6 烷磺醯基團、胺基甲  
醯基團、C1-C6 烷基胺基甲醯基團、胺基 C1-C6 烷醯基  
團、C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧基羰胺  
基 C1-C6 烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ，

( 18 ) C1-C6 烷醯基團，

( 19 ) 芳磺醯基團 ( 其可於芳基團上具有 C1-C6 烷基  
團 ) ，

( 20 ) 羧基團，

( 21 ) C1-C6 烷氧羰基團，

( 22 ) 羧基 C1-C6 烷基團，

( 23 ) C1-C6 烷氧羰基 C1-C6 烷基團，

( 24 ) C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團，

( 25 ) 羧基 C2-C6 烯基團，

( 26 ) C1-C6 烷氧羰基 C2-C6 烯基團，

( 27 ) 胺基甲醯基 C2-C6 烯基團 ( 其可具有擇自 C1-  
C6 烷基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團以作為  
取代基 ) ，

( 28 ) 胺基甲醯基團，其可具有擇自下列 ( i ) 至  
( lxxviii ) 中之基團以作為取代基：

- ( i ) C1-C6 烷基團 ,
- ( ii ) C1-C6 烷氧基團 ,
- ( iii ) 經基 C1-C6 烷基團 ,
- ( iv ) C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團 ,
- ( v ) 芳氧基 C1-C6 烷基團 ,
- ( vi ) 經鹵素取代之 C1-C6 烷基團 ,
- ( vii ) 胺基 C1-C6 烷基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、芳醯基團及胺基甲醯基團中之基團 ) ,
- ( viii ) 環 C3-C8 烷基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團、經基團、C1-C6 烷氧羰基團及苯基 C1-C6 烷氧基團中之基團以作為取代基 ) ,
- ( ix ) 經環 C3-C8 烷基取代之 C1-C6 烷基團 ,
- ( x ) C2-C6 烯基團 ,
- ( xi ) 胺基甲醯基 C1-C6 烷基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團、苯基團 ( 可具有 C1-C6 烷基團 ) 及苯基團 ( 可具有 C1-C6 烷氧基團 ) 中之基團以作為取代基 ) ,
- ( xii ) C1-C6 烷氧羰基 C1-C6 烷基團 ,
- ( xiii ) 呋喃基 C1-C6 烷基團 ( 其可於呋喃基團上具有 C1-C6 烷基團以作為取代基 ) ,
- ( xiv ) 四氫呋喃基 C1-C6 烷基團 ,
- ( xv ) 1,3-二噁茂烷基 C1-C6 烷基團 ,
- ( xvi ) 四氫吡喃基 C1-C6 烷基團 ,
- ( xvii ) 吡咯基 C1-C6 烷基團 ( 其可於吡咯基團上具

有 C1-C6 烷基團以作為取代基），

( xviii ) 經二氫吡唑基團取代之 C1-C6 烷氧基團（其可具有酮基團），

( xix ) 吡唑基 C1-C6 烷基團（其可於吡唑基團上具有 C1-C6 烷基團以作為取代基），

( xx ) 咪唑基 C1-C6 烷基團，

( xxi ) 吡啶基 C1-C6 烷基團，

( xxii ) 吡嗪基 C1-C6 烷基團（其可於吡嗪基團上具有 C1-C6 烷基團以作為取代基），

( xxiii ) 吡咯啶基 C1-C6 烷基團（其可於吡咯啶基團上具有擇自酮基團及 C1-C6 烷基團中之基團以作為取代基），

( xxiv ) 六氫吡啶基 C1-C6 烷基團（其可於六氫吡啶基團上具有擇自苯甲醯基團及 C1-C6 烷醯基團中之基團以作為取代基），

( xxv ) 六氫吡嗪基 C1-C6 烷基團（其可於六氫吡嗪基團上具有 C1-C6 烷基團以作為取代基），

( xxvi ) 嗎啉基 C1-C6 烷基團，

( xxvii ) 噻吩基 C1-C6 烷基團（其可於噻吩基團上具有 C1-C6 烷基團以作為取代基），

( xxviii ) 噻唑基 C1-C6 烷基團，

( xxix ) 二氫苯並呋喃基 C1-C6 烷基團，

( xxx ) 苯並呋喃基 C1-C6 烷基團（其可於苯並呋喃基團上具有酮基團以作為取代基），

( xxxi ) 苯並咪唑基 C1-C6 烷基團，

( xxxii ) 吡啶基 C1-C6 烷基團（其可於 C1-C6 烷基團上具有 C1-C6 烷氧羰基團），

( xxxiii ) 咪唑基 C1-C6 烷基團（其可於 C1-C6 烷基團上具有擇自胺基甲醯基團及 C1-C6 烷氧羰基團中之取代基），

( xxxiv ) 吡啶基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧基團及 C1-C6 烷硫基 C1-C6 烷基團中之基團以作為取代基），

( xxxv ) 吡咯啉基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧羰基團、C1-C6 烷醯基團及芳醯基團中之基團以作為取代基），

( xxxvi ) 六氫吡啶基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧羰基團、C1-C6 烷醯基團及芳醯基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團及鹵素原子中之基團以作為取代基）中之基團），

( xxxvii ) 四氫呋喃基團（其可具有酮基團），

( xxxviii ) 六氫氮雜草基團（其可具有酮基團），

( xxxix ) 吡唑基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團、芳基團及呋喃基團中之基團以作為取代基），

( xl ) 噻唑基團，

( xli ) 噻二唑基團（其可具有 C1-C6 烷基團），

( xlii ) 異噁唑基團（其可具有 C1-C6 烷基團），

( xliii ) 吡唑基團，



( xliv ) 吡啶基團，

( xlv ) 四氫苯並噻唑基團，

( xlvi ) 四氫喹啉基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧基團、鹵素原子及酮基團中之基團以作為取代基），

( xlvii ) 喹啉基團（其可具有 C1-C6 烷基團），

( xlviii ) 苯並二噁茂基 C1-C6 烷基團，

( xlix ) 芳基團（其可具有擇自

鹵素原子；C1-C6 烷基團；C1-C6 烷氧基團；經鹵素取代之 C1-C6 烷基團；經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團；C2-C6 烯基團；胺基團（其可具有擇自 C1-C6 烷醯基團，C1-C6 烷磺醯基團，C1-C6 烷基團及芳基團中之基團）；胺基磺醯基團；C1-C6 烷硫基團；C1-C6 烷醯基團；C1-C6 烷氧羰基團；吡咯基團；C2-C6 炔基團；氰基團；硝基團；芳氧基團；芳基 C1-C6 烷氧基團；羥基團；羥基 C1-C6 烷基團；胺基甲醯基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基及芳基團中之基團）；吡唑基團；吡咯啉基團（其可具有酮基團）；噁唑基團；咪唑基團（其可具有 C1-C6 烷基團）；二氫呋喃基團（其可具有酮基團）；噻唑啉基 C1-C6 烷基團（其可具有酮基團）；咪唑基 C1-C6 烷醯基團及六氫吡啶羰基團中之基團以作為取代基），

( 1 ) 氰基 C1-C6 烷基團，

( li ) 二氫喹啉基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團及酮基團中之基團），

- ( l ii ) 經 鹵 素 取 代 之 C1-C6 烷 胺 基 團 ，
- ( l i i i ) C1-C6 烷 硫 基 C1-C6 烷 基 團 ，
- ( l i v ) 脒 基 團 ( 其 可 具 有 C1-C6 烷 基 團 ) ，
- ( l v ) 脒 基 C1-C6 烷 基 團 ，
- ( l v i ) C2-C6 烯 氧 基 C1-C6 烷 基 團 ，
- ( l v i i ) 芳 胺 基 團 ( 其 可 於 芳 基 團 上 具 有 擇 自 C1-C6 烷 基 團 ， C1-C6 烷 氧 基 團 ， 經 鹵 素 取 代 之 C1-C6 烷 基 團 及 經 鹵 素 取 代 之 C1-C6 烷 氧 基 團 中 之 取 代 基 ) ，
- ( l v i i i ) 芳 基 C2-C6 烯 基 團 ，
- ( l i x ) 吡 啶 基 胺 基 團 ( 其 可 具 有 C1-C6 烷 基 團 ) ，
- ( l x ) 芳 基 C1-C6 烷 基 團 ( 其 可 於 芳 基 團 及 / 或 C1-C6 烷 基 團 上 具 有 擇 自 鹵 素 原 子 ， C1-C6 烷 基 團 ， 經 鹵 素 取 代 之 C1-C6 烷 基 團 ， 經 鹵 素 取 代 之 C1-C6 烷 氧 基 團 ， C1-C6 烷 氧 基 團 ， 胺 基 甲 醯 基 團 ， 及 C1-C6 烷 氧 羰 基 團 中 之 基 團 以 作 為 取 代 基 ) ，
- ( l x i ) C2-C6 炔 基 團 ，
- ( l x i i ) 芳 氧 基 C1-C6 烷 基 團 ( 其 可 於 芳 基 團 上 具 有 擇 自 C1-C6 烷 氧 基 團 ； 胺 基 甲 醯 基 團 ( 其 可 具 有 擇 自 C1-C6 烷 氧 基 團 及 C1-C6 烷 基 團 中 之 基 團 ) ； 及 吡 咯 啶 基 團 ( 其 可 具 有 酮 基 團 ) 中 之 基 團 以 作 為 取 代 基 ) ，
- ( l x i i i ) 異 噁 唑 啶 基 團 ( 其 可 具 有 酮 基 團 ) ，
- ( l x i v ) 二 氫 茛 基 團 ，
- ( l x v ) 芳 基 C1-C6 烷 氧 基 C1-C6 烷 基 團 ，
- ( l x v i ) 四 氫 哌 喃 基 團 ，

( lxvii ) 吡丁啖基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷醯基團及芳醯基團中之基團 ) ，

( lxviii ) 吡丁啖基 C1-C6 烷基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷醯基團及芳醯基團中之基團 ) ，

( lxix ) 四唑基團 ，

( lxx ) 吡啶基團 ( 其可具有酮基團 ) ，

( lxxi ) 三唑基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團及 C1-C6 烷硫基團中之基團 ) ，

( lxxii ) 咪唑基團 ( 其可具有胺基甲醯基團 ) ，

( lxxiii ) 噁唑基團 ( 其可具有 C1-C6 烷基團 ) ，

( lxxiv ) 異噻唑基團 ( 其可具有 C1-C6 烷基團 ) ，

( lxxv ) 苯並咪唑基團 ，

( lxxvi ) 二氫苯並噻唑基團 ( 其可具有酮基團 ) ，

( lxxvii ) 噻吩基團 ( 其可具有 C1-C6 烷氧羰基團 ) ，

( lxxviii ) 噁唑基 C1-C6 烷基團 ( 其可具有 C1-C6 烷基團 ) ，

( 29 ) 胺基 C1-C6 烷基團 ( 其可於胺基團上具有擇自 C1-C6 烷基團，經鹵素取代之 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧羰基團，C1-C6 烷醯基團，芳基團，芳基 C1-C6 烷基團，芳醯基團，及經胺基取代之烷基團 ( 經胺基取代之烷基團中之胺基團上，可存在 C1-C6 烷基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ，

( 30 ) 經胺基甲醯基團取代之 C1-C6 烷基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基

團) ,

( 31 ) 硫代胺基甲醯基團 ( 其可具有 C1-C6 烷基團 ) ,

( 32 ) 胺基磺醯基團 ,

( 33 ) 噁唑啉基團 ( 其可具有酮基團 ) ,

( 34 ) 咪唑啉基團 ( 其可具有擇自酮基團及 C1-C6 烷基團中之基團 ) ,

( 35 ) 吡咯啉基團 ( 其可具有酮基團 ) ,

( 36 ) 咪唑基團 ,

( 37 ) 三唑基團 ,

( 38 ) 異噁唑基團 ,

( 39 ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、芳磺醯基團、酮基團、羥基團及胺基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷氧羰基團及 C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團中之基團 ) 中之基團作為取代基 ) ,

( 40 ) 六氫吡啶基羰基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團、羥基團、羥基 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、羧基 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷基胺基甲醯基 C1-C6 烷基團、胺基甲醯基團、C1-C6 烷氧基團、羧基團、C1-C6 烷氧羰基團、胺基團 ( 其上可存在 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷氧羰基團及芳醯基團中之基團 ) , 六氫吡啶基團 ( 其上可存在擇自 C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷氧羰基團及芳醯基團中之基團 ) , 六氫吡啶基團

(其上可存在 C1-C6 烷基團以作為取代基)，1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基團，嗎啉基團，六氫-1,4-二氮雜草基團(其上可存在 C1-C6 烷基團以作為取代基)，吡啶基團，吡啶氧基團，吡啶基 C1-C6 烷氧基團，四氫喹啉基團(其上可存在酮基團)，苯並二噁茂基團，芳基 C1-C6 烷氧基團(其可於芳基團上具有擇自鹵素原子，C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團中之基團)，芳基團(其上可存在擇自鹵素原子，C1-C6 烷氧基團及羥基團中之基團)，芳氧基團(其可於芳基團上具有擇自氰基團，鹵素原子，C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團)，芳基 C1-C6 烷基團(其可於芳基團上具有擇自鹵素原子，C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團)，及芳醯基團(其可於芳基團上具有擇自鹵素原子及 C1-C6 烷氧基團中之基團)中之基團作為取代基)，

(41) 吡咯啉基羰基團(其可具有擇自羥基 C1-C6 烷基團，胺基甲醯基團，羥基團，胺基團(胺基團上可具有擇自 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷醯基團及芳醯基團中之基團)，嗎啉基 C1-C6 烷基團，吡咯啉基 C1-C6 烷基團，六氫吡啶基 C1-C6 烷基團，六氫吡咩基 C1-C6 烷基團(六氫吡咩基團上可具有 C1-C6 烷基團以作為取代基)，胺基 C1-C6 烷基團(胺基團上可具有 C1-C6 烷基團以作為取代基)，及芳氧基團(芳基團上可具有經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團)，芳氧基 C1-C6 烷基團(芳基團上可存在經鹵

素取代之 C1-C6 烷氧基團)，及四氫喹啉基團（其上可存在酮基團）中之基團作為取代基），

（42）六氫吡咩基羰基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團，環 C3-C8 烷基團，C1-C6 烷醯基團，羥基 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧羰基團，胺基 C1-C6 烷基團（胺基團上可具有 C1-C6 烷基團以作為取代基），六氫吡啶基 C1-C6 烷基團（六氫吡啶基團上可具有 C1-C6 烷基團以作為取代基），嗎啉基 C1-C6 烷基團，吡咯啶基 C1-C6 烷基團，1,3-二噁茂烷基 C1-C6 烷基團，四氫呋喃基 C1-C6 烷基團，吡啶基 C1-C6 烷基團（C1-C6 烷基團上可具有苯基團以作為取代基），咪唑基 C1-C6 烷基團，呋喃基 C1-C6 烷基團，吡咯啶基羰基 C1-C6 烷基團，六氫吡啶基團（其可具有 C1-C6 烷基團以作為取代基），吡啶基團（吡啶基團上可存在擇自 C1-C6 烷基團，氰基團，及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團以作為取代基），噻吩並[2,3-b]吡啶基團，芳基團（其上可存在擇自鹵素原子及 C1-C6 烷基團中之基團），芳醯基團，呋喃基羰基團，芳基 C1-C6 烷氧羰基團及酮基團中之基團作為取代基），

（43）六氫氮雜草基羰基團，

（44）六氫-1,4-二氮雜草基羰基團（其可具有擇自 C1-C6 烷基團及吡啶基團中之取代基），

（45）二氫吡咯基羰基團（其可具有 C1-C6 烷基團），

( 46 ) 硫代嗎啉基羰基團，

( 47 ) 嗎啉基羰基團 ( 其可具有擇自 C1-C6 烷基團、六氫吡啶基 C1-C6 烷基團、及芳基團中之基團 )，

( 48 ) 噻唑啉基羰基團 ( 其可具有芳基團且芳基團可具有擇自 C1-C6 烷氧基團及氰基團中之基團 )，

( 49 ) 氮雜二環 [3.2.2] 壬基羰基團，

( 50 ) 8-氮雜二環 [3.2.1] 辛基羰基團 ( 其可具有經鹵素取代或未經取代之芳氧基團 )，

( 51 ) 吲哚啉基羰基團，

( 52 ) 四氫喹啉基羰基團，

( 53 ) 四氫吡啶並 [3.4-b] 吲哚基羰基團，

( 54 ) 嗎啉基 C1-C6 烷基團，

( 55 ) 六氫吡啶基 C1-C6 烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 C1-C6 烷基團 )，

( 56 ) 嗎啉基羰基 C1-C6 烷基團，

( 57 ) 六氫吡啶基羰基 C1-C6 烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 C1-C6 烷基團 )，

( 58 ) 酮基團，

( 59 ) 胺基 C1-C6 烷氧基團 ( 於胺基團上可存在 C1-C6 烷基團 )，

( 60 ) C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷氧基團，

( 61 ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有擇自酮基團、C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧羰基團中之基團 )，

( 62 ) 嗎 啉 基 團 ，

( 63 ) 1,3,8-三 氮 雜 螺 [4.5] 癸 基 羰 基 團 ( 其 可 具 有 擇 自 酮 基 團 及 芳 基 團 中 之 基 團 ) ，

( 64 ) 四 氫 吡 啶 基 羰 基 團 ( 其 可 具 有 吡 啶 基 團 ) ，

( 65 ) 咪 唑 啶 基 羰 基 團 ( 其 可 具 有 硫 酮 基 團 ) ，

( 66 ) 1,4-二 氧 雜 -8-氮 雜 螺 [4.5] 癸 基 團 。

2. 根 據 申 請 專 利 範 圍 第 1 項 之 化 合 物 ， 其 中

$R^1$  代 表 擇 自 下 列 ( I ) 至 ( IV ) 之 環 C5-C6 烷 基 團 、 芳 族 基 團 或 雜 環 型 基 團 ；

( I ) 環 C5-C6 烷 基 團 ；

( II ) 擇 自 苯 基 團 、 萘 基 團 、 二 氫 茚 基 團 及 四 氫 萘 基 團 中 之 芳 族 基 團 ；

( III ) 具 有 1 至 2 個 擇 自 氮 原 子 、 氧 原 子 及 硫 原 子 中 之 雜 原 子 之 飽 和 或 不 飽 和 雜 單 環 型 基 團 ， 其 擇 自 吡 咯 啶 基 團 、 六 氫 吡 啶 基 團 、 吡 唑 基 團 、 吡 啶 基 團 、 嘧 啶 基 團 、 吡 咩 基 團 、 異 噁 唑 基 團 、 噻 唑 基 團 、 哌 喃 基 團 、 及 噻 吩 基 團 ； 及

( IV ) 具 有 1 至 4 個 擇 自 氮 原 子 、 氧 原 子 及 硫 原 子 中 之 雜 原 子 之 苯 稠 合 性 雜 環 型 基 團 ， 其 擇 自 ( 1 ) 四 氫 喹 噁 啉 基 團 ， ( 2 ) 四 氫 喹 唑 啉 基 團 ， ( 3 ) 二 氫 喹 唑 啉 基 團 ， ( 4 ) 吲 哚 啉 基 團 ， ( 5 ) 吲 哚 基 團 ， ( 6 ) 異 吲 哚 啉 基 團 ， ( 7 ) 苯 並 咪 唑 基 團 ， ( 8 ) 二 氫 苯 並 咪 唑 基 團 ， ( 9 ) 四 氫 苯 並 氮 雜 草 基 團 ， ( 10 ) 四 氫 苯 並 二 氮 雜 草 基 團 ， ( 11 ) 六 氫 苯 並 吡 辛 因 基 團 ， ( 12 ) 二 氫 苯 並 噁 吡 基



團，（13）二氫苯並噁唑基團，（14）苯並異噁唑基團，（15）苯並噁二唑基團，（16）四氫苯並氧氮雜草基團，（17）二氫苯並噻吡基團，（18）苯並噻唑基團，（19）苯並噁噻基團，（20）吡烯基團，（21）二氫苯並呋喃基團，（22）吡唑基團，（23）二苯並呋喃基團及（24）喹噁啉基團；

其中  $R^1$  所代表之芳族基團及雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自下列（1）至（66）中之基團以作為取代基：

- （1）C1-C6 烷基團，
- （2）C2-C6 烯基團，
- （3）經鹵素取代之 C1-C6 烷基團，
- （4）C1-C6 烷氧基團，
- （5）苯氧基團，
- （6）C1-C6 烷硫基團，
- （7）經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團，
- （8）羥基團，
- （9）苯基 C1-C6 烷氧基團，
- （10）羥基 C1-C6 烷基團，
- （11）C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團，
- （12）鹵素原子，
- （13）氰基團，
- （14）苯基團，
- （15）硝基團，
- （16）胺基團，

( 17 ) 胺基團 ( 其具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷氧羰基團、C1-C6 烷磺醯基團、胺基甲醯基團、C1-C6 烷基胺基甲醯基團、胺基 C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧基羰胺基 C1-C6 烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ,

( 18 ) C1-C6 烷醯基團 ,

( 19 ) 苯磺醯基團 ( 其可於苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團 ) ,

( 20 ) 羧基團 ,

( 21 ) C1-C6 烷氧羰基團 ,

( 22 ) 羧基 C1-C6 烷基團 ,

( 23 ) C1-C6 烷氧羰基 C1-C6 烷基團 ,

( 24 ) C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團 ,

( 25 ) 羧基 C2-C6 烯基團 ,

( 26 ) C1-C6 烷氧羰基 C2-C6 烯基團 ,

( 27 ) 胺基甲醯基 C2-C6 烯基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團及經 1 至 3 個鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團以作為取代基 ) ,

( 28 ) 胺基甲醯基團 , 其可具有 1 至 2 個擇自下列 ( i ) 至 ( lxxviii ) 中之基團以作為取代基 :

( i ) C1-C6 烷基團 ,

( ii ) C1-C6 烷氧基團 ,

( iii ) 羥基 C1-C6 烷基團 ,

( iv ) C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團 ,

(v) 苯氧基 C1-C6 烷基團，

(vi) 經鹵素取代之 C1-C6 烷基團，

(vii) 胺基 C1-C6 烷基團（其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、苯甲醯基團及胺基甲醯基團中之基團），

(viii) 環 C3-C8 烷基團（其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、羥基團、C1-C6 烷氧羰基團及苯基 C1-C6 烷氧基團中之基團以作為取代基），

(ix) 經環 C3-C8 烷基取代之 C1-C6 烷基團，

(x) C2-C6 烯基團，

(xi) 具 1 至 2 個胺基甲醯基團之 C1-C6 烷基團（其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、苯基團（可具有單一之 C1-C6 烷基團）及苯基團（可具有單一之 C1-C6 烷氧基團）中之基團以作為取代基），

(xii) 具有 1 至 2 個 C1-C6 烷氧羰基團之 C1-C6 烷基團，

(xiii) 呋喃基 C1-C6 烷基團（其可於呋喃基團上具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代基），

(xiv) 四氫呋喃基 C1-C6 烷基團，

(xv) 1,3-二噁茂烷基 C1-C6 烷基團，

(xvi) 四氫吡喃基 C1-C6 烷基團，

(xvii) 吡咯基 C1-C6 烷基團（其可於吡咯基團上具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代基），

(xviii) 經二氫吡啶基團取代之 C1-C6 烷氧基團（其

可具有單一之酮基團) ,

( xix ) 吡唑基 C1-C6 烷基團 ( 其可於吡唑基團上具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團以作為取代基 ) ,

( xx ) 咪唑基 C1-C6 烷基團 ,

( xxi ) 吡啶基 C1-C6 烷基團 ,

( xxii ) 吡嗪基 C1-C6 烷基團 ( 其可於吡嗪基團上具有 1 至 3 個 ( 最好 1 個 ) C1-C6 烷基團以作為取代基 ) ,

( xxiii ) 吡咯啶基 C1-C6 烷基團 ( 其可於吡咯啶基團上具有 1 至 2 個擇自酮基團及 C1-C6 烷基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxiv ) 六氫吡啶基 C1-C6 烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個擇自苯甲醯基團及 C1-C6 烷基醯基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxv ) 六氫吡嗪基 C1-C6 烷基團 ( 其可於六氫吡嗪基團上具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團以作為取代基 ) ,

( xxvi ) 嗎啉基 C1-C6 烷基團 ,

( xxvii ) 噻吩基 C1-C6 烷基團 ( 其可於噻吩基團上具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團以作為取代基 ) ,

( xxviii ) 噻唑基 C1-C6 烷基團 ,

( xxix ) 二氫苯並呋喃基 C1-C6 烷基團 ,

( xxx ) 苯並哌喃基 C1-C6 烷基團 ( 其可於苯並哌喃基團上具有單一之酮基團以作為取代基 ) ,

( xxxi ) 苯並咪唑基 C1-C6 烷基團 ,

( xxxii ) 吲哚基 C1-C6 烷基團 ( 其可於 C1-C6 烷基

團上具有 1 至 3 個 C1-C6 烷氧羰基團) ,

( xxxiii ) 咪唑基 C1-C6 烷基團 ( 其於 C1-C6 烷基團上具有 1 至 3 個擇自胺基甲醯基團及 C1-C6 烷氧羰基團中之取代基 ) ,

( xxxiv ) 吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧基團及 C1-C6 烷硫基 C1-C6 烷基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxxv ) 吡咯啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧羰基團、C1-C6 烷醯基團及苯甲醯基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xxxvi ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧羰基團、C1-C6 烷醯基團及苯甲醯基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團及鹵素原子中之基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ,

( xxxvii ) 四氫呋喃基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( xxxviii ) 六氫氮雜草基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( xxxix ) 吡唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、苯基團及呋喃基團中之基團以作為取代基 ) ,

( xl ) 噻唑基團 ,

( xli ) 噻二唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團 ) ,

( xlii ) 異噁唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基

團) ,

( xliii) 咧啞基團 ,

( xliv) 咧啞基團 ,

( xlv) 四氫苯並噻啞基團 ,

( xlvi) 四氫喹啉基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷氧基團、鹵素原子及酮基團中之基團以作為取代基) ,

( xlvii) 喹啉基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團) ,

( xlviii) 苯並二噁茂基 C1-C6 烷基團 ,

( xlix) 苯基團或萘基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自

鹵素原子 ; C1-C6 烷基團 ; C1-C6 烷氧基團 ; 經鹵素取代之 C1-C6 烷基團 ; 經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團 ; C2-C6 烯基團 ; 胺基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷醯基團 , C1-C6 烷磺醯基團 , C1-C6 烷基團及芳基團中之基團) ; 胺基磺醯基團 ; C1-C6 烷硫基團 ; C1-C6 烷醯基團 ; C1-C6 烷氧羰基團 ; 吡咯基團 ; C2-C6 炔基團 ; 氰基團 ; 硝基團 ; 苯氧基團 ; 苯基 C1-C6 烷氧基團 ; 羥基團 ; 羥基 C1-C6 烷基團 ; 胺基甲醯基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基及苯基團中之基團) ; 吡啞基團 ; 吡咯啞基團 ( 其可具有單一之酮基團) ; 噁啞基團 ; 咪啞基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團) ; 二氫呋喃基團 ( 其可具有單一之酮基團) ; 噻啞啞基 C1-C6 烷基團 ( 其可具有兩個酮基團) ; 咪啞基 C1-C6 烷醯基團及六氫吡啞啞基團中

之取代基)，

(1) 氟基 C1-C6 烷基團，

(li) 二氫喹啉基團（其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團及酮基團中之基團），

(lii) 經鹵素取代之 C1-C6 烷基胺基團，

(liii) C1-C6 烷基硫基 C1-C6 烷基團，

(liv) 脒基團（其可具有 C1-C6 烷基團），

(lv) 脒基 C1-C6 烷基團，

(lvi) C2-C6 烯氧基 C1-C6 烷基團，

(lvii) 苯胺基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基團，經鹵素取代之 C1-C6 烷基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團中之取代基），

(lviii) 苯基 C2-C6 烯基團，

(lix) 吡啶基胺基團（其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團），

(lx) 苯基 C1-C6 烷基團（其可於苯基團及/或 C1-C6 烷基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子，C1-C6 烷基團，經鹵素取代之 C1-C6 烷基團，經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團，C1-C6 烷氧基團，胺基甲醯基團，及 C1-C6 烷氧羰基團中之基團以作為取代基），

(lxi) C2-C6 炔基團，

(lxii) 苯氧基 C1-C6 烷基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷氧基團，N-C1-C6 烷氧基-N-C1-C6 烷基胺基甲醯基團，及酮基吡咯啉基團中之基團以作為取

代基) ,

( lxiii ) 異噁唑啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( lxiv ) 二氫茛基團 ,

( lxv ) 苯基 C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團 ,

( lxvi ) 四氫哌喃基團 ,

( lxvii ) 吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷醯基團及苯甲醯基團中之基團 ) ,

( lxviii ) 吡啶基 C1-C6 烷基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷醯基團及苯甲醯基團中之基團 ) ,

( lxix ) 四唑基團 ,

( lxx ) 吡啶基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( lxxi ) 三唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團及 C1-C6 烷硫基團中之基團 ) ,

( lxxii ) 咪唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個胺基甲醯基團 ) ,

( lxxiii ) 噁唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團 ) ,

( lxxiv ) 異噻唑基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團 ) ,

( lxxv ) 苯並咪唑基團 ,

( lxxvi ) 二氫苯並噻唑基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( lxxvii ) 噻吩基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷氧羰基團 ) ,



( lxxviii) 噁唑基 C1-C6 烷基團 ( 其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團 ) ,

( 29) 胺基 C1-C6 烷基團 ( 其可於胺基團上具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團, 經鹵素取代之 C1-C6 烷基團, C1-C6 烷氧羰基團, C1-C6 烷醯基團, 苯基團, 苯基 C1-C6 烷基團, 苯甲醯基團, 及經胺基取代之烷基團 ( 經胺基取代之烷基團中之胺基團上, 可存在 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代基 ) 中之基團 ) ,

( 30) 經單一之胺基甲醯基團取代之 C1-C6 烷基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團 ) ,

( 31) 硫代胺基甲醯基團 ( 其可具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團 ) ,

( 32) 胺基磺醯基團 ,

( 33) 噁唑啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( 34) 咪唑啉基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自酮基團及 C1-C6 烷基團中之基團 ) ,

( 35) 吡咯啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ,

( 36) 咪唑基團 ,

( 37) 三唑基團 ,

( 38) 異噁唑基團 ,

( 39) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷基苯磺醯基團、酮基團、羥基團及胺基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基

團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷氧羰基團及 C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團中之基團) 中之基團作為取代基)，

(40) 六氫吡啶基羰基團(其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團，羥基團，羥基 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷醯基團，羧基 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷基胺基甲醯基 C1-C6 烷基團，胺基甲醯基團，C1-C6 烷氧基團，羧基團，C1-C6 烷氧羰基團，胺基團(其上可存在 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷醯基團，C1-C6 烷氧羰基團及苯甲醯基團中之基團)，六氫吡啶基團(其上可存在 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷醯基團，C1-C6 烷氧羰基團及苯甲醯基團中之基團)，六氫吡嗪基團(其上可存在 1 至 3 個 C1-C6 烷基團以作為取代基)，1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基團，嗎啉基團，六氫-1,4-二氮雜草基團(其上可存在單一之 C1-C6 烷基團以作為取代基)，吡啶基團，吡啶氧基團，吡啶基 C1-C6 烷氧基團，四氫喹啉基團(其上可存在單一之酮基團)，苯並二噁茂基團，苯基 C1-C6 烷氧基團(其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子，C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團中之基團)，苯基團(其上可存在 1 至 3 個擇自鹵素原子，C1-C6 烷氧基團及羥基團中之基團)，苯氧基團(其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自氰基團，鹵素原子，C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基團及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團)，苯基 C1-C6 烷基團(其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子，C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基團及經鹵素

取代之 C1-C6 烷基團中之基團)，及苯甲醯基團（其可於苯基團上具有 1 至 3 個擇自鹵素原子及 C1-C6 烷氧基團中之基團）中之基團作為取代基），

（41）吡咯啉基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自羥基 C1-C6 烷基團，胺基甲醯基團，羥基團，胺基團（胺基團上可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷醯基團及苯甲醯基團中之基團），嗎啉基 C1-C6 烷基團，吡咯啉基 C1-C6 烷基團，六氫吡啶基 C1-C6 烷基團，六氫吡嗪基 C1-C6 烷基團（六氫吡嗪基團上可具有單一之 C1-C6 烷基團以作為取代基），胺基 C1-C6 烷基團（胺基團上可具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代基），苯氧基團（苯基團上可具有 1 至 3 個經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團），苯氧基 C1-C6 烷基團（苯基團上可存在 1 至 3 個經鹵素取代之 C1-C6 烷氧基團），及四氫喹啉基團（其上可存在酮基團）中之基團作為取代基），

（42）六氫吡嗪基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團，環 C3-C8 烷基團，C1-C6 烷醯基團，羥基 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團，C1-C6 烷氧羰基團，胺基 C1-C6 烷基團（胺基團上可具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代基），六氫吡啶基 C1-C6 烷基團（六氫吡啶基團上可具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代基），嗎啉基 C1-C6 烷基團，吡咯啉基 C1-C6 烷基團，1,3-二噁茂烷基 C1-C6 烷基團，四氫呋喃基 C1-C6 烷基團，吡啶基 C1-C6 烷基團（C1-C6 烷基團上可具有 1 至 2

個苯基團以作為取代基)，咪唑基 C1-C6 烷基團，呋喃基 C1-C6 烷基團，吡咯啉基羰基 C1-C6 烷基團，六氫吡啶基團（其可具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代基），吡啶基團（吡啶基團上可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團，氰基團，及經鹵素取代之 C1-C6 烷基團中之基團以作為取代基），噻吩並 [2,3-b] 吡啶基團，苯基團（其上可存在 1 至 3 個擇自鹵素原子及 C1-C6 烷基團中之基團），苯甲醯基團，呋喃基羰基團，苯基 C1-C6 烷氧羰基團及酮基團中之基團作為取代基），

（43）六氫氮雜草基羰基團，

（44）六氫-1,4-二氮雜草基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團及吡啶基團中之取代基），

（45）二氫吡咯基羰基團（其可具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團），

（46）硫代嗎啉基羰基團，

（47）嗎啉基羰基團（其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、六氫吡啶基 C1-C6 烷基團、及苯基團中之基團），

（48）噻唑啉基羰基團（其可具有 1 至 3 個苯基團且苯基團可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷氧基團及氰基團中之基團），

（49）氮雜二環 [3.2.2] 壬基羰基團，

（50）8-氮雜二環 [3.2.1] 辛基羰基團（其可具有 1 至 3 個經鹵素取代或未經取代之苯氧基團），

- ( 51 ) 吲哚啉基羰基團，
- ( 52 ) 四氫喹啉基羰基團，
- ( 53 ) 四氫吡啶並 [3.4-b] 吲哚基羰基團，
- ( 54 ) 嗎啉基 C1-C6 烷基團，
- ( 55 ) 六氫吡啶基 C1-C6 烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團 )，
- ( 56 ) 嗎啉基羰基 C1-C6 烷基團，
- ( 57 ) 六氫吡啶基羰基 C1-C6 烷基團 ( 其可於六氫吡啶基團上具有 1 至 3 個 C1-C6 烷基團 )，
- ( 58 ) 酮基團，
- ( 59 ) 胺基 C1-C6 烷氧基團 ( 其可於胺基團上具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團 )，
- ( 60 ) C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷氧基團，
- ( 61 ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自酮基團、C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧羰基團中之基團 )，
- ( 62 ) 嗎啉基團，
- ( 63 ) 1,3,8-三氮雜螺 [4.5] 癸基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自酮基團及苯基團中之基團 )，
- ( 64 ) 四氫吡啶基羰基團 ( 其可具有 1 至 3 個吡啶基團 )，
- ( 65 ) 咪唑啉基羰基團 ( 其可具有單一之硫酮基團 )，
- ( 66 ) 1,4-二氧雜-8-氮雜螺 [4.5] 癸基團。

3.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 A 為 C1-C6 烷基基團。

4.根據申請專利範圍第 3 項之化合物，其中  $R^1$  代表擇自下列 (I) 至 (III) 之環 C5-C6 烷基基團、芳族基團或雜環型基團：

(I) 環 C5-C6 烷基基團；

(II) 苯基基團；及

(III) 具有 1 至 2 個氮原子之擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡啶基團、嘧啶基團及噻啶基團中之飽和或不飽和雜單環型基團，且

$R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基基團、芳族基團及雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 (1) 至 (66) 中之基團以作為取代基。

5.根據申請專利範圍第 4 項之化合物，其中  $R^1$  代表 (I) 環 C5-C6 烷基基團；且於  $R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 (1) 至 (66) 中之基團以作為取代基。

6.根據申請專利範圍第 4 項之化合物，其中  $R^1$  代表 (II) 苯基基團；且於  $R^1$  所代表之芳族基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 (1) 至 (66) 中之基團以作為取代基。

7.根據申請專利範圍第 4 項之化合物，其中  $R^1$  代表 (III) 具有 1 至 2 個氮原子之擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡啶基團、嘧啶基團及噻啶基團中之飽

和或不飽和雜單環型基團；且於  $R^1$  所代表之雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自申請專利範圍第 2 項所定義之 (1) 至 (66) 中之基團以作為取代基。

8. 根據申請專利範圍第 4 項之化合物，其中  $R^1$  代表擇自下列 (I) 至 (III) 之環 C5-C6 烷基團、芳族基團或雜環型基團：

(I) 環 C5-C6 烷基團；

(II) 苯基團；及

(III) 具有 1 至 2 個氮原子之擇自吡咯啉基團、六氫吡啶基團、吡啶基團、吡啉基團及噻啉基團中之飽和或不飽和雜單環型基團；且

於  $R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基團、芳族基團及雜環型基團上可存在 1 至 5 個擇自下列 (1)、(4)、(10)、(17)、(18)、(21)、(28)、(29)、(30)、(33)、(34)、(35)、(36)、(39)、(61) 及 (62) 中之基團以作為取代基：

(1) C1-C6 烷基團，

(4) C1-C6 烷氧基團，

(10) 羥基 C1-C6 烷基團，

(17) 胺基團（其具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷氧羰基團、C1-C6 烷磺醯基團、胺基甲醯基團、C1-C6 烷基胺基甲醯基團、胺基 C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧羰胺基 C1-C6 烷醯基團中之基團以作為取代基），

( 18 ) C1-C6 烷醯基團，

( 21 ) C1-C6 烷氧羰基團，

( 28 ) 胺基甲醯基團，其可具有 1 至 2 個擇自下列  
( i )、( ii )、( iv )、( xii ) 及 ( xxi ) 中之基團以作  
為取代基：

( i ) C1-C6 烷基團，

( ii ) C1-C6 烷氧基團，

( iv ) C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團，

( xii ) 具有 1 至 2 個 C1-C6 烷氧羰基團之 C1-C6 烷  
基團，

( xxi ) 吡啶基 C1-C6 烷基團，

( 29 ) 胺基 C1-C6 烷基團（其可於胺基團上具有 1 至  
2 個擇自 C1-C6 烷基團，經鹵素取代之 C1-C6 烷基團，  
C1-C6 烷氧羰基團，C1-C6 烷醯基團，苯基團，苯基 C1-  
C6 烷基團，苯甲醯基團，及經胺基取代之 C1-C6 烷基團  
（其胺基團上可存在 1 至 2 個 C1-C6 烷基團以作為取代  
基）中之基團），

( 30 ) 經單一之胺基甲醯基團取代之 C1-C6 烷基團  
（其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團及經鹵素取代之  
C1-C6 烷基團中之基團），

( 33 ) 噁唑啶基團（其可具有單一之酮基團），

( 34 ) 咪唑啶基團（其可具有 1 至 2 個擇自酮基團及  
C1-C6 烷基團中之基團），

( 35 ) 吡咯啶基團（其可具有單一之酮基團），



( 36 ) 咪唑基團，

( 39 ) 六氫吡啶基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷基苯磺醯基團、酮基團、羥基團及胺基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷氧羰基團及 C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團中之基團 ) 中之取代基 ) ，

( 61 ) 六氫吡嗪基團 ( 其可具有 1 至 3 個擇自酮基團、C1-C6 烷基團、C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧羰基團中之基團 ) ，及

( 62 ) 嗎啉基團。

9. 根據申請專利範圍第 8 項之化合物，其中  $R^1$  代表 ( I ) 環己基團，且於  $R^1$  所代表之環 C5-C6 烷基團上可存在 1 至 3 個擇自申請專利範圍第 8 項所定義之 ( 1 ) 、 ( 4 ) 、 ( 10 ) 、 ( 17 ) 、 ( 18 ) 、 ( 21 ) 、 ( 28 ) 、 ( 29 ) 、 ( 30 ) 、 ( 33 ) 、 ( 34 ) 、 ( 35 ) 、 ( 36 ) 、 ( 39 ) 、 ( 61 ) 及 ( 62 ) 中之基團以作為取代基。

10. 根據申請專利範圍第 8 項之化合物，其中  $R^1$  代表 ( II ) 苯基團，；且於  $R^1$  所代表之芳族基團上可存在 1 至 3 個擇自申請專利範圍第 8 項所定義之 ( 1 ) 、 ( 4 ) 、 ( 10 ) 、 ( 17 ) 、 ( 18 ) 、 ( 21 ) 、 ( 28 ) 、 ( 29 ) 、 ( 30 ) 、 ( 33 ) 、 ( 34 ) 、 ( 35 ) 、 ( 36 ) 、 ( 39 ) 、 ( 61 ) 及 ( 62 ) 中之基團以作為取代基。

11. 根據申請專利範圍第 10 項之化合物，其中  $R^1$  代表 ( II ) 苯基團，且於  $R^1$  所代表之芳族基團上可存在 1 至 3

個下列 ( 1 ) 、 ( 4 ) 、 ( 10 ) 、 ( 17 ) 、 ( 18 ) 、 ( 28 ) 、 ( 33 ) 、 ( 35 ) 、 ( 39 ) 、及 ( 61 ) 中之基團以作為取代基：

( 1 ) C1-C6 烷基團，

( 4 ) C1-C6 烷氧基團，

( 10 ) 羥基 C1-C6 烷基團，

( 17 ) 胺基團 ( 其具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、胺基 C1-C6 烷醯基團、C1-C6 烷醯胺基 C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧基羰胺基 C1-C6 烷醯基團中之基團以作為取代基 ) ，

( 18 ) C1-C6 烷醯基團，

( 28 ) 胺基甲醯基團，其可具有單一之 C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基團：

( 33 ) 噁唑啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ，

( 35 ) 吡咯啉基團 ( 其可具有單一之酮基團 ) ，

( 39 ) 六氫吡啶基團，及

( 61 ) 六氫吡嗪基團 ( 其可具有 1 至 2 個擇自酮基團、C1-C6 烷醯基團及 C1-C6 烷氧羰基團中之基團 ) 。

12. 根據申請專利範圍第 11 項之化合物，其中  $R^1$  為苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之胺基團 ( 胺基團上具有 1 或 2 個 C1-C6 烷基團 ) ；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之胺基甲醯基團 ( 具有單一之

C1-C6 烷基團，且 C1-C6 烷基團上具有兩個 C1-C6 烷氧基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之羥基 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之噁唑啉基團（噁唑啉基團上具有單一之酮基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之吡咯啉基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之六氫吡啶基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之六氫吡嗪基團（六氫吡嗪基團上具有單一之 C1-C6 烷醯基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之六氫吡嗪基團（六氫吡嗪基團上具有單一之 C1-C6 烷醯基團及單一之酮基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之六氫吡嗪基團（六氫吡嗪基團上具有單一之 C1-C6 烷氧羰基團及單一之酮基團）；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之 N-[(N-C1-C6 烷氧羰基胺基) C1-C6 烷醯基]胺基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之 N-(胺基 C1-C6 烷醯基)胺基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷基團、單一之 C1-C6 烷氧基團、及單一之 N-[(N-C1-C6 烷醯胺基) C1-C6 烷醯基]胺基團；

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷氧基團、單一之 C1-C6 烷醯基團、及單一之六氫吡咩基團（六氫吡咩基團上具有單一之 C1-C6 烷氧羰基團）；或

苯基團，且苯基團上具有單一之 C1-C6 烷氧基團、單一之羥基 C1-C6 烷基團、及單一之六氫吡咩基團（六氫吡咩基團上具有單一之 C1-C6 烷氧羰基團）。

13. 根據申請專利範圍第 12 項之化合物，其係選自：

- (1) N-甲基-4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯胺
- (2) 4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-N,N-二甲基-3-甲氧基-5-甲基苯胺
- (3) 4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-N-(2,2-二甲氧基乙基)-3-甲氧基-5-甲基苯甲醯胺
- (4) 1-(苯並[b]噻吩-4-基)-4-[3-{2-甲氧基-6-甲基-4-(吡咯啉-1-基)苯氧基}丙基]六氫吡咩
- (5) 1-(苯並[b]噻吩-4-基)-4-[3-{2-甲氧基-6-甲基-4-(六氫吡咩-1-基)苯氧基}丙基]六氫吡咩
- (6) 1-乙醯基-4-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}六氫吡咩
- (7) 4-乙醯基-1-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}六氫吡咩-2-酮

- (8) 4-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}-3-酮-1-甲氧羰基六氫吡咩
- (9) N-(N-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}胺基甲醯基甲基)胺基甲酸第三丁酯
- (10) 2-胺基-N-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}乙醯胺
- (11) 2-乙醯胺基-N-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲氧基-5-甲基苯基}乙醯胺
- (12) 4-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-甲醯基-5-甲氧基苯基}-1-甲氧羰基六氫吡咩與
- (13) 4-{4-[3-{4-(苯並[b]噻吩-4-基)六氫吡咩-1-基}丙氧基]-3-羥甲基-5-甲氧基苯基}-1-甲氧羰基六氫吡咩;
- 或其鹽。

14. 根據申請專利範圍第 8 項之化合物，其中  $R^1$  代表具有 1 至 2 個氮原子之擇自六氫吡咩基團、吡啶基團、及噻啶基團中之飽和或不飽和雜單環型基團，且於  $R^1$  所代表之雜環型基團上可存在 1 至 3 個擇自申請專利範圍第 8 項所定義之 (1)、(4)、(10)、(17)、(18)、(21)、(28)、(29)、(30)、(33)、(34)、(35)、(36)、(39)、(61) 及 (62) 中之基團以作為取代基。

15. 根據申請專利範圍第 14 項之化合物，其中  $R^1$  代表 (III) 具有 1 至 2 個氮原子之擇自六氫吡咩基團、吡啶基

團、及噻唑基團中之飽和或不飽和雜單環型基團，且於  $R^1$  所代表之雜環型基團上可存在 1 至 3 個擇自下列 (1)、(17)、及 (28) 中之基團以作為取代基：

(1) C1-C6 烷基團；

(17) 胺基團（其具有 1 至 2 個擇自 C1-C6 烷基團、及 C1-C6 烷醯基團中之基團以作為取代基），

(28) 胺基甲醯基團，其可具有 1 至 2 個 C1-C6 烷基團。

16. 根據申請專利範圍第 15 項之化合物，其中  $R^1$  代表吡唑基團（其具有單一之 C1-C6 烷基團及單一之 C1-C6 烷醯胺基團）；

吡唑基團（其具有單一之 C1-C6 烷基團及單一之 N,N-二-C1-C6 烷基胺基團）；

六氫吡啶基團（其具有單一之 N,N-二-C1-C6 烷基胺基甲醯基團）；

噻唑基團（其具有單一之 N,N-二-C1-C6 烷基胺基甲醯基團）。

17. 一種藥學組成物，其包含作為有效成分之申請專利範圍第 1 項之式 (1) 雜環型化合物或其鹽，以及藥學上可接受之載體。

18. 根據申請專利範圍第 17 項之藥學組成物，以供治療或預防中樞神經系統病症。

19. 根據申請專利範圍第 18 項之藥學組成物，以治療或預防擇自精神分裂症；執拗性、頑固性或慢性精神分裂

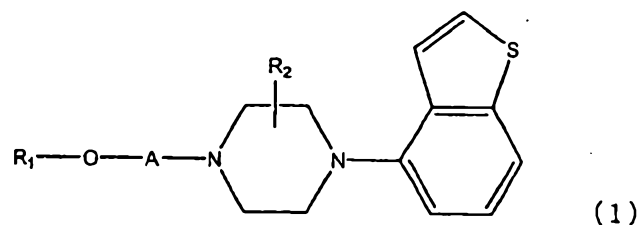
症；情緒性障礙；精神性病症；情感性病症；第 I 型躁鬱症；第 II 型躁鬱症；抑鬱症；內源性抑鬱症；重症抑鬱症；憂鬱症及執拗性抑鬱症；情緒不良病症；循環性情感精神病症；恐慌發作；恐慌症；廣場恐怖症；社交恐懼症；強迫症；外傷後壓力症；全身性焦慮症；急性壓力症；歇斯底里症；軀體症狀病症；轉化性病症；疼痛病症；疑病症；捏造性病症；分裂性病症；性功能障礙；性慾病症；性喚醒病症；勃起功能障礙；厭食症；飽食症；睡眠症；適應病症；酒精濫用；酒精中毒；藥物成癮；興奮劑中毒；麻醉劑中毒；快感缺乏；醫師原性快感缺乏；精神或心理原因之快感缺乏；與抑鬱症有關之快感缺乏；與精神分裂症有關之快感缺乏；譫妄；認知損害；與阿滋海默症，帕金森氏症及其它神經變性病症有關之認知損害；因阿滋海默症所致之認知損害；帕金森氏症及相關之神經變性病症；精神分裂症之認知損害；因執拗性、頑固性或慢性精神分裂症所致之認知損害；嘔吐；動暈症；肥胖症；偏頭痛；疼痛；精神障礙；自閉症；妥瑞氏症；抽搐症；注意力缺乏/過動症；行為障礙；及唐氏症中之中樞神經系統病症。

20.一種製造藥學組成物之方法，其包含將根據申請專利範圍第 1 項之式 (1) 雜環型化合物或其鹽與藥學上可接受之載體混合。

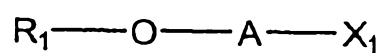
21.一種根據申請專利範圍第 1 項之式 (1) 雜環型化合物或其鹽之用途，係用以製造作為多巴胺 D<sub>2</sub> 受體部分

激動劑及/或血清素 5-HT<sub>2A</sub> 受體拮抗劑及/或血清素吸收抑制劑及/或血清素再吸收抑制劑之藥物。

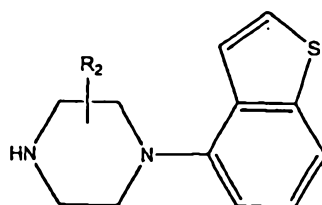
22. 一種製造式 (1) 所代表之雜環型化合物或其鹽之方法：



[其中 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub> 及 A 與申請專利第 1 項中所定義者相同]，  
其特徵為包含令下式所代表之化合物或其鹽



[其中 R<sub>1</sub> 及 A 與上文所定義者相同，且 X<sub>1</sub> 代表鹵素原子  
或代表與鹵素原子中所引致之取代反應相同之基團]與下  
式所代表之化合物或其鹽起反應



[其中 R<sub>2</sub> 與上文所定義者相同]。