

公 告 本

申請日期	86. 01. 13.
案 號	86100296
類 別	007D 40% 60, 40% 4, 20% 68, 40% 1/2, 213/73 A61C 3/50C

Int. Cl⁶

A4

C4

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書 475929

裝

訂

線

一、發明 新型 名稱	中 文	經取代氮-及二氮環庚烷及-環辛烷化合物及其用途
	英 文	SUBSTITUTED AZA- AND DIAZACYCLOHEPTANE AND -CYCLOCHEPTANE COMPOUNDS AND THEIR USE
二、發明人 創作	姓 名	1. 哈斯-約格 崔伯 2. 史戴芬 布蘭克 3. 杜洛西亞 史塔克 4. 利里安 揚格 5. 哈斯-喬根 提斯奇恩多夫 6. 卡斯登 威奇
	國 籍	均德國
三、申請人	住、居所	1. 德國布陸爾市史波伯街1號 2. 德國來恩河勞域沙芬市特拉契菲爾街47號 3. 德國來恩河勞域沙芬市凱瑟-惠姆街31號 4. 德國來恩河勞域沙芬市渥爾街129號 5. 德國杜登荷芬市喬格-紐布-街5號 6. 德國艾崔普市日吉雷街113號
	姓 名 (名稱)	德商巴地斯顏料化工廠
三、申請人	國 籍	德國
	住、居所 (事務所)	德國來恩河勞域沙芬市
三、申請人	代表人 姓 名	1. 安德瑞斯·拜伯拜奇 2. 維拉·史塔克

(由本局填寫)

承辦人代碼：	A6
大類：	B6
I P C 分類：	

本案已向：

德國(地區)申請專利，申請日期 1996.01.12 案號：196 00 934.0 有 無主張優先權

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

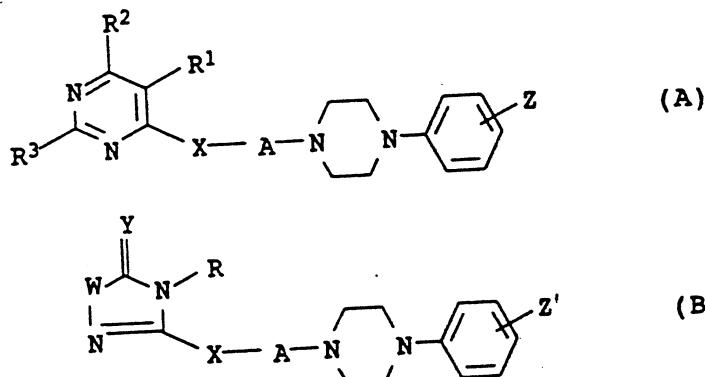
有關微生物已寄存於： ， 寄存日期： ， 寄存號碼：

五、發明說明 (1)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

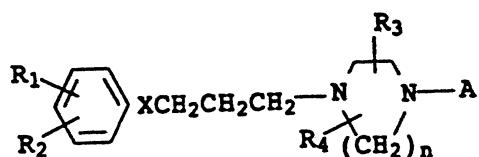
本發明係關於經取代氮-及二氮環庚烷及-環辛烷化合物，及此類化合物之用途。該化合物具重要的治療性質，且尤其能夠用以治療感應多巴胺D₃配位子之失調。

以下討論形式且具生理活性之化合物頃於一些案例中被揭示。因而，DE 21 39 082及DE 22 58 561中敘述噁啶衍生物及具鹼性取代基之噁啶酮衍生物作為降血壓藥。這些噁啶及噁啶酮衍生物具以下化學式：



其中，在(A)中X尤其為硫原子，A為C₁-C₆-伸烷基，R¹，R²，R³及Z為各種取代基。在(B)中，X及Y為氧化硫原子，A為C₂-C₆-伸烷基，W為伸乙烯基且R及Z為各種取代基。

EP-A-361271敘述以下化學式之吡啶基及噁啶基衍生物：



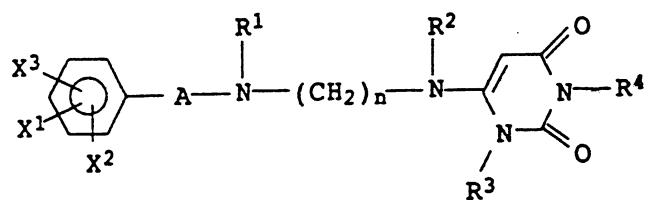
其中R₁為鹵素或氫，R₂為鹵素；X為氧，硫或伸甲基；

五、發明說明 (2)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

R_3 及 R_4 為相同或相異，係氫或較低碳烷基； n 為2或3； A 為2-嘧啶基或2-或3-吡啶基，這些基能夠經取代。這些化合物能夠用以治療精神焦慮。

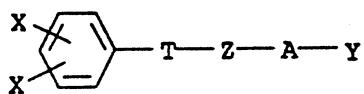
EP-A-454498敘述以下化學式之化合物：



其中 A 尤其為 $-(CH_2)_m-$ 或 $-B-(CH_2)_k-$ ，其中 B 為O，S，未經取代或經取代胺基， $-CONH-$ 或 $-COO-$ ， R^1 及 R^2 尤其能夠一起形成烯鍊， R^3 及 R^4 為氫或較低碳基， X^1 ， X^2 及 X^3 為各種取代基。這些化合物能夠用以治療心律不整。

EP-A-452107及EP-A-369627敘述同樣能夠用以治療心律不整之結構類似化合物。

此外，BE-A-628766敘述以下化學式之化合物：



其中 X 為鹵素原子或較低碳烷基， T 為六氫吡啶，甲基六氫吡啶，高六氫吡啶或甲基高六氫吡啶； Z 為伸烷基或伸烯基； A 為O或S； Y 為萘基，鹵萘基或未經取代或一至三取代之苯基。這些化合物能夠用以治療血吸蟲病。

神經元尤其經由G-蛋白偶合受納體得到其訊息。有無數物質經由這些受納體運用其影響力。其中之一為多巴胺。

五、發明說明 (3)

多巴胺存在下確認之訊息及其作為神經傳遞之生理功能係可利用的。感應多巴胺之細胞係與早發性癡呆及巴金森 (Parkinson) 症病原有關。這些及其它疾病係以與多巴胺受納體互相作用之藥物治療。

一直到 1990 年，頃以藥理方式清楚地定義二種副形式多巴胺受納體，主要是 D₁ 及 D₂ 受納體。

最近，更發現第三種副形式，即 D₃ 受納體，其似乎調解一些抗精神病效果 (J. C. 史瓦茲 (Schwartz) 等，多巴胺 D₃ 受納體於新穎抗精神病藥物中作為抗精神病之目標 (The Dopamine D₃ Receptor as a Target for Antipsychotics, in Novel Antipsychotic Drugs), H. Y. 梅爾茲 (Meltzer)，雷文 (Raven) 版，1992 年紐約，第 135-144 頁)。

D₃ 受納體主要於邊緣系統中表示。因而假設一選擇性 D₃ 對抗劑像是具有 D₂ 對抗劑之抗精神病性質，但不具其精神病副作用 (P. 索扣羅夫 (Sokoloff) 等，D₃ 多巴胺受納體之集中及功能 (Localization and Function of the D₃ Dopamine Receptor), *Arzneim. Forch./Drug Res.* 42(1), 224 (1992); P. 索扣羅夫 (Sokoloff) 等。新穎多巴胺受納體 (D₃) 之分子無性系及特徵化作為鎮神劑之目標 (Molecular Cloning and Characterization of a Novel Dopamine Receptor (D₃) as a Target for Neuroleptics)，自然 (Nature)，347, 146 (1990))。

P. J. 莫瑞 (Murray) 等，生化及藥化文獻 (Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters)，第 5 冊，第 3 號，219-222

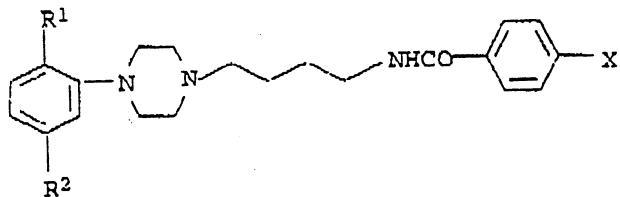
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

稿

五、發明說明 (4)

(1995) 項敘述以下化學式之芳基六氫吡啶：



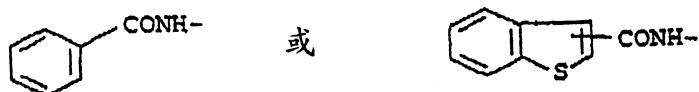
其中 R^1 及 R^2 為 H 或 CH_3O ，X 為 Br，4-乙醯苯基，4-甲基磺苯基或4-胺苯基，具多巴胺 D_3 受納體較高親和力及選擇性。

頃意外發現某些氮-及二氮環庚烷及-環辛烷化合物具多巴胺 D_3 受納體高親和力及 D_2 受納體低親和力。因而其為選擇性 D_3 配位子。

本發明因而係關於通式 I 之化合物：



其中 Ar^1 為



或是具 1, 2 或 3 個雜原子之 5- 或 6- 環雜原子環，該雜原子係彼此獨立選自 O, N 及 S，其中 Ar^1 可以具 1, 2, 3 或 4 個取代基，該取代基係彼此獨立選自 OR^1 ，未取代或經 OH, OC_1-C_8 -烷基或鹵素取代之烷基，或 C_2-C_6 -烯基， C_2-C_6 -炔基，環烷基，鹵素，CN, CO_2R^1 , NO_2 , NR^1R^2 , SR^1 , CF_3 , CHF_2 ，未取代或經 C_1-C_6 -烷基， OC_1-C_6 -烷基，醯基或鹵素取代之苯基，或未取代或經 C_1-C_6 -烷基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (5)

OC_1-C_6 -烷基或鹵素取代之苯氧基，或 C_1-C_6 -醯基或苯甲醯基；

R^1 為H，未取代或經OH， OC_1-C_6 -烷基取代之烷基，苯基或鹵素；

R^2 具 R^1 所指之意義或為 COR^1 或 CO_2R^1 ；

當 Ar^1 為 C_6H_5CONH 時，A為 C_3-C_{15} -伸烷基，或者當 Ar^1 為5-或6-環雜原子環時，A為 C_4-C_{15} -伸烷基或 C_3-C_{15} -伸烷基，其包括至少一乙基，係選自O，S，NR¹，雙鍵或三鍵，其中R¹如上所定義，

B為具一個或二個氮原子之7-或8-環飽和環，該氮雜原子係位於1,4或1,5位置，該環以位置，鍵結於反應基A，以位置4或5鍵結於反應基Ar²，且該環能夠額外於單氮環位置3或4及1,4-二氮環位置6具有雙鍵；

Ar²為苯基，吡啶基，嘧啶基或三阱基，Ar²能夠具有1,2,3或4個取代基，該取代基係彼此獨立選自OR¹，烷基， C_2-C_6 -烯基， C_2-C_6 -炔基，烷氧烷基，鹵烷基，鹵素，CN， CO_2R^1 ，NO₂，SO₂R¹，NR¹R²，SO₂NR¹R²，SR¹，5-環或6-環碳環族，芳香族或非芳香族環，及具1至3個選自O，S及N之雜原子之5-環或6-環雜環芳香族或非芳香族環，該碳環或雜環係未取代或經 C_1-C_8 烷基，苯基，苯氧基，鹵素， OC_1-C_8 烷基，OH，NO₂或CF₃取代，其中R¹及R²具上述意義，且Ar²亦可以熔融於以上定義之碳環，其中Ar²不能夠是經2個羥基取代之嘧啶基，及其與耐生理之酸之鹽。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (6)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

根據本發明之化合物係具選擇性之多巴胺D₃受納體配位子，由於對於D₂受納體之低親和力，其區域選擇地介於邊緣系統中，且副作用小於D₂受納體對抗劑之典型鎮神劑。該化合物因而能夠用以治療感應多巴胺D₃受納體對抗劑之失調，例如治療中心神經系統失調，尤指早發性癡呆，憂鬱症，精神官能症及精神病。

為了本發明，以下用詞具有下文中所指之意義：

烷基(如烷氨基，烷胺基等之反應基亦然)係具1至8個碳原子之直鏈或支鏈烷基，1至6個碳原子較佳，尤指1至4個碳原子。該烷基可以具1個或多個取代基，該取代基係彼此獨立選自OH及OC₁-C₈烷基。

烷基之實例為甲基，乙基，正丙基，異丙基，正丁基，異丁基，特丁基等。

環烷基尤指C₃-C₆環烷基，如環丙基，環丁基，環戊基及環己基。

伸烷基係較佳具4至15個碳原子之直鏈或支鏈反應基，4至10個碳原子尤其較佳，或具3至15個碳原子，尤指3至10個碳原子，當該伸烷基包括該基之一時。

該伸烷基可以包括至少一個以上定義A中所指之Z基。恰如該雙鍵或三鍵般，這可以位於該伸烷基鏈之任何位置或A基之位置1或2(從Ar¹反應基看)。A尤其較佳為根據其中A為-Z-C₃-C₆-伸烷基之化學式I之化合物，尤指-Z-CH₂CH₂CH₂-，-Z-CH₂CH₂CH₂CH₂-，-Z-CH₂C=CHCH₂-，-Z-CH₂C(CH₃)=CHCH₂-，-Z-CH₂C(=CH₂)CH₂-，-Z-

五、發明說明 (7)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

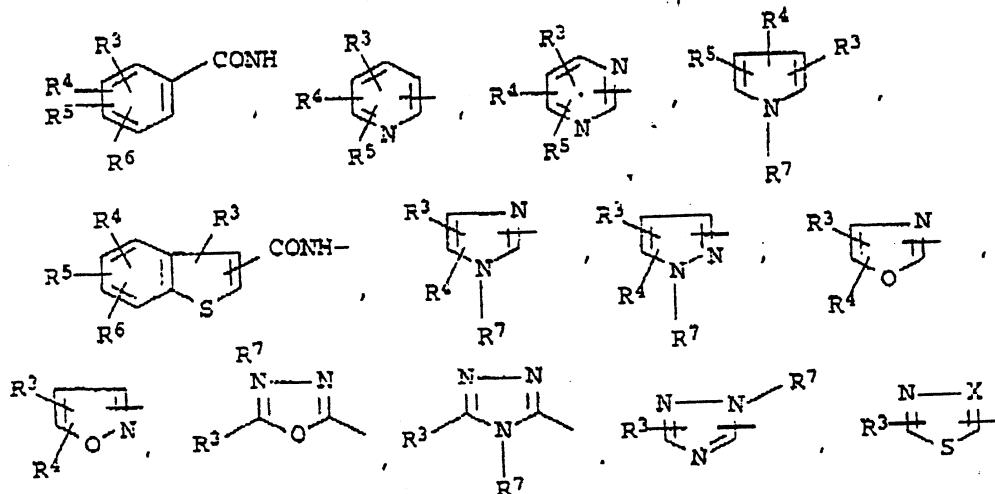
$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2$ 或直鏈-Z-C₇-C₁₀伸烷基。如此，當 Ar¹ 為未取代或經取代噁啶或三唑殘基時，A 尤其較佳為 -Z-C₃-C₆伸烷基，當 Ar¹ 為未取代或經取代噻吡唑殘基時，A 尤佳為 -Z-C₇-C₁₀伸烷基。如此，Z 亦能夠是 CH₂，較佳為 CH₂，O，尤指 S。

鹵素為 F，Cl，Br 或 I。

鹵烷基可以包括一個或多個鹵素原子，尤指 1，2 或 3 個，其能夠位於一個或多個碳原子上， α 或 ω 位置較佳。 CF_3 ， CHF_2 ， CF_2Cl 或 CH_2F 尤其較佳。

醯基較佳為 HCO 或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基-CO，尤指乙醯基。倘若 Ar¹ 經取代，該取代基亦能夠位於氮雜原子上。

Ar¹ 較佳為以下化學式之反應基：



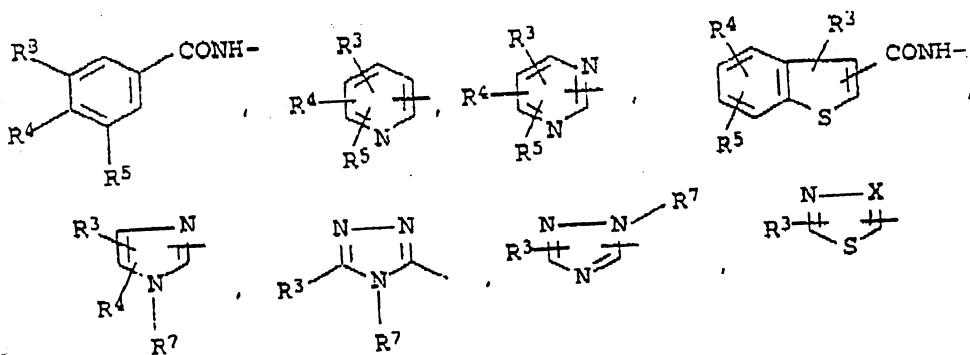
其中 R³ 至 R⁶ 為 H 或上述 Ar¹ 反應基之取代基之一，R⁷ 具上述 R² 之意義，且 X 為 N 或 CH。當苯甲醯胺殘基經取代時，該取代基較佳

五、發明說明 (8)

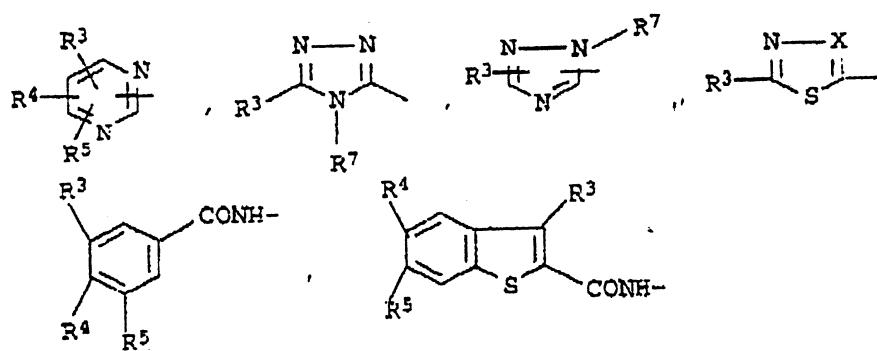
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

為 m 或 p 位置。

Ar^1 尤其較佳為以下化學式之反應基：



其中 R^3 至 R^5 , R^7 及 X 具上述意義，尤指以下化學式之反應基：

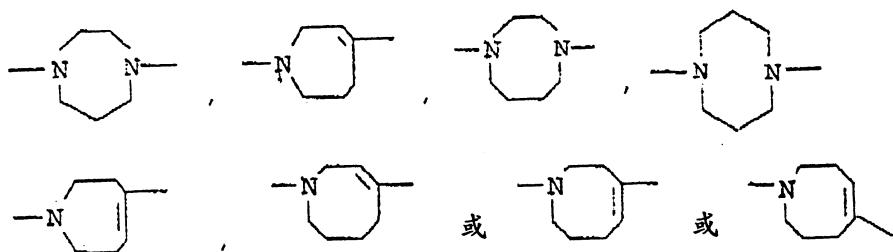


其中 R^3 至 R^5 , R^7 及 X 具上述意義。

R^3 至 R^6 反應基較佳為 H, $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ 烷基, OR^1 , NR^1R^2 , SR^1 , 苯基，其係未取代或經 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ 烷基，醯基，或鹵素取代，其中 R^1 及 R^2 具上述意義。

反應基 B 較佳為

五、發明說明 (9)



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

反應基 Ar^2 可以具 1, 2, 3 或 4 個取代基，1 或 2 個取代基較佳，其尤其位於 m 位置及 / 或 p 位置。其較佳彼此獨立選自 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基，鹵烷基， NO_2 ，鹵素，尤指氯，苯基，吡咯基，咪唑基，吡唑基，噻吩基，環戊基及環己基。倘若取代基之一為 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基，則支鏈較佳，尤指異丙基或特丁基。

Ar^2 較佳為未取代或經取代之苯基，2-，3- 或 4- 吡啶基或 2-，4(6)- 或 5- 噻啶基。

倘若反應基 Ar^2 上取代基之一為 5- 或 6- 環雜環，則其為，例如，吡咯啶，六氫吡啶，嗎啉，六氫吡啶，吡啶，1,4-二氫吡啶，噁啶，三阱，吡咯，噻吩，噁唑，噁唑，噁唑，噁唑，異噁唑，吡唑或噁吡唑殘基，吡咯，噁唑，吡唑或噁吩基較佳。

倘若反應基 Ar^2 上取代基之一為碳環反應基，則其尤指苯基，環戊基或環己基。

倘若 Ar^2 係融合於碳環反應基，則其尤指萘，二-或四氫萘殘基。

本發明亦包括化學式 I 與耐生理酸之化合物之酸加成鹽類。適當耐生理有機及無機酸之實例為氫氯酸，氫溴酸，磷酸，硫酸，草酸，順丁烯二酸，反丁烯二酸，乳酸，酒

五、發明說明 (10)

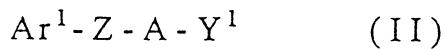
90年2月
九

石酸，己二酸或苯甲酸。其它能夠使用之酸係敘述於 Fortschritte der Arzneimittelforschung，第 10 冊，224 頁 et seq., Birkhäuser Verlag, Basel 及 Stuttgart, 1966。

化學式 I 之化合物可以具一個或多個非對稱中心。本發明因而不僅包括消旋物，亦包括相關之鏡像異構物及非鏡像異構物。特殊之互變異構形式亦包括於本發明中。

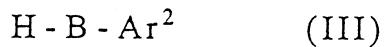
製備化合物(I)之方法包括：

(a) 將通式 II 之化合物



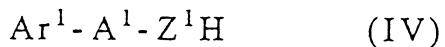
其中 Y^1 為傳統離去基，如 Hal，烷砜氧基，芳砜氧基等， Z 具上述之意義；

與通式 III 之化合物反應



或

(b) 將通式 (IV) 之化合物與通式 V 之化合物反應



其中 Z^1 為 O，NR¹ 或 S， A^1 為 C₁-C₁₅ 伸烷基或一鍵結，

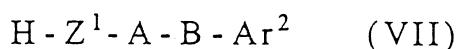


其中 Y^1 具上述意義， A^2 為 C₂-C₁₅ 伸烷基，其中 A^1 及 A^2 共具 3 至 15 個碳原子；或

(c) 將通式 (VI) 之化合物與通式 VII 之化合物反應



其中 Y^1 具上述意義，



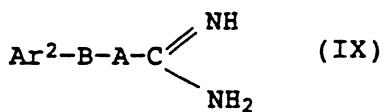
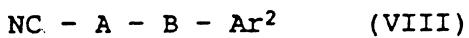
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (11)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

其中 Z^1 具上述意義；或

(d) 將化學式 (VIII) 之化合物轉化為 (IX) 形式之化合物，



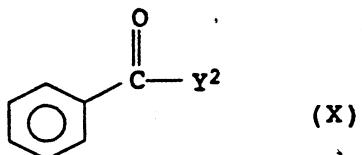
並將後者以傳統方式與二羰基化合物反應；或

(e) 製備化學式 I 且其中 Ar^1 為苯甲醯胺殘基之化合物：

將通式 (X) 且其中 Y^2 為 OH ， $\text{OC}_1\text{-C}_4$ 烷基， C_1 或具 CO

活化酯基之化合物與化學式 (XI) 之化合物反應

訂



其中 A^2 具上述意義，且 Z^2 為 OH 或 NH_2 。

化學式 III 之化合物係製備化學式 V，VII 及 VIII 之化合物之起動化合物，係由以下製備：

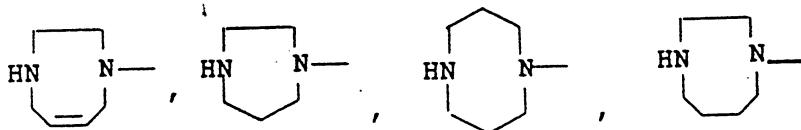
a) 將通式 (XII) 之化合物與通式 (XIII) 之化合物以傳統方式反應，



其中 B^1 為

五、發明說明 (12)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

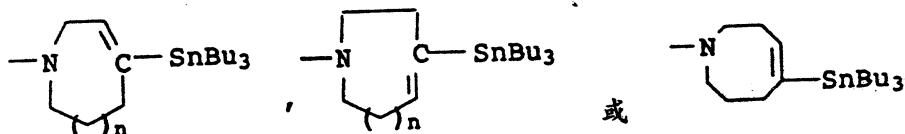


其中 Y^1 為上述離去基， Ar^2 具上述意義；或

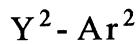
b) 將通式 (XIV) 之化合物與通式 (XV) 之化合物以所述已知之方法反應，例如以 S. C. 布奇瓦德 (Buchwald) et al., Angew. Chem. 1995, 107, 1456 或 J. F. 哈特維格 (Hartweg) et al., 四面體 (Tetrahedron) Lett 1995, 36, 3604 及 J. K. 史狄拉 (Stille) et al., Angew. Chem. 1986, 98, 504 或配瑞耶 (Pereyre) M. et al., 有機合成 (Organic Synthesis), 巴德渥司 (Buterworth) 1987；或



其中 B^2 為



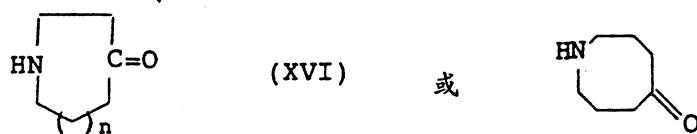
$n = 1$ 或 2 ，



其中 Y^2 為 Br, Cl 或 I，且 Ar^2 具以上意義；

c) 將通式 (XVI) 之化合物與 $M - Ar^2$ (其中 M 為如 Li 或 Mg Y² 之金屬) 之化合物反應。

五、發明說明 (13)



其中 $n = 1$ 或 2

Mar^2 能夠從化學式 XV 之化合物以文獻中已知之方法得到。

Ar^1 及 Ar^2 形式之化合物係已知或能夠以所述之已知方法製備，例如，於 A.R. 卡瑞茲奇 (Katritzky)， CW. 瑞司 (Rees) (ed)" 理解雜環化學 (Comprehensive Heterocyclic Chemistry)" 中，佩格曼 (Pergamon) 版，或 " 雜環族化合物化學 (The Chemistry of Heterocyclic Compounds)"， J. 威利桑司 (Wiley & Sons) 公司。NY 及其中指出之文獻。

形式 B 之化合物係已知或能夠以類似之已知方法製備，例如

1,4-及 1,5-二氮環烷：

L. Börjeson et al. Acta Chem. Scand.

1991, 45, 621

1,4-二氮環-6-辛烯：

W. 史卡洛司 (Schroth) et al. Z. Chem.

1969, 9, 143

1-氮環辛酮：

N.J. 里歐那 (Leonard) et al., J. Org.

Chem. 1964, 34, 1066

1-氮環庚酮：

A. 優酷 (Yokoo) et al., 布耳 (Bull)

Chem. Soc. Jpn. 1956, 29, 631

該新穎化合物及起動物質及中間物亦能夠以類似所列專利公告中所述之方法製備。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (14)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

上述反應通常在介於室溫及所使用溶劑沸點間之溫度於溶劑中發生。能夠使用之溶劑為，例如，乙酸乙酯，四氫呋喃，二甲基甲醯胺，二甲基丁亞砜，二甲氧基乙烷，二甲苯，甲苯，一種如丙酮或甲基乙基酮之酮，或是如乙醇或丁醇之醇。

視需要可以存在酸結合劑。適當酸結合劑為無機鹼，如碳酸鈉或鉀，甲氧鈉，乙氧鈉，氫化鈉或如丁基鋰或烷基鎂化合物之有機金屬化合物，或三乙基胺或吡啶之有機鹼。後者亦能夠作為溶劑。

反應於適用觸媒處發生，如過渡金屬或其錯合物，例如 $Pd(PPh_3)_4$ ， $Pd(OAc)_2$ 或 $Pd(P(oTol)_3)_4$ ，或相轉移觸媒，例如氯化四丁銨或溴化四丙銨。

以傳統方式將粗製產物解離出，例如過濾，以蒸餾移除溶劑，或從反應混合物萃取等。產生之化合物能夠以傳統方式純化，例如從溶劑再結晶，層析或轉化為酸加成化合物。

酸加成鹽係以傳統方式，藉著將自由態鹼與適當酸混合而製備，其中於溶液中或有機溶劑中較適當，例如較低碳醇，如甲醇，乙醇或丙醇，如特丁醚之醚，如丙酮或甲基乙基酮之酮，或如乙酸乙酯之酯。

為了治療上述失調，根據本發明之化合物係以傳統方式經口服或非經腸道(皮下注射，靜脈注射，肌肉注射，腹膜注射)配藥。亦能夠經由鼻咽空隙以蒸汽或噴霧配藥。

劑量係取決於病人的年齡，狀態及重量，以及配藥模式

五、發明說明 (15)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

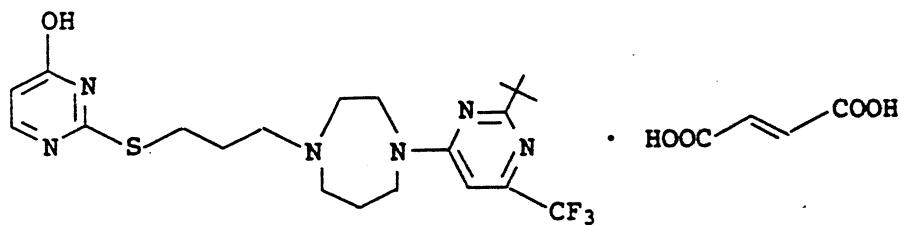
。通常，口服配藥每個病人每天活性物質劑量為約10至1000毫克，非經腸道配藥則每個病人每天約1至500毫克。

本發明亦關於包括根據本發明之化合物之藥物組合物。這些組合物係傳統固體或液體形式之藥物，例如未塗佈(薄膜)或未塗佈錠粒，膠囊，粉末，顆粒，栓劑，溶液或噴霧劑。能夠用於此之活性物質能夠以傳統製藥助劑加工處理，如錠粒黏合劑，鬆散劑，防腐劑，錠粒粉碎劑，流動調整劑，塑化劑，濕潤劑，分散劑，乳化劑，溶劑，釋離減緩劑，抗氧化劑及/或推進氣體(比較H.沙克(Sucker) et al., 製藥技術(Pharmazeutische Technologie), 西姆佛列格(Thieme-Verlag), 史塔格(Stuttgart), 1978)。以此方式得到之形式通常包含1至99重量%活性物質。

以下實例係用以說明本發明而非限制。

實例1

1-[2-特丁基-6-三氟甲基-吡啶-4-基]-4-[3-[4-羥基-吡啶-2-基疏基]-丙基]-六氫-(1H)-1,4-二氮雜革
fumarate



製備起動物質：

a) 2-特丁基-4-羥基-6-三氟甲基嘧啶

以傳統方式合成以上嘧啶，以在乙醇中縮合2,2-二甲

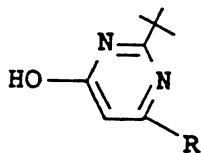
五、發明說明 (16)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

基丙脒與三氟乙醯乙酸乙酯及乙氧鈉，見雜環化合物 (Heterocyclic Compounds)，第 52 冊，噁啶，第 189 頁 et seq., D.J. 布朗 (Brown) et al. (Eds.) 約翰韋利桑司 (John Wiley and Sons), 1994。

熔點 187-188 °C

以類似方式得到以下化學式之 4-羥基噁啶。

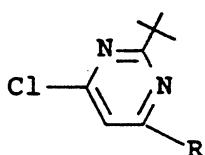


R	M.p. [°C]
t-C ₄ H ₉	169
n-C ₃ H ₇	120
CF ₂ Cl	135-136

b) 2-特丁基-4-氯-6-三氟甲基噁啶

將階段 a) 之羥基噁啶以傳統方式，使用氯化磷或氯化硫醯基轉化為氯化合物，見雜環化合物 (Heterocyclic Compounds)，第 52 冊，噁啶，第 329 頁 et seq., 約翰韋利桑司 (John Wiley and Sons), 1994。化合物為黃色油形式。

以類似方式得到以下化學式之 4-氯噁啶：



五、發明說明 (17)

R	M.p. [°C]
t-C ₄ H ₉	油
n-C ₃ H ₇	油
CF ₂ Cl	油

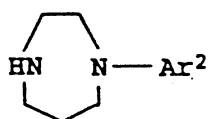
c) 1-[2-特丁基-6-三氟甲基噁啶-4-基]六氫-(1H)-1,4-

二氮雜革

將18克(0.18莫耳)高六氫吡啶溶於25毫升乙醇，迴流，將7.2克(0.03莫耳)於b)中得到之氯化物溶液溶於10毫升乙醇中，並以1小時滴入。再反應30分鐘後，添加200毫升水並以全部200毫升二氯甲烷萃取幾次，以整理冷卻之混合物。繼之以水清洗有機相，以無水硫酸鈉乾燥並濃縮。得到所需黃色油狀之化合物，其經進一步未純化處理。產量：98%理論值。

以對應方式得到以下化合物：

以下化學式之1-芳基-1,4-二氮雜革



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (18)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

印

Ar^2	M.p. [°C]
	油
	油
	油
	74-75

d) 1-[2-特丁基-6-三氟甲基嘧啶-4-基]-4-(3-氯丙基)六
氫-(1H)-1,4-二氮雜草

將 5 克 (0.0165 莫耳) 自 c) 得到之化合物與 2.5 克 (0.025
莫耳) 三乙胺及 3.15 克 (0.02 莫耳) 1-溴-3-氯丙烷於 50
毫升四氫呋喃中迴流 10 小時。以蒸餾移除溶劑，以水
清洗殘餘物並以二氯甲烷萃取。乾燥濃縮後得到之殘
餘物繼以閃蒸層析 (矽膠) 純化。

產量：4.8 克 (77% 理論值) 黃色油

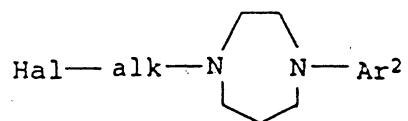
以類似方式得到以下所列之化合物：

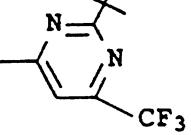
五、發明說明 (19)

化學式如下之 1 - 芳基 - 4 - 酸烷基 - 1,4 - 二氮雜草

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂



Hal	alk	Ar^2	M.p. [°C]
Cl	$-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\text{CH}_2-$		油
"	$-\text{CH}_2\underset{\text{CH}_2}{\text{C}}-\text{CH}_2-$	"	油

五、發明說明 (20)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

"	$-(CH_2)_3-$		油
"	"		油
"	"		油
"	$-CH_2-C(CH_3)=CH-CH_2-$		油
"	$-(CH_2)_3-$		油
"	"		油

製備最終產物

將 5 克 (0.013 莫耳) d) 中得到之產物溶於 25 毫升二甲基甲醯胺，並以 1 小時滴入在 100°C 攪拌之 2.03 克 (0.016 莫耳) 2- 硫尿嘧啶，0.38 克 (0.016 莫耳) 氢氧化鋰及 1 克碘化鈉 / 50 毫升三甲基甲醯胺。反應 3 小時後，減壓下蒸餾以移除溶劑，將殘餘物與 150 毫升水混合並以乙酸乙酯萃取 2 次。得到之殘餘物經水清洗，以硫酸鈉乾燥並濃縮後，

五、發明說明 (21)

以層析純化(閃蒸層析，矽膠，具2.5-5%甲醇之二氯甲烷移動相)。

產量：4克淡色油。

NMR : CDCl_3 . δ 1.3 (s, 9H) ; 1.85-2.25 (m, 4H) ; 2.6 (m, 4H) ; 2.8 (m, 2H) ; 3.2 (t, 2H) ; 3.5 (m, 2H) ; 4.0 (m, 2H) ; 6.2 (d, 1H) ; 6.5 (s, 1H) ; 7.8 (d, 1H)

添加反丁烯二酸之乙醇溶液得到該物質。

$\text{C}_{21}\text{H}_{29}\text{F}_3\text{N}_6\text{OS} \cdot \text{C}_4\text{H}_4\text{O}_4$ MW 586.6

熔點：188-189°C

以類似方式使用各種鹵烷基-1,4-二氮雜草(例如1d)及各種氨基取代之雜環物，如硫尿嘧啶，5-氨基-2-氨基三唑及5-氨基-2-氨基噻二唑得到下表1中之化合物：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

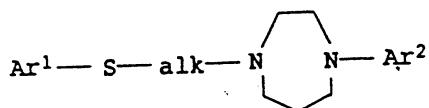
訂

稿

五、發明說明 (22)

表 1

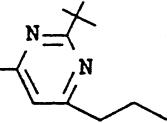
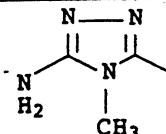
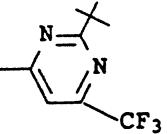
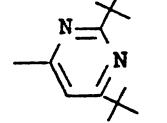
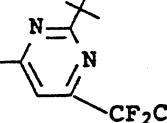
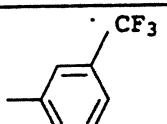
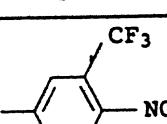
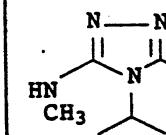
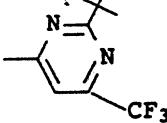
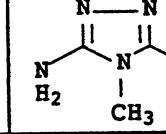
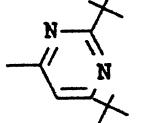
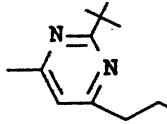
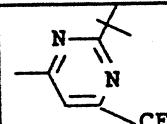
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)



Ex. No.	Ar^1	alk	Ar^2	M.p. [°C]
2		$-(\text{CH}_2)_3^-$		155-162 草酸鹽
3	"	"		83-85 草酸鹽
4	"	"		177-182 反丁烯二酸鹽
5	"	"		72-74
6	"	$-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\text{CH}_2-$		116-119
7	"	$-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_2}{\text{C}}-\text{CH}_2-$		174-180 草酸鹽

五、發明說明 (23)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	alk	Ar ²	M.p. [°C]
8	"	"		60-70 草酸鹽
9		- (CH ₂) ₃ -		166-167 反丁烯二酸鹽
10	"	"		55-60
11	"	"		110-115 草酸鹽
12	"	"		136-140 氫氯化物
13	"	"		95-98
14		"		142-144
15		-CH ₂ -CH-CH ₂ - CH ₃		125-128
16	"	-CH ₂ -C=CH ₂ - CH ₂		113-119 草酸鹽
17	"	"		230-232 氫氯化物

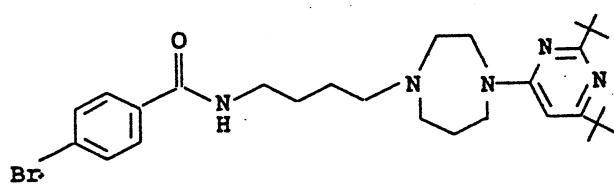
五、發明說明 (24)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	alk	Ar ²	M.p. [°C]
18		$-(CH_2)_3^-$		油
19	"	"		109-110
20	"	"		60-67
21	"	$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$	"	180-190 氫氧化物
22	"	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2-$	"	119-122
23	"	$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		92-97 草酸鹽

實例 24

1 - (4 - 溴苯甲醯胺) - 4 - [4 - (2 , 6 - 雙 - 特丁基 - 4 - 嘧啶基) 六
氫 - (1 H) - 1 , 4 - 二氮雜草 - 1 - 基) 丁烷



製備起動物質

a) 六氫 - 1 - [2 - 特丁基 - 6 - 三氟甲基 - 4 - 嘙啶基] - 4 - (4 - 酰醯

五、發明說明 (25)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

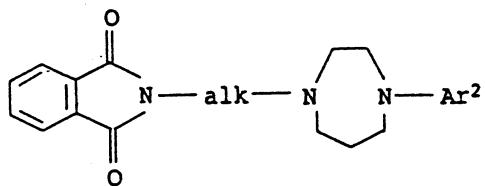
胺苯丁基)-(1H)-1,4-二氮雜草

將10克(0.033莫耳)於實例1c)中製備之二氮雜草與9.8克(0.035莫耳)N-(4-溴丁基)酞醯胺苯及9.1克(0.066莫耳)碳酸鉀於120毫升丙醯腈中一起迴流8小時。過濾混合物並濃縮濾液。處理殘餘物，進一步未純化。

產量：16.2克(98%理論值)

從乙醇再結晶一樣品。熔點97-99°C

以類似方式得到以下：



alk	Ar ²	M.p. [°C]
-(CH ₂) ₃ -		89-92
$-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{ }{\text{C}}}=\text{CH}-\text{CH}_2-$	"	130-132
-(CH ₂) ₃ -		119-121
-(CH ₂) ₄ -	"	207-209
-(CH ₂) ₄ -		190-192

五、發明說明 (26)

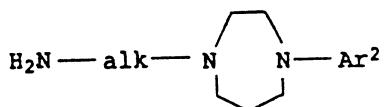
b) 六氫-1H-[2-特丁基-6-三氟甲基-4-嘧啶基]-4-(4-胺丁基)-1,4-二氮雜草

將 15 克 (0.03 莫耳) 上述 a) 之產物與 6 克胼水合物於 200 毫升乙醇中迴流 2 小時，吸濾沉澱物並將濾液蒸發。於乙酸乙酯中採取殘餘物，再次過濾，以水清洗，乾燥並再次蒸發。

得到 9.2 克 (83% 理論值) 油。

以類似方式得到以下：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)



alk	Ar ²	M.p. [°C]
$-(\text{CH}_2)_4-$		油
$-(\text{CH}_2)_3-$	"	油
$-(\text{CH}_2)_4-$		油
$-(\text{CH}_2)_3-$		二氯化物：241-245

製備最終產物：

將 3 克 (0.0083 莫耳) b) 中得到之產物以 0.9 克 (0.009 莫耳) 三乙胺 / 60 毫升四氫呋喃溶液溶解，在室溫以 10 分鐘滴入

五、發明說明 (27)

2克(0.009莫耳)4-溴苯甲醯氯/10毫升四氫呋喃溶液。1小時後，於減壓下將溶劑蒸餾移除，將殘餘物與水混合並以二氯甲烷萃取二次。將乾燥且濃縮之溶劑相以閃蒸層析(矽膠，具3%甲醇之二氯甲烷移動相)純化。

產量：4.2克(93%理論值)

熔點125-127°C(自二異丙醚/異丙醇)

$C_{28}H_{42}BrN_5O$ (544.6)

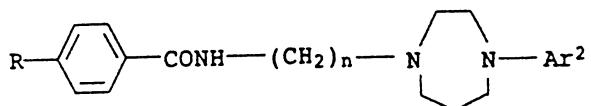
使用各種胺基衍生物(類似24b)及已知之苯甲醯氯得到下表2中所列之化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

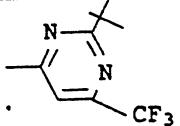
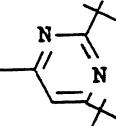
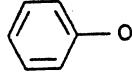
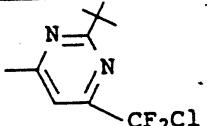
訂

五、發明說明 (28)

表 2



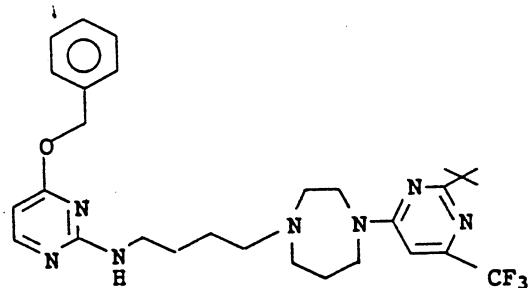
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

實例編號	R	n	Ar ²	M.p. [°C]
25	Br	3	"	169-171
26	"	4		74-76 草酸鹽
27	特丁基	4		165-167 草酸鹽
28		4	"	104-107 草酸鹽
29	Br	4		92-94 草酸鹽
30	I	4	"	110-115 草酸鹽

實例 31

4-[4-{4-芐氧基-2-嘧啶胺}丁基]-1-[2-特丁基-6-三氟甲基-4-嘧啶基]六氫-1H-1,4-二氮雜草 oxalate

五、發明說明 (29)



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

將 2.7 克 (0.007 莫耳) 實例 24b) 中製備之胺基化合物與 0.3 克 氫化鈉 (0.009 莫耳) 添加於 20 毫升二甲基甲醯胺。反應 1 小時後，將 1.6 克 (0.006 莫耳) 4- 苯 氧 基 -2- 甲 基 磺 酰 嘧 呪 (以 氧 化 4- 苯 氧 基 肽 嘧 呪 製 備) 溶 於 10 毫 升 二 甲 基 甲 醚 胺 之 溶 液 加 入，在 室 溫 攪 拌 72 小 時。

其後添加水，以乙酸乙酯萃取混合物二次，將混合物乾燥並濃縮。以管柱層析(矽膠)具4%甲醇之二氯甲烷)純化。

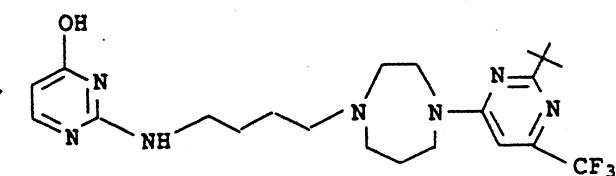
純產量：1.0克（30%理論值），

草酸鹽：熔點145-150°C

$$\text{C}_{29}\text{H}_{38}\text{F}_3\text{N}_7\text{O} \cdot \text{C}_2\text{H}_2\text{O}_4 \quad (647.7)$$

實例32

1-[2-特丁基-6-三氟甲基-4-嘧啶基]-4-{4-羟基-2-
嘧啶胺}丁基]六氟-(1H)-1,4-二氟杂草



將 0.7 克 (0.001 莫耳) 前述實例之化合物在甲醇中，以碳

五、發明說明 (30)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

載鈀觸媒(10% 鈀)，於一般條件下氫化。

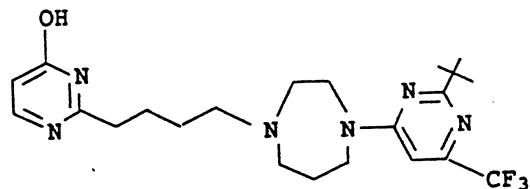
產量：0.6克(理論之100%)

熔點：111~115°C

$C_{22}H_{32}F_3N_7O \cdot C_2H_4O_4$ (557.5)

實例33

1-[2-特丁基-6-三氟甲基-4-嘧啶基]-4-[4-(4-羥基-2-嘧啶基)丁基]六氫-1H-1,4-二氮雜草



a) 1-[2-特丁基-6-三氟甲基-4-嘧啶基]-4-(4-氯丁基)六
氫-1,4-二氮雜草

將9.1克(0.03莫耳)實例1c)之二氮雜草溶於3.5克(0.03
莫耳)5-氯戊腈及9.1克三乙胺(0.09莫耳)/100毫升二甲基
甲醯胺，並於100°C加熱24小時。

繼之於減壓下蒸餾移除溶劑，添加水，以乙酸乙酯萃取該
混合物，以硫酸鈉乾燥此相並濃縮。處理此殘餘物，進一步
未純化。

產量：9.1克褐色油。

b) 1-[2-特丁基-6-三氟甲基-4-嘧啶基]-4-(4-甲脒丁基)
六氫-1,4-二氮雜草 hydrochloride

將9.1克(0.024莫耳)上述腈溶於2毫升乙醇及50毫升二
氯甲烷(皆無水)，冷卻至0-10°C，通入乾燥氯化氫氣體

五、發明說明 (31)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

至飽和。攪拌過夜後，吸濾沉澱物並濃縮濾液。

產量：7.6克(58%理論值)。

製備最終產物

將4.4克(0.01莫耳)上述胺與甲醯乙酸乙酯之鈉化合物(

製備J. Org. Chem. 35 (1970), 2515 et seq.) (2.8克(0.02莫耳))於50毫升水及20毫升四氫呋喃中攪拌過夜。然後以乙酸乙酯萃取反應混合物數次，將有機相乾燥並濃縮。以管柱層析(矽膠，具4%甲醇之洗提二氯甲烷)純化殘餘物。

產量：1.9克(42%)油

NMR : (CDCl_3) δ : 1.3 (s, 9H) ; 1.8-2.0 (m, 4H) ; 2.0 (m, 2H) ; 2.4-2.6 (m/br, 6H) ; 2.5 (t, 2H) ; 3.5 (m, 1H) ; 4.0 (m, 2H) ; 6.2 (d, 1H) ; 6.5 (s, 1H) ; 7.8 (d, 1H)



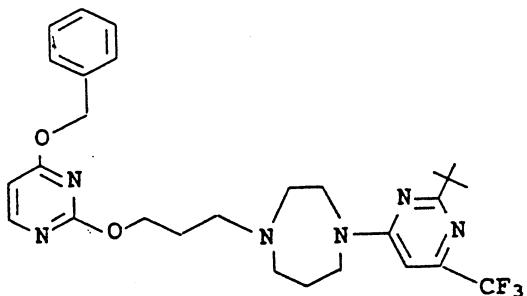
熔點：173-177°C (分解)

實例34

1-[2-特丁基-6-三氟甲基-4-噁啶基]-4-[3{4-苯氧基-2-噁啶氧基}丙基]六氫-(1H)-1,4-二氮雜草

五、發明說明 (32)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)



a) 起動物質

於 50 毫升 abs. THF 中採取 8.9 克 (64.5 毫莫耳) 3-溴基-1-丙醇，連續添加 6.52 克 (64.5 毫莫耳) 三乙基胺，催化量之碘化鈉及 16.2 克 (53.7 毫莫耳) 實例 1c) 中製備之 azepine，迴流混合物 16 小時。濾除沉澱鹽並於減壓下濃縮母液。於二氯甲烷中吸取產生之油，以水清洗有機相，於硫酸鈉上乾燥，其後以管柱層析 (SiO_2 ，移動相 $\text{CH}_2\text{Cl}_2 : \text{MeOH} = 98:2$) 純化以得到無色油。

產量：10.11 克 (53%)

b) 最終產物

將 0.26 克 (8.52 毫莫耳) 氫化鈉 (80%) 逐份添加於 2.45 克上述產物，溶於 25 毫升絕對 DMF，在室溫並於保護氣體大氣壓下將混合物攪拌 30 分鐘。然後滴入溶於 15 毫升絕對 DMF 之 1.5 克 (5.68 毫莫耳) 2-甲烷磺基-4-苯氧噁啶 (以類似文獻之方法製備：W. E. 巴涅特，R. F. 扣貝 (Koebel) 四方錐體文獻 (Tetrahedron Lett.) 1971, 20, 2867)。7 小時後，將混合物倒入水中並以特丁基甲醚萃取處理。以水清洗有機相，於硫酸鈉上乾燥，過濾並於減壓下濃縮。以管柱層析 (SiO_2 ，移動相 $\text{CH}_2\text{Cl}_2 : \text{MeOH} = 98 : 2$) 純化產生之

五、發明說明 (33)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

油，產生油狀物質。

產量：1.6克(2.9毫莫耳，52%)。

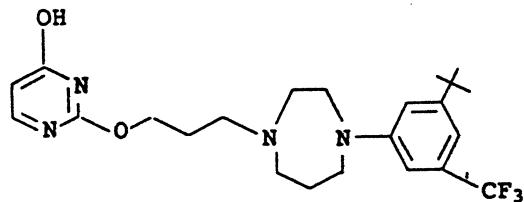
為了形成氫氯化物，將該油溶於乙酸乙酯/Et₂O，在保護氣下添加精油氫氯酸，以吸濾過濾產生之鹽。

熔點：110-112°C

C₂₈H₃₆ClF₃N₆O₂ (581.1)

實例35

1-[2-特丁基-6-三氟甲基-2-嘧啶基]-4-[3-(4-羥基-2-嘧啶基氧)丙基]六氫-(1H)-1,4-二氮雜草



將1.4克(2.6毫莫耳)實例34之物質，溶於40毫升乙酸乙酯，在室溫與0.2克Pd/C(10% Pd)混合，並在大氣壓下於40-50°C以氫氣化。反應完全後，將觸媒以吸濾濾除，以乙酸乙酯清洗後，在減壓下過濾並濃縮。

產量：1.2克(100%)

為了形成氫氯化物，將該油溶於乙酸乙酯/Et₂O，在保護氣下添加精油氫氯酸，以吸濾過濾產生之鹽。

熔點：78-80°C

C₂₁H₃₀ClF₃N₆O₂ (491)

以類似方式得到下表3至17中敘述之化合物。

五、發明說明 (34)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

製藥形式實例

A) 錠劑

以傳統方式在製錠機中壓縮以下組合物之錠粒：

40 毫克	實例 1 之物質
120 毫克	玉米粉
13.5 毫克	明膠粉
45 毫克	乳糖
2.25 毫克	Aerosil® (半微細密分佈之化學純矽石)
6.75 毫克	馬鈴薯粉 (6% 膏)

B) 塗佈錠劑

20 毫克	實例 4 之物質
60 毫克	核心組合物
70 毫克	糖塗層組合物

核心組合物包括 9 份玉米粉，3 份乳糖及 1 份乙烯吡咯啶酮 / 乙酸乙烯酯 60 : 40 之共聚物。糖塗層組合物包括 5 份蔗糖，2 份玉米粉，2 份碳酸鈣及 1 份滑石。以此方式產生之塗佈錠粒因而具備腸塗層。

生物調查 - 受納體黏合研究

1) D₃ 黏合分析

使用無性繁殖之 CCL 1,3 老鼠纖維母細胞作為黏合研究，其表示人體 D₃ 受納體且可得自 Res. 生化機構 (Biochemicals Internat.) 萬史翠莫路 (One Strathmore Rd)., 那提克 (Natick), MA01760-2418 USA。

五、發明說明 (35)

製備細胞

以 10% 胎牛血清 (GIBCO 編號 041-32400N)；100 U/ml 盤尼西林 及 0.2% 鏈黴素 (GIBCO BRL，蓋德斯堡 (Gaithersburg, MD, USA) 於 RPMI-1640 中成長表示 D₃ 之細胞。48 小時後，以 PBS 清洗細胞並以含 0.05% 蛋白酶之 PBS 培養 5 分鐘。以介質中和後，以 300 克離心收集細胞。關於細胞溶解，以溶解緩衝劑 (5 mM 巯-HCl, pH 7.4, 含 10% 甘油) 簡單清洗該小圓粒，其後在 4°C 於濃度為 10⁷ 細胞/毫升之溶解緩衝劑培養 30 分鐘。以 200 克離心收集細胞 10 分鐘並將該小圓粒保存於液態氮中。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

黏合分析

關於 D₃ 受納體分析，將膜分散於培養緩衝劑 (50 mM 巯-HCl, pH 7.4, 含 120 mM NaCl, 5 mM KCl, 2 mM CaCl₂, 2 mM MgCl₂, 10 μM 嘇啉醇, 0.1% 抗壞血酸及 0.1% BSA)，濃度為約 10⁶ 細胞 / 250 μl 分析混合物，並以 0.1 nM ¹²⁵I-舒必來 (sulpiride) 在有無測試物質存在下於 30°C 培養。以 10⁻⁶ M 實必泊隆 (spiperone) 測定非特定黏合。

60 分鐘後，經由史格壯 (Skatron) 細胞收集器 (史格壯，萊耳 (Lier)，挪威) 中之 GF/B 玻璃纖維過濾器 (懷特曼 (Whatman)，英國) 過濾，分離自由態及黏合之輻射配位子，並以 pH 7.4 之冰冷 差 - HCl 緩衝劑清洗過濾器。使用派克 (Packard) 2200 CA 液體閃爍計數器定量過濾器上收集之輻射性。

五、發明說明 (36)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

使用 LIGAND 程式以非線性回歸分析測定 K_i 值。

2) D₂黏合分析

細胞培養

於具 10% 胎牛血清白蛋白之 25 mM HEPES 及具 Glutamax I™ 之 RPMI 1640 中培養具安定人體多巴胺 D₂A 受納體之 HEK-293 細胞。所有介質每毫升含 100 單位盤尼西林及 100 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 鍾徽素。將該細胞在具 5% CO₂ 濕氣大氣中維持於 37 °C。

在室溫以胰蛋白酶化 (0.05% 胰蛋白溶液) 製備用於黏合研究之細胞 3-5 分鐘。然後以 250 克離心該細胞 10 分鐘，並在 4 °C 以溶解緩衝劑 (5 mM 參-HCl, 10% 甘油, pH 7.4) 處理 30 分鐘。以 250 克離心 10 分鐘後，將殘餘物保存於 -20 °C 直到使用。

受納體黏合分析

1) 具 ¹²⁵I-實必泊隆 (spiperone) (81 TBq/mmol, 杜邦公司 (Du Pont de Nemours, 德瑞克 (Dreieich)) 之多巴胺 D₃受納體 "低親和力態"

該混合物 (1 毫升) 包括培養緩衝劑 (50 mM 參, 120 mM NaCl, 5 mM KCl, 2 mM MgCl₂ 及 2 mM CaCl₂, pH 7.4, 含 HCl) 中之 1×10^5 個細胞 及 0.1 nM ¹²⁵I-實必泊隆 (spiperone) (總黏合) 或添加 1 μM 哈泊度 (haloperidol) (非特定黏合) 或測試物質。

在 25 °C 培養 60 分鐘後，經由史格壯細胞收集器 (辛瑟 (Zinsser), 法蘭克福) 中之 GF/B 玻璃纖維過濾器 (懷特曼

五、發明說明 (37)

，英國)過濾該混合物，並以冰冷之50 mM叄-HCl緩衝劑，pH 7.4清洗過濾器。使用派克2200 CA閃爍計數器定量過濾器上收集之輻射性。

如a)般評估。

使用配位子程式以非線性回歸分析或使用承恩及普魯索夫(Cheng and Prusoff)化學式轉換 IC_{50} 值測定 K_i 值。

在這些分析中，根據本發明之化合物在D₃受納體上顯現非常良好之親和力，及對於D₃受納體之高選擇性。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

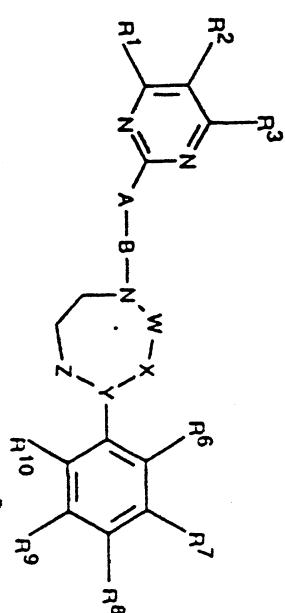
A7

B7

五、發明說明 (38)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 3



實例編號	R ₁	R ₂	R ₃	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀	W	X-Y-Z	A	B
36	H	H	OH	H	iBu	H	Me	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃
37	H	H	OH	H	iBu	H	Ph	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
38	Me	H	OH	H	iBu	H	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
39	H	H	NH ₂	H	iProp	H	2-Naph	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
40	H	Me	OH	H	Et	H	iBu	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃
41	H	H	OH	H	CHF ₂	H	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃	
42	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃	H	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
43	H	H	OH	H	CF ₃	H	iBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃
44	H	H	NHMe	H	iProp	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-(CH ₂) ₄	
45	Me	H	OH	H	CN	iBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃	
46	H	H	OH	H	F	iBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃	
47	H	Me	NH ₂	H	Cl	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃	
48	H	H	NHMe	H	iBu	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
49	H	H	OH	iProp	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₄	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

A7

B7

五、發明說明 (39)

50	H	H	OH	H	CHF ₂	H	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	C=H-C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
51	H	H	OH	OMe	iBut	H	C ₃	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
52	Me	H	OH	H	CF ₃	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-(CH ₂) ₅	
53	H	H	NH ₂	H	nProp	CN	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
54	H	H	Me	OH	H	CN	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
55	H	H	H	H	Ph	C≡CH	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
56	NH ₂	H	H	H	iBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃	
57	NHMe	H	H	H	OMe	nProp	F	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₄
58	H	H	H	OH	OMe	Ph	CN	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
59	H	H	H	OH	H	Ph	CN	iBut	Me	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
60	H	H	H	OH	OMe	iBut	F	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
61	H	H	H	OH	H	iBut	H	Me	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
62	H	H	H	OH	H	iBut	H	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
63	Me	H	H	OH	H	iBut	H	1-Pyrrol	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
64	H	H	NH ₂	H	iProp	H	2-Naph	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃	
65	H	H	Me	OH	H	Et	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
66	H	H	H	OH	H	CHF ₂	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
67	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
68	H	H	OH	H	CF ₃	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-(CH ₂) ₃	
69	H	H	NHMe	H	iProp	H	H	CH ₂	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
70	Me	H	H	OH	H	CN	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	

A7

B7

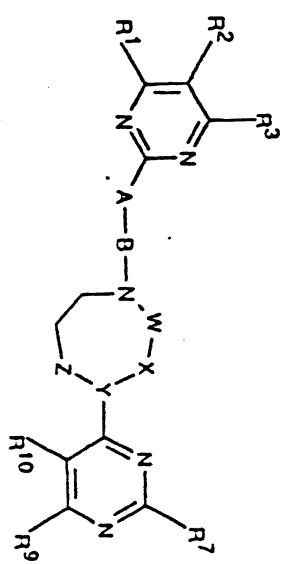
五、發明說明 (40)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

71	H	H	OH	H	H	F	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ C(CH ₃)=CH-CH ₂	
72	H	H	Me	NH ₂	H	H	Cl	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
73	H	H	NHMe	H	tBut	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	
74	H	H	OH	H	iProp	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	
75	H	H	OH	H	CHF ₂	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -	
76	H	H	OH	OMe	tBut	H	CF ₃	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂	
77	Me	H	OH	OMe	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -	
78	H	H	NH ₂	H	nProp	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -	
79	H	H	Me	OH	H	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -
80	H	H	OH	H	Ph	C≡CH	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	
81	H	H	NH ₂	H	tBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -	
82	H	H	NHMe	H	tBut	CN	CF ₃	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	
83	H	H	OH	H	nProp	F	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	
84	H	H	OH	Ph	CN	tBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -		
85	H	H	OH	tBut	F	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 4



A7
B7

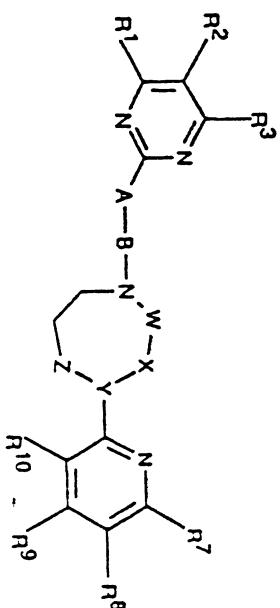
五、發明說明 (41)

實例編號	R1	R2	R3	R7	R9	R10	W	X-Y-Z	A	B	
86	H	H	OH	tBut	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃	
87	H	H	OH	tBut	2-Naph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
88	Me	H	OH	tBut	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂	
89	H	H	NH ₂	tBut	cHex	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂	
90	H	H	OH	tBut	nHex	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
91	H	H	OH	tBut	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂	
92	H	H	Me	OH	iProp	F	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂
93	H	H	NH ₂	CH ₃	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -C=CH	NH	-(CH ₂) ₃	
94	H	H	OH	OMe	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂	
95	H	H	OH	tBut	H	CH ₃	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂	
96	H	H	OH	tBut	tBut	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
97	Me	H	OH	tBut	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂	
98	H	H	NH ₂	Ph	tBut	Cl	CH ₂	CH ₂ -C=CH	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂	
99	H	H	OH	2-Naph	tBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
100	H	H	OH	tBut	CF ₃	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂	

五、發明說明 (42)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 5



實例編號	R1	R2	R3	R7	R8	R9	R10	W	X-Y-Z	A	B
i01	H	H	OH	tBut	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
102	H	H	OH	tBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
103	Me	H	OH	tBut	H	Cl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
104	H	H	OH	H	CN	tBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(C ₂ H ₅)-CH ₂
105	H	H	NH ₂	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
106	H	H	OH	nProp	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(C ₂ H ₅)-CH ₂
107	H	H	Me	OH	H	iProp	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
108	H	H	OH	tBut	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(-CH ₂)-CH ₂
109	H	H	OH	tBut	CN	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
110	H	H	NH ₂	tBut	H	Cl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-(CH ₂) ₃
111	Me	H	OH	H	CN	tBu	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
112	H	H	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂	
113	H	H	OH	nProp	H	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃

A7

B7

五、發明說明 (43)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

114	H	H	H	NHMe	H	H	iProp	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
115	H	H	H	OH	nProp	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
116	H	H	H	OH	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
117	Me	OH	OH	Ph	C≡CH	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
118	H	H	H	OH	tBut	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
119	H	H	H	NH ₂	tBut	H	nProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
120	H	H	H	OH	Ph	H	tBut	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂	-(CH ₂) ₅
121	H	H	Me	OH	CF ₃	H	tBut	F	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
122	H	H	H	OH	tBut	F	H	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂
123	H	H	OH	nProp	CN	tBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂	
124	H	H	NH ₂	nProp	C≡CH	tBut	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂	
125	H	H	OH	iBut	CN	H	Me	CH ₂	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄

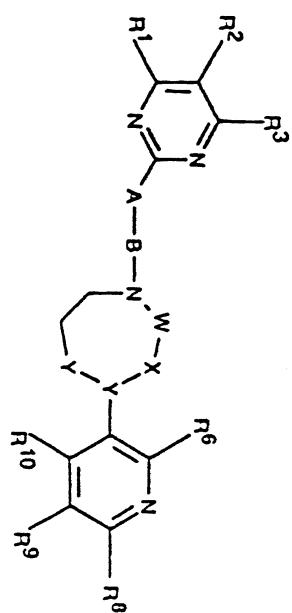
A7

B7

五、發明說明 (44)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 6



實例編號	R1	R2	R3	R6	R8	R9	R10	W	X-Y-Z	A	B
126	H	H	OH	OMe	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
127	H	H	OH	OMe	H	CF ₃	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
128	Me	H	OH	OMe	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
129	H	H	OH	H	CN	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -
130	H	H	NH ₂	H	F	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
131	H	H	OH	Me	Cl	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
132	H	H	Me	OH	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
133	H	H	OH	H	H	tBut	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
134	H	H	OH	CN	H	CF ₃	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
135	H	H	NH ₂	H	CN	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
136	Me	H	OH	H	H	tBu	F	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ C(CH ₃)=CH-CH ₂ -
137	H	H	OH	H	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃
138	H	H	OH	Me	H	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
139	H	H	NHMe	OMe	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -

A7

B7

五、發明說明 (45)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

140	H	H	H	OH	OMe	CN	tBut	H-	CH ₂	CH=CH-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃ -
141	H	H	OH	OMe	Me	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃ -	
142	Me	H	OH	H	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	
143	H	H	OH	Me	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -	
144	H	H	NH ₂	H	Cl	CF ₃	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃ -	
145	H	H	OH	OMe	CN	tBut	Me	CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
146	H	Me	OH	Me	Me	iProp	Me	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃ -	

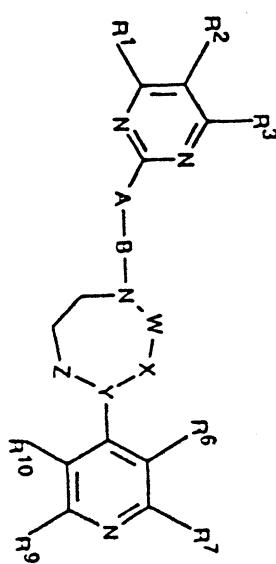
A7

B7

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (46)

表 7



實例編號	R1	R2	R3	R6	R7	R9	R10	W.	X-Y-Z	A	B
147	H	H	OH	H	tBut	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
148	H	H	OH	H	tBut	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
149	Me	H	OH	H	tBut	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
150	H	H	OH	H	nPropyl	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
151	H	H	NH ₂	H	CF ₃	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
152	H	H	OH	H	2-Naphl	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH=CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -C(CH ₂)=CH-CH ₂
153	H	H	Me	OH	OMe	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
154	H	H	OH	OMe	iProp	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(CH ₂)=CH-CH ₂
155	H	H	OH	OMe	H	CF ₃	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
156	H	H	NH ₂	H	tBut	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
157	Me	H	OH	H	iProp	H	Me	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
158	H	H	OH	CN	tBut	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
159	H	H	OH	H	CF ₃	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂	
160	H	H	NHMe	H	nProp	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂

A7

B7

五、發明說明 (47)

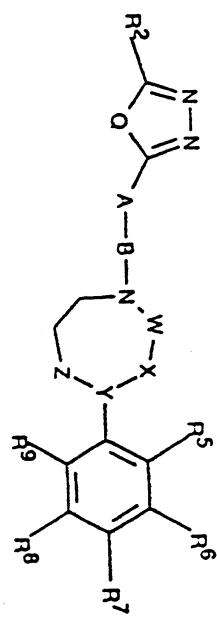
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

161	H	H	H	OH	OMe	tBut	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
162	H	H	H	OH	OMe	tBut	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₁ =C-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₃
163	Me	H	H	OH	Me	tBut	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂
164	H	H	H	OH	Me	tBut	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
165	H	H	NH ₂	H	tBut	iProp	H	H	CH ₂	CH ₁ -C-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃
166	H	H	OH	Me	CF ₃	tBut	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -CH(C(CH ₃)-CH ₂)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (48)

表 8



實例編號	Q	R2	R5	R6	R7	R8	R9	W	X-Y-Z	A	B
167	NCH ₃	NH ₂	H	iBut	H	Me	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
168	S	NH ₂	H	iBut	H	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
169	NCH ₃	NH ₂	H	iBut	H	1-Pyrrolyl	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₃
170	NCH ₃	NH ₂	H	iProp	H	2-Naph	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
171	S	NH ₂	H	Et	H	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
172	S	NH ₂	H	CHF ₂	H	H	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₈
173	NCH ₃	NH ₂	H	CHF ₂	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -C [≡] H	S	-(CH ₂) ₁₀
174	NCH ₃	NH ₂	H	CF ₃	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₃
175	NCH ₃	NH ₂	H	iProp	F	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
176	NCH ₃	NH ₂	H	CN	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	O	-(CH ₂) ₃	
177	S	NH ₂	H	F	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
178	NCH ₃	NH ₂	H	Cl	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
179	NCH ₃	NH ₂	H	iBut	H	OMe	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃	
180	S	NH ₂	H	nProp	CN	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
181	NCH ₃	NH ₂	H	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
182	NCH ₃	NH ₂	H	Ph	C=CH	iBut	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

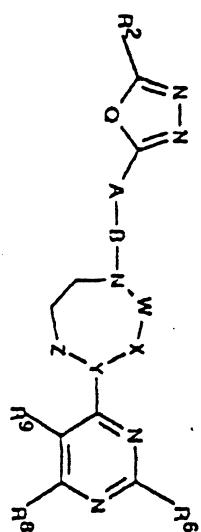
五、發明說明 (49)

183	NCH ₃	NH ₂	OMe	tBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -CH=CH	S	-(CH ₂) ₃
184	S	NH ₂	H	tBut	CN	CF ₃	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₃
185	NCH ₃	NH ₂	H	Ph	CN	tBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-(CH ₂) ₃
186	NCH ₃	NH ₂	Me	tBut	F	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
187	S	NH ₂	H	iProp	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
188	N(iProp)	NH ₂	H	tBut	H	Me	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
189	N(iProp)	NH ₂	H	tBut	H	Ph	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₄
190	S	NH ₂	H	tBut	H	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₈
191	N(iProp)	I ⁻ -2	H	iProp	H	2-Naph	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
192	S	NH ₂	H	tEt	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₁₀
193	N(iProp)	NH ₂	H	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₄
194	N(iProp)	NH ₂	H	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₃	
195	N(iProp)	NH ₂	H	H	F	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
196	N(iProp)	NH ₂	H	H	Cl	iProp	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₈
197	S	NH ₂	H	tBut	H	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
198	N(iProp)	NH ₂	H	nProp	CN	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
199	S	NH ₂	H	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
200	N(iProp)	NH ₂	H	Ph	C=CH	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
201	N(iProp)	NH ₂	H	tBut	CN	CF ₃	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₃
202	N(iProp)	NH ₂	H	Ph	CN	tBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-(CH ₂) ₃
203	S	NH ₂	H	iProp	H	H	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₈
204	N(iProp)	NHMe	H	tBut	H	Me	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)CH ₂

五、發明說明 (50)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 9



實例編號	Q	R2	R6	R8	R9	W ⁻	X-Y-Z	A	B
226	NCH ₃	NH ₂	tBut	Ph	H	CH ₂	ClH ₂ -N-CH ₁ H ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃ -
227	NCH ₃	NH ₂	tBut	2-Naph ^t	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₁ H ₂	S	-CH ₂ -C(-CH ₂)-CH ₁ H ₂ -
228	NCH ₃	NH ₂	tBut	1-Pyrrolyl	H	CH ₁ H ₂ CH ₁ H ₂	CH ₂ N-CH ₁ H ₂	S	-(CH ₂) ₃ -
229	NCH ₃	NHMe	tBut	CH ₁ ter	H	CH ₂ -CH ₁ H ₂	CH ₂ -CH ₁ C	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃ -
230	NCH ₃	NH ₂	tBut	CH ₁ tex	H	CH ₂	CH ₁ H ₂ N-CH ₁ H ₂	S	-(CH ₂) ₅ -
231	S	NH ₂	tBut	Ph	H	CH ₂	CH ₂ N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₈ -
232	S	NHMe	iProp	1-Pyrryl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₁ H ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₁ H ₂ -
233	S	NH ₂	CH ₁ H ₃	CH ₃	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH ₁ C	NH	-(CH ₂) ₃ -
234	NCH ₃	NH ₂	H	CH ₁ F ₂	H	CH ₁ H ₂	CH ₂ N-CH ₁ H ₂	O	-CH ₂ -C(-CH ₂)-CH ₁ H ₂ -
235	S	NHMe	tBut	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₁ H ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₁₀ -
236	S	NHMe	tBut	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ N-CH ₁ H ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -
237	NCH ₃	NH ₂	tBut	tBut	H	CH ₂	CH ₂ N-CH ₁ H ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₂) ₂ -CH ₂ -
238	NCH ₃	NH ₂	2-Naph ^t	tBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂ -CH ₂ -
239	S	NH ₂	tBut	CF ₃	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH ₁ C	S	-(CH ₂) ₈ -
240	NCH ₃	NH ₂	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₁ H ₂	S	-(CH ₂) ₃ -	

A7
B7

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (51)

205	N(iProp)	NHMe	H	tBut	H	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
206	S	NHMe	H	tBut	H	1-Pyrrolyl	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -
207	N(iProp)	NHMe	H	iProp	H	2-Naph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -
208	N(iProp)	NHMe	H	Et	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -
209	N(iProp)	OH	H	tBut	H	Cl	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
210	N(iProp)	OH	H	CF ₃	H	Cl	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	NH	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
211	N(iProp)	OH	H	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
212	S	OH	H	iProp	CN	F	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
213	N(iProp)	OMe	H	H	CN	tBut	H	CH ₂	CH ₂ CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
214	N(iProp)	OMe	H	H	F	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -
215	S	OMe	H	H	Cl	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	O	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
216	N(iProp)	OMe	H	tBut	H	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	NH	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -	
217	N(iProp)	NHMe	H	nProp	CN	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
218	S	NHMe	H	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
219	N(iProp)	OH	H	Ph	C≡CH	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH=CH ₂ -
220	N(iProp)	OH	OMe	tBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	NH	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
221	N(iProp)	OH	H	tBut	CN	CF ₃	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
222	S	OH	H	nProp	F	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
223	S	OMe	H	Ph	CN	tBut	Me	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
224	N(iProp)	OMe	OMe	tBut	F	H	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
225	N(iProp)	OMe	H	iProp	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項(再填寫本頁))

五、發明說明 (52)

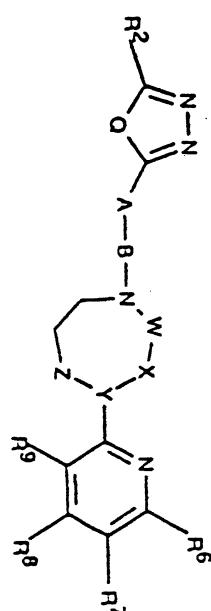
241	N(iProp)	NH ₂	tBut	Ph	H	Cl-CH ₂ -CH ₂	Cl=C-CH ₂	S	-CH ₂ (C=CH ₂)CH ₂
242	N(iProp)	NH ₂	tBut	2-Naph	H	CH ₂	CH ₂ -Cl=C	NH	-(CH ₂) ₃
243	N(iProp)	NH ₂	tBut	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-CH ₂ -Cl(C ₂ H ₅)-CH ₂
244	N(iProp)	NH ₂	tBut	clex	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃
245	S	NH ₂	tBut	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₂)-CH ₂
246	S	OH	tBut	F	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₁₀
247	N(nProp)	OMe	iProp	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -Cl=CH-CH ₂
248	N(nProp)	OMe	CH ₃	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
249	N(nProp)	NCH ₂ Ph	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
250	N(iProp)	OH	tBut	tBut	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₄
251	N(iProp)	OH	iProp	F	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂	
252	N(iProp)	OMe	Ph	tBut	Cl	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₅
253	N(iProp)	OMe	2-Naph	tBut	Me	CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₃
254	N(nProp)	NCH ₂ Ph	tBut	CF ₃	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
255	N(iProp)	NHMe	tBut	H	CH ₃	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -Cl(C ₂ H ₅)-CH ₂

A7

B7

(請先閱讀背面之注意事項(再填寫本頁))

表 10



實例編號	Q	R2	R6	R7	R8	R9	W	X-Y-Z	A	B
256	NCH ₃	NH ₂	iBut	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
257	S	OH	iBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₈
258	N(iProp)	NHMe	iBut	H	Cl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ C(=CH ₂)-CH ₂
259	NCH ₃	NH ₂	H	CN	iBu	H	CH ₂	CH ₂ -C(=C)-	-CH ₂ -CH ₂ (CH ₃)-CH ₂	
260	NCH ₃	NHMe	CF ₃	H	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
261	N(cProp)	NH ₂	nProp	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ C(=CH ₂)-CH ₂
262	S	NHMe	H	H	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₁₀
263	NCH ₃	NH ₂	iBut	H	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ C(=CH ₂)-CH ₂
264	N(iProp)	NH ₂	iBut	CN	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
265	NOH	NHMe	iBut	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	O	-(CH ₂) ₃
266	NCH ₃	OH	H	CN	iBu	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH ₂
267	NEt	NH ₂	CF ₃	H	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
268	S	NH ₂	nProp	H	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ C(=CH ₂)-CH ₂
269	NCH ₃	NH ₂	nProp	CN	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
270	NCH ₃	OH	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃

五、發明說明 (53)

A7
B7

五、發明說明 (54)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

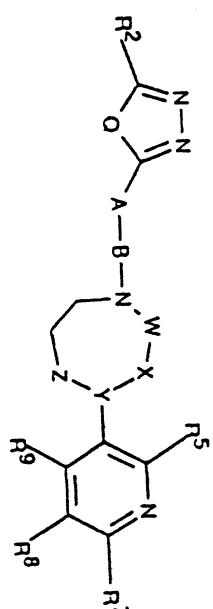
271	N(iProp)	NHMe	Ph	C=CH	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	.CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
272	S	NH ₂	tBut	CN	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	.CH ₂ -	.CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
273	NCH ₃	NHMe	tBut	H	nProp	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃ -
274	N(cProp)	NH ₂	Ph	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	.CH ₂ -	-(CH ₂) ₄ -
275	S	NHMe	CF ₃	H	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃ -
276	NCH ₃	NH ₂	tBut	F	H	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	.CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -
277	S	NH ₂	nProp	CN	iBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	.CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -
278	NCH ₃	OH	nProp	C=CH	iBut	OMe	CH ₂	CH=C-CH ₂	.CH ₂ -	.CH ₂ -C(CH ₃)-CH-CH ₂ -
279	N(iProp)	OMe	tBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄ -
280	NCH ₃	OMe	H	H	iProp	H.	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

A7
B7

五、發明說明 (55)

表 11



實例編號	Q	R2	R5	R7	R8	R9	W	X-Y-Z	A	B
281	NCH ₃	NH ₂	H	CN	tBut	H	-CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
282	NCH ₃	NHMe	H	F	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
283	N(iProp)	NH ₂	Me	Cl	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
284	S	NHMe	H	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₁₀
285	NCH ₃	NH ₂	H	H	tBut	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂
286	N(iProp)	NH ₂	CN	H	CF ₃	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
287	S	NHMe	H	CN	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	O	-(CH ₂) ₈
288	S	OH	H	H	tBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
289	NEt	NH ₂	H	CN	CHF ₂	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
290	NCH ₃	NH ₂	Me	H	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₃
291	N(iProp)	NH ₂	F	CN	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₄
292	S	NH ₂	OMe	Me	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₁₀
293	NCH ₃	NHMe	H	CN	tBut	F	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH=CH ₂
294	NCH ₃	NH ₂	H	C≡CH	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
295	N(iProp)	NH ₂	H	Cl	-CF ₃	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₅

A7

B7

五、發明說明 (56)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

296	NEt	NHMe	H	CN	iBu	Me	$\text{CH}_2\text{-CH}_2$	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{C}$	$-\text{CH}_2-$	$-\text{CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)}\text{-CH}_2-$
297	S	OH	H	$\text{C}\equiv\text{CH}$	iProp	Me	CH_2	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{C}$	S	$-(\text{CH}_2)_8-$
298	NCH ₃	OH	Cl	H	iProp	H	CH_2	$\text{CH}_2\text{-N-CH}_2$	S	$-(\text{CH}_2)_3-$

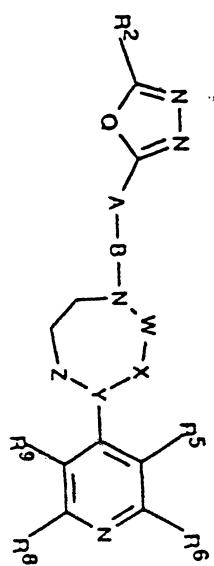
A7

B7

五、發明說明 (57)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 12



實例編號	Q	R2	R5	R6	R8	R9	W	X-Y-Z	A	B
299	NCH ₃	NH ₂	H	iBut	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
300	S	OH	H	iBut	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
301	N(iProp)	NHMe	H	iBut	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂
302	NCH ₃	NH ₂	H	nPropyl	iBut	H	CH ₂ CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
303	NCH ₃	NHMe	H	CF ₃	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃
304	N(cProp)	NH ₂	H	2-Naphth	iBut	H	CH ₂ CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
305	S	NHMe	H	iBut	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-(CH ₂) ₈
306	NCH ₃	NH ₂	H	iProp	CHF ₂	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
307	N(iProp)	NH ₂	OMe	H	CF ₃	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	NH	-(CH ₂) ₄
308	NOH	NHMe	H	iBut	H	F	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	O	-(CH ₂) ₃
309	NCH ₃	OH	H	iProp	H	Me	CH ₂	CH=C-CH ₂	S	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
310	NEt	NH ₂	CN	iBut	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂	-(CH ₂) ₃
311	NCH ₃	NH ₂	H	CF ₃	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₁₀	
312	S	NHMe	H	1-Pyrrolyl	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
313	NCH ₃	OH	H	CF ₃	iBut	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	NH	-

A7

B7

五、發明說明 (58)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

314	NEt	NH ₂	Me	tBut	nProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂ -CH ₂ -
315	NCH ₃	NH ₂	Me	tBut	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₅ -
316	c	NH ₂	H	tBut	tBut	H	CH ₂	CH ₂ =C-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂ -CH ₂ -
317	N(iProp)	NH ₂	Me	CF ₃	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	S	-(CH ₂) ₄ -
318	NCH ₃	OH	H	nProp	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	S	-(CH ₂) ₃ -

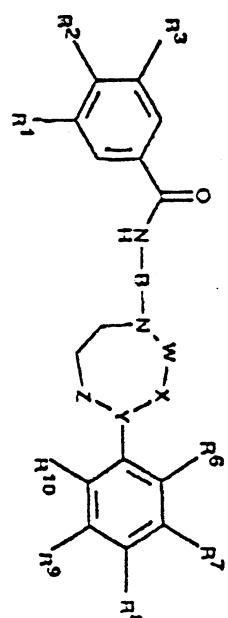
A7

B7

五、發明說明 (59)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 13



實例編號	R1	R2	R3	R6	R7	R8	R9	R10	W	X-Y-Z	B
319	H	Br	H	H	tBut	H	Me	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
320	H	I	H	H	tBut	H	Ph	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-(CH ₂) ₄
321	H	Ph	H	H	tBut	H	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	-(CH ₂) ₄
322	H	p(iProp)-Ph	H	H	iProp	H	2-Naphth	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₄
323	H	pAcetyl-Ph	H	H	Et	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₃
324	H	pBr-Ph	H	H	CHF ₂	H	H	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₄
325	H	pI-Ph	H	OMe	CF ₃	H	H	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-(CH ₂) ₄
326	H	prop	H	H	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
327	H	iBu ₁	H	H	iProp	H	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
328	H	CN	H	H	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₃	
329	H	COOEt	H	H	H	F	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₄
330	H	Oph	H	H	Cl	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄	
331	Me	Br	H	H	tBut	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₄
332	CN	I	H	H	iProp	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄	
333	Me	Ph	H	H	iBut	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-(CH ₂) ₃	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

A7

B7

五、發明說明 (60)

334	F	p(iProp)-Ph	H	OMe	tBut	H	CF ₃	H	Cl ₂ Cl ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(Cl ₂) ₄
335	Me	pAcetyl-Ph	H	H	CF ₃	H	tBut	H	Cl ₂	Cl ₂ -N-Cl ₂	-(Cl ₂) ₅
336	H	pBr-Ph	Me	H	pProp	CN	tBut	H	Cl ₂	Cl ₂ -N-Cl ₂	-(Cl ₂) ₄
337	H	pI-Ph	F	H	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂	Cl ₂ -Cl ₂	-(Cl ₂) ₄
338	H	iProp	Me	H	Ph	C≡CH	tBut	H	Cl ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(Cl ₂) ₄
339	H	tBut	CN	H	tBut	CN	H	H	CH ₂	CH ₂ -Cl ₂ C	-(Cl ₂) ₄
340	H	CN	Me	H	tBut	CN	CF ₃	OMe	Cl ₂ -Cl ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂) ₅
341	H	COOEt	Me	H	pProp	F	tBut	H	Cl ₂	Cl ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂) ₄
342	H	Oph	F	H	Ph	CN	tBut	Me	Cl ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₃
343	C	F	H	H	tBut	F	H	H	Cl ₂ -Cl ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂) ₄
344	H	Br	H	H	tBut	H	Me	H	Cl ₂	Cl ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂) ₄
345	H	I	H	H	tBut	H	Ph	H	Cl ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂ -C(Cl ₂)-Cl ₂)
346	H	Ph	H	H	tBut	H	1-Pyrrol	H	Cl ₂ -CH ₂	CH=C-Cl ₂	-(CH ₂ -C(Cl ₂)-Cl ₂)
347	H	NEt ₂	H	H	iProp	H	2-Naph	H	Cl ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂ -C(Cl ₃)=CH-Cl ₂)
348	H	pAcetyl-Ph	H	H	Et	H	tBut	H	Cl ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂ -C(Cl ₃)=CH-Cl ₂)
349	H	pBr-Ph	H	H	CHF ₂	H	H	H	Cl ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-(CH ₂ -C(Cl ₂)-CH ₂)
350	H	pI-Ph	H	F	CF ₃	H	H	H	Cl ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂ -C(Cl ₃)=CH-Cl ₂)
351	H	iProp	H	H	CF ₃	H	tBut	H	Cl ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂ -C(Cl ₂)-CH ₂)
352	H	tBut	H	H	iProp	H	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂ -C(Cl ₂)-CH ₂)
353	H	CN	H	H	tBut	H	H	H	Cl ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂ -C(Cl ₃)=CH-Cl ₂)
354	H	COOEt	H	H	F	tBut	H	H	Cl ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-Cl ₂	-(CH ₂ -C(Cl ₃)=CH-Cl ₂)

A7

B7

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (61)

355	H	OPh	H	H	H	Cl	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH ₂
356	Me	Br	H	H	tBut	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -CH(C(CH ₃))CH ₂
357	Me	I	H	H	iProp	H	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(C(CH ₃))CH ₂
358	Cl	Ph	H	H	CHF ₂	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH ₂
359	CN	pF(iProp)-Ph	H	OMe	tBut	H	CF ₃	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH=C(CH ₂)CH ₂
360	F	pAcetyl-Ph	H	OMe	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH ₂
361	Me	pBr-Ph	H	H	nProp	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH=CH ₂
362	H	pEt-Ph	CN	H	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH=CH ₂
363	H	iProp	Cl	H	Ph	CF ₃	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH=CH ₂
364	H	iBu	F	H	iBu	CN	H	CH ₂	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
365	H	CN	Cl	H	iBu	CN	CF ₃	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)CH ₂
366	H	COOEt	CN	H	nProp	F	iBu	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH=C(CH ₃)CH ₂
367	H	OPh	Cl	H	Ph	CN	iBu	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₂
368	H	F	Me	H	iBu	F	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH=CH ₂

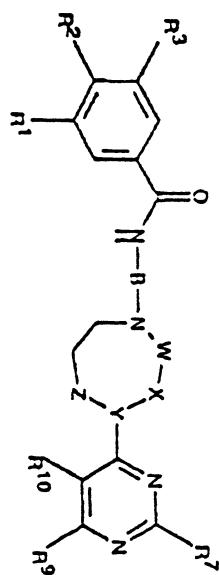
A7

B7

五、發明說明 (62)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 14

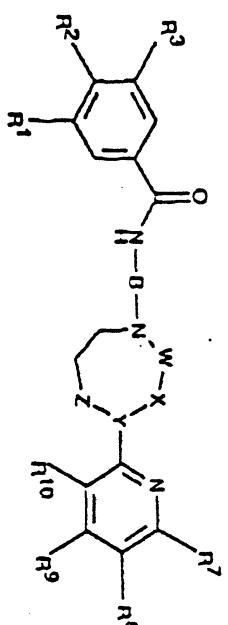


實例編號	R1	R2	R3	R7	R9	R10	W	X-Y-Z	B
369	H	Br	H	tBut	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
370	H	I	H	tBut	2-Naph	H	CH ₂	CH ₂ N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
371	H	Ph	H	tBut	1-Pyromyl	H	CH ₂	CH ₂ N-CH ₂	-CH ₂ C(=CH ₂) ₂ -CH ₂
372	H	p(Prop)-Ph	H	tBut	clex	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH ₂	-CH ₂ C(CH ₃) ₃ -CH ₂ -CH ₂
373	H	pAcetyl-Ph	H	tBut	nLex	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
374	H	pBr-Ph	H	tBut	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(C(CH ₃)-CH ₂
375	H	pT-Ph	H	tProp	F	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH-CH-CH ₂
376	H	iProp	H	iProp	1-Pyryloyl	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH	-(CH ₂) ₄
377	H	tBut	H	OMe	1-Pyrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(C(CH ₃)-CH ₂
378	H	CN	H	tBut	H	CH ₃	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -CH(C(CH ₃)-CH ₂) ₂ -CH ₂
379	H	COOEt	H	tBut	tBut	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
380	H	Oph	H	tBut	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ C(=CH ₂) ₂ -CH ₂
381	Me	Br	H	Ph	tBut	Cl	CH ₂	CH ₂ -C=CH	-CH ₂ C(CH ₃)=CH-CH ₂
382	CN	I	H	2-Naph	tBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-(CH ₂) ₄
383	Me	Ph	H	tBut	-CF ₃	Me	CH ₂	CH ₂ N-CH ₂	-CH ₂ C(-CH ₂) ₂ -CH ₂

五、發明說明 (63)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 15



實例編號	R1	R2	R3	R7	R8	R9	R10	W	X-Y-Z	B
384	H	Br	H	tBut	H	tBut	H	Cl ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
385	H	I	H	tBut	CN	H	H	Cl ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
386	H	Ph	H	tBut	H	Cl	H	Cl ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH ₂
387	H	p(iProp)-Ph	H	H	CN	tBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -CH(C(CH ₃) ₃)-CH ₂
388	H	pAcetyl-Ph	H	CF ₃	H	tBut	H	Cl ₂	Cl ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
389	H	pBr-Ph	H	nProp	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH-C-CH ₂	-CH ₂ -CH(C(CH ₃) ₃)-CH ₂
390	H	pL-Ph	H	H	H	iProp	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₄
391	H	iProp	H	tBut	H	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH ₂
392	H	tBut	H	tBut	CN	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
393	H	CN	H	tBut	H	Cl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH ₂
394	H	COOEt	H	H	CN	tBu	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -C(C(CH ₃) ₃)-CH ₂ -CH ₂
395	H	OPh	H	CF ₃	H	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)CH ₂
396	Me	Br	H	nProp	H	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
397	CN	I	H	H	iProp	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄	

五、發明說明 (64)

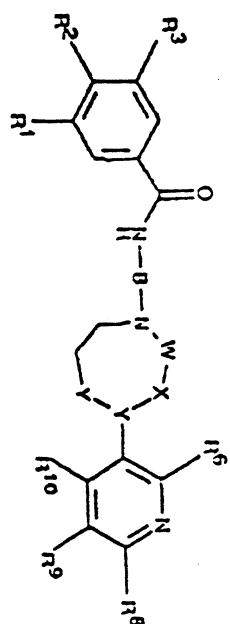
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

398	Me	Ph	H	nProp	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
399	F	p(Prop)-Ph	H	CF ₃	CN	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₄
400	Me	pAcetyl-Ph	H	Ph	C≡CH	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(CN ₃)-CH ₂ -
401	H	pBr-Ph	Me	tBut	CN	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -CH(CN ₃)-CH ₂ -
402	H	pI-Ph	F	tBut	H	nProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₃
403	H	iProp	Me	Ph	H	tBut	OMe	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₅
404	H	tBut	CN	CF ₃	H	iBut	F	CH ₂ -CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂ -CH(CN ₃)-CH ₂ -
405	H	CN	Me	tBut	F	H	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂
406	H	COOEt	Me	nProp	CN	iBut	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH-CH ₂
407	H	pAcetyl-Ph	F	nProp	C≡CH	iBut	H	CH ₂	CH=C-CH ₂	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH-CH ₂
408	Cl	F	H	tBut	CN	H	Me	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄

五、發明說明 (65)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 16



實例編號	R1	R2	R3	R6	R8	R9	R10	W	X-Y-Z	B
409	H	Br	H	OMe	H	iBu	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -
410	H	I	H	OMe	H	CF ₃	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -
411	H	Ph	H	OMe	H	iBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
412	H	p(iProp)-Ph	H	H	CN	iBu	H	CH ₂	CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
413	H	pAcetyl-Ph	H	H	F	iBu	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -
414	H	pBr-Ph	H	Me	Cl	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
415	H	pI-Ph	H	H	I	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -
416	H	iProp	H	H	H	iBu	OMe	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
417	H	iBu	H	CN	H	CF ₃	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -
418	H	CN	H	H	CN	H	OMe	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
419	H	COOEt	H	H	H	iBu	F	CH ₂	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
420	H	OPh	H	H	CN	iBu	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₃ -
421	Me	Br	H	Me	H	iProp	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -
422	CN	I	H	OMe	H	iProp	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(=CH ₂)-CH ₂
423	Me	Ph	H	CN	iBu	H	CH ₂	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -

A7

B7

五、發明說明 (66)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

424	F	p(iProp)-Ph	H	OMe	Me	tBut	H	CH ₂ ⁴	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
425	Me	pAcetyl-Ph	H	H	CN	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂
426	H	pBr-Ph	Me	Me	H	tBut	H	CH ₂ ⁴	CH ₂ -CH=C	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂
427	H	pI-Ph	F	H	Cl	CF ₃	Me	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄
428	H	iProp	Me	OMe	CN	tBut	Me	CH ₂ ⁴	CH ₂ -CH ₂	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂
429	H	tBut	CN	Me	iProp	Me	CH ₂ ⁴	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH ₂	-(CH ₂) ₄

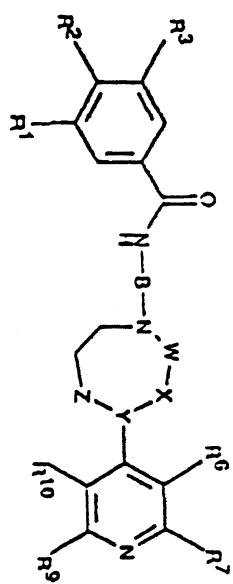
A7

B7

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (67)

表 17



實例編號	R1	R2	R3	R6	R7	R9	-	R10	W	X-Y-Z	B
430	H	Br	H	H	iBut	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -	
431	H	I	H	H	iBut	Ph	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -	
432	H	Ph	H	H	iBut	1-Pyrrolyl	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)-CH ₂ -	
433	H	p(iProp)-Ph	H	H	nPropyl	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH ₂ C	-CH ₂ -C(Cl ₃)-CH ₂ -CH ₂	
434	H	pAcetyl-Ph	H	H	CF ₃	iBut	H	CH ₂	CH ₂	-(CH ₂) ₄ -	
435	H	pBr-Ph	H	H	2-Naph	iBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C(CH ₂)-CH ₂	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -CH ₂	
436	H	pI-Ph	H	OMe	iBut	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH=C	-(CH ₂) ₄ -	
437	H	iProp	H	OMe	iProp	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -	
438	H	iBut	H	OMe	H	CF ₃	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ NCH ₂	-(CH ₂) ₄ -	
439	H	CN	H	H	iBut	H	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
440	H	COOEt	H	H	iProp	H	Me	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ -C(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂	
441	H	OPh	H	CN	iBut	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ N-CH ₂	-(CH ₂) ₃ -	
442	Me	Br	H	H	CF ₃	Me	CH ₂	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -	
443	CN	I	H	H	nProp	iBut	H	CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
444	Me	Ph	OMe	iBut	iProp	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-(CH ₂) ₄ -	

A7

B7

五、發明說明 (68)

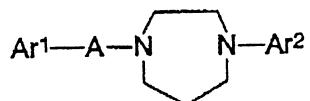
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

445	F	p(Prop)-Ph	H	OMe	CF ₃	tBut	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ Cl-
446	Me	pAcetyl-Ph	H	Me	tBut	nProp	H	CH ₂	CH ₂ -CH=	-CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -
447	H	pBr-Ph	Me	Me	tBut	H	H	CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -N-CH ₂	-CH ₂ -C(-CH ₂)-CH ₂ -
448	;	pLPh	F	H	tBut	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -C-CH ₂	-CH ₂ Cl-
449	H	iProp	Me	Me	CF ₃	tBut	H	CH ₂	CH ₂ -CH-C	-CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -

五、發明說明 (69)

The following compounds were obtained by the above-described processes:

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)



Ex. No.	Ar^1	A	Ar^2	Mp. [°C]
450		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}=\text{CH}_2-$		80-90 (草酸鹽)
451		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		110-113
452		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		106-108
453		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}=\text{CH}-\text{CH}_2-$		129-131
454		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		227-231 (氫氯化物)
455		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		165-166 (氫氯化物)
456		$-(\text{CH}_2)_5-$		115-118 (草酸鹽)
457		$-(\text{CH}_2)_4-$		94-97 (氫氯化物)

五、發明說明 (70)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
458		$-(CH_2)_4-$		123-126 (反丁烯二酸鹽)
459		$-(CH_2)_3-\overset{CH_3}{\underset{ }{\text{CH}}}-$		130-133 (反丁烯二酸鹽)
460		$\sim CH_2 \sim CH_2 \backslash$		118-125 (反丁烯二酸鹽)
461		$-(CH_2)_2-\overset{CH_3}{\underset{ }{\text{CH}}}-(CH_2)_2-$		130-132 (草酸鹽)
462		$-(CH_2)_6-$		144-150 (反丁烯二酸鹽)
463		$-(CH_2)_4-$		148-154 (草酸鹽)
464		$-CH_2-\overset{CH_3}{\underset{ }{\text{CH}}}-(CH_2)_2-$		171-176 (反丁烯二酸鹽)
465		$-(CH_2)_4-$		122-124 (反丁烯二酸鹽)
466		$-(CH_2)_4-$		108-112 (草酸鹽)

五、發明說明 (71)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
467		$-(CH_2)_4-$		140-142 (草酸鹽)
468		$-(CH_2)_4-$		149-152 (反丁烯二酸鹽)
469		$-(CH_2)_4-$		147-149 (氫氯化物)
470		$-(CH_2)_4-$		235-236 (反丁烯二酸鹽)
471		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{\parallel}{C}}-CH_2-$		92-98
472		$-S-CH_2-\overset{CH_3}{\underset{\parallel}{C}}-CH_2-$		87-90
473		$-(CH_2)_4-$		112-115 (反丁烯二酸鹽)
474		$-(CH_2)_6-$		101-105 (草酸鹽)
475		$-(CH_2)_4-$		127-129 (草酸鹽)

五、發明說明 (72)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar^1	A	Ar^2	Mp. [°C]
476		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		
477		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		
478		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		126 - 128 (反丁烯二酸鹽)
479		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		150 - 156 (反丁烯二酸鹽)
480		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		158 - 165 (反丁烯二酸鹽)
481		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		
482		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		184 - 188 (草酸鹽)
483		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		185 - 187 (草酸鹽)
484		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		

 Ph = 芳基

五、發明說明 (73)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
485		$-S-CH_2-C(=O)-CH_2-$		127
486		$-S-CH_2-C(=O)-CH_2-$		128
487		$-S-(CH_2)_3-$		123
488		$-S-(CH_2)_3-$		120
489		$-S-(CH_2)_3-$		187-191 (草酸鹽)
490		$-S-(CH_2)_3-$		187-191 (草酸鹽)
491		$-S-(CH_2)_3-$		
492		$-S-(CH_2)_3-$		
493		$-S-(CH_2)_2-$		

五、發明說明 (74)

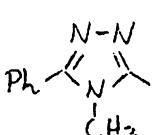
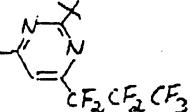
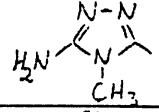
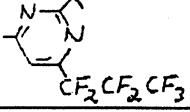
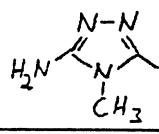
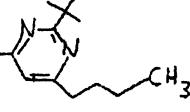
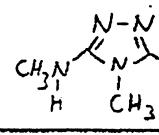
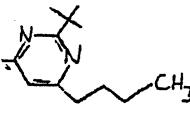
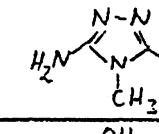
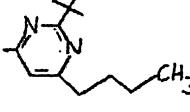
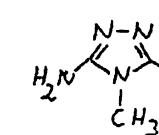
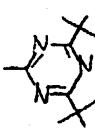
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
494		-S-(CH ₂) ₃ -		93-94 (草酸鹽)
495		-S-(CH ₂) ₃ -		
496		-S-(CH ₂) ₃ -		168-170 (反丁烯二酸鹽)
497		-S-(CH ₂) ₃ -		
498		-S-(CH ₂) ₃ -		
499		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		
500		-S-(CH ₂) ₃ -		
501		-S-(CH ₂) ₃ -		
502		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		

五、發明說明 (75)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
503		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{ }{C}}-CH_2-$		
504		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{ }{C}}-CH_2-$		
505		$-S-(CH_2)_2-$		
506		$-S-(CH_2)_3-$		
507		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{ }{C}}-CH_2-$		
508		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{ }{C}}-CH_2-$		
509		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{ }{C}}-CH_2-$		
510		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{ }{C}}-CH_2-$		
511		$-S-(CH_2)_3-$		

五、發明說明 (76)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
512		-S-(CH ₂) ₃ -		
513		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		
514		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		
515		-S-(CH ₂) ₃ -		
516		-S-(CH ₂) ₃ -		81-85
517		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		
518		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		
519		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		
520		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		75-80

五、發明說明 (77)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
521		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{\parallel}{C}}-CH_2-$		110-112 氫氯化物
522		$-S-(CH_2)_3-$		78-80
523		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{\parallel}{C}}-CH_2-$		95-97 氫氯化物
524		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{\parallel}{C}}-CH_2-$		142-145
525		$-S-CH_2-\overset{CH_2}{\underset{\parallel}{C}}-CH_2-$		80-91

五、發明說明 (78)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
526		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		草酸鹽
527		$-\text{S}-(\text{CH}_2)_8-$		氫氯化物
528		$-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$		草酸鹽
529		$-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$		氫氯化物
530		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		草酸鹽
531		$-\text{SCH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		
532		$-\text{SCH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		
533		$-\text{SCH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		
534		$-\text{SCH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		95-96

五、發明說明 (79)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
535		-S-(CH ₂) ₃ -		92
536		-S-(CH ₃) ₃ -		90
537		-SCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ -		97
538		-S-(CH ₂) ₃ -		98-100
539		-SCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ -		
540		-SCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ -		
541		-S-(CH ₂) ₃ -		66-72
542		-S-(CH ₂) ₃ -		
543		-S-(CH ₂) ₃ -		

五、發明說明 (80)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
544		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
545		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
546		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
547		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
548		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
549		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
550		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
551		-S(CH ₂) ₃ ⁻		
552		-SCH ₂ C(CH ₃)CH ₂ ⁻		

五、發明說明 (81)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
553		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}\text{CH}_2-$		
554		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}\text{CH}_2-$		
555		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}\text{CH}_2-$		
556		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}\text{CH}_2-$		
557		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}\text{CH}_2-$		
558		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_2}{\underset{\parallel}{\text{C}}}\text{CH}_2-$		100-103
559		$-\text{S}(\text{CH}_2)_3-$		
560		$-\text{S}(\text{CH}_2)_3-$		109-112
561		$-\text{S}(\text{CH}_2)_3-$		

五、發明說明 (82)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
562		-S(CH ₂) ₃		
563		-S(CH ₂) ₃ -		
564		-S(CH ₂) ₃ -		
565		-SCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ -		84-85
566		-SCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ -		
567		-SCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ -		
568		-S(CH ₂) ₃ -		
569		-S(CH ₂) ₃ -		
570		-S(CH ₂) ₃ -		

五、發明說明 (83)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
571		-S(CH ₂) ₃ -		
572		-S(CH ₂) ₃ -		
573		-S(CH ₂) ₃ -		185-190
574		-SCH ₂ C(CH ₂)=CH-		145-148
575		-SCH ₂ C(CH ₂)=CH-		120-122
576		-SCH ₂ C(CH ₂)=CH-		70-80 (草酸鹽)
577		-SCH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ -		155-160 (氫氯化物)
578		-S(CH ₂) ₃ -		97-98 (氫氯化物)
579		-SCH ₂ C(CH ₂)=CH-		141-143 (反丁烯二酸鹽)

五、發明說明 (84)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
580		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_2}{\text{CH}}}\text{CH}_2-$		105-108 (氫氯化物)
581		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_2}{\text{CH}}}\text{CH}_2-$		139-143 (氫氯化物)
582		$-\text{SCH}_2\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_2}{\text{CH}}}\text{CH}_2-$		89-95
583		$-\text{S}(\text{CH}_2)_3-$		160-165 (草酸鹽)
584		$-(\text{CH}_2)_4-$		62-64
585		$-(\text{CH}_2)_4-$		148-149
586		$-(\text{CH}_2)_4-$		38-41
587		$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$		油
588		$-\text{S}(\text{CH}_2)_3-$		90 (decoup) (氫氯化物)

五、發明說明 (85)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
589		-S-(CH ₂) ₃ -		90-93 (反丁烯二酸鹽)
590		-S-(CH ₂) ₃ -		75-78 (反丁烯二酸鹽)
591		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		油
592		-S-(CH ₂) ₃ -		130-133 (氫氯化物)
593		-S-(CH ₂) ₃ -		油
594		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		126-130 (氫氯化物)
595		-S-(CH ₂) ₃ -		90-95(dec.) (氫氯化物)
596		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		油
597		-S-(CH ₂) ₃ -		油

五、發明說明 (86)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar^1	A	Ar^2	Mp. [°C]
598		$-S-(\text{CH}_2)_3-$		106 (氫氯化物)
599		$-S-(\text{CH}_2)_3-$		148 (氫氯化物)
600		$-S-(\text{CH}_2)_3-$		137-139 (氫氯化物)
601		$-S-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{CH}_2}{\text{C}}}(\text{CH}_2)-$		109-115 (氫氯化物)
602		$-S-(\text{CH}_2)_3-$		90 (dec.) (氫氯化物)
603		$-S-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{CH}_2}{\text{C}}}(\text{CH}_2)-$		132 (dec.) (氫氯化物)
604		$-S-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{CH}_2}{\text{C}}}(\text{CH}_2)-$		103-105 (氫氯化物)
605		$-S-(\text{CH}_2)_3-$		142-144
606		$-S-(\text{CH}_2)_3-$		油

五、發明說明 (87)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
607		-S-(CH ₂) ₃ -		油
608		-S-(CH ₂) ₃ -		120-123 (氫氯化物)
609		-S-(CH ₂) ₃ -		187-189 (反丁烯二酸鹽)
610		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		95-98 (反丁烯二酸鹽)
611		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		68-72 (反丁烯二酸鹽)
612		-S-(CH ₂) ₃ -		240 (氫氯化物)
613		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		190 (氫氯化物)
614		-S-(CH ₂) ₃ -		243 (氫氯化物)
615		-S-(CH ₂) ₃ -		101-104

五、發明說明 (88)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar^1	A	Ar^2	Mp. [°C]
616		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		油
617		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{''}}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		90-94 (dec) (氫氯化物)
618		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{''}}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		152 (氫氯化物)
619		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		油
620		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		油
621		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{''}}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$		152 (氫氯化物)
622		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		110 (氫氯化物)
623		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		126-131 (氫氯化物)
624		$-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_3-$		91 (氫氯化物)

五、發明說明 (89)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
625		-S-(CH ₂) ₃ -		116-120 (氫氯化物)
626		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		103 (氫氯化物)
627		-S-(CH ₂) ₃ -		150 (氫氯化物)
628		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		140 (氫氯化物)
629		-S-(CH ₂) ₃ -		130 (氫氯化物)
630		-S-(CH ₂) ₃ -		98-104 (氫氯化物)
631		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		65-68 (氫氯化物)
632		-S-(CH ₂) ₃ -		131-136 (氫氯化物)
633		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		105 (氫氯化物)

五、發明說明 (90)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar^1	A	Ar^2	Mp. [°C]
634		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}(\text{H})-\text{CH}_2-$		132 (氫氯化物)
635		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}(\text{H})-\text{CH}_2-$		92 (氫氯化物)
636		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}(\text{H})-\text{CH}_2-$		95 (氫氯化物)
637		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}(\text{H})-\text{CH}_2-$		102 (氫氯化物)
638		$-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$		214-216 (氫氯化物)
639		$-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$		160-162 (氫氯化物)
640		$-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$		73-75 (反丁烯二酸鹽)
641		$-\text{S}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_2}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}(\text{H})-\text{CH}_2-$		178
642		$-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$		155

五、發明說明 (91)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
643		-S-(CH ₂) ₃ -		125-128 (氫氧化物)
644		-S-(CH ₂) ₃ -		102 (氫氧化物)
645		-S-(CH ₂) ₃ -		88 (氫氧化物)
646		-S-(CH ₂) ₃ -		132 (氫氧化物)
647		-S-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂ -		190 (氫氧化物)
648		-S-(CH ₂) ₃ -		134-138 (氫氧化物)
649		-S-(CH ₂) ₂ -		170-174 (氫氧化物)
650		-S-(CH ₂) ₃ -		115 (氫氧化物)
651		-S-(CH ₂) ₃ -		117 (氫氧化物)

五、發明說明 (92)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

Ex. No.	Ar ¹	A	Ar ²	Mp. [°C]
652		$-S-CH_2-C(=O)-CH_2-$		151-155
653		$-S-CH_2-C(=O)-CH_2-$		158-161 (氫氯化物)
654		$-S-(CH_2)_3-$		184-185 (氫氯化物)
655		$-S-CH_2-C(=O)-CH_2-$		194-195 (氫氯化物)
656		$-S-CH_2-C(=O)-CH_2-$		114 (氫氯化物)

五、發明說明 (93)

上述未以熔點為特徵之化合物具如下之NMR光譜(d_6 -DMSO)：

實例編號

476

1,8-2,1 (m, 4H); 2,6-2,7 (m, 4H); 2,8 (t, 2H); 3,2 (t, 2H); 3,5-3,7 (b, 2H); 3,7-3,9 (b, 2H); 4,5 (d, 2H); 5,1 (t, 1H); 5,2 (s, 1H); 6,1 (d, 1H); 6,2 (m, 2H); 7,3 (m, 5H); 7,7 (m, 2H); 7,8 (d, 1H)

477

1,8-1,9 (m, 4H); 2,5-2,6 (m, 4H); 2,7 (t, 2H); 3,0 (t, 2H); 3,3 (s, 3H); 3,5-3,8 (b, 4H); 4,2 (s, 2H); 4,5 (d, 2H); 5,1 (t, 1H); 5,2 (s, 1H); 6,2 (m, 2H); 7,3-7,4 (m, 5H); 7,7 (m, 2H)

481 草酸鹽

2,1 (b, 4H); 3,2-3,4 (m, 8H); 3,6 (s, 3H); 3,7 (b, 2H); 6,6-6,8 (m, 3H); 7,2 (t, 1H); 7,6 (m, 3H); 7,7 (m, 2H)

484 草酸鹽

2,0 (b, 2H); 2,8-3,0 (b, 4H); 3,4-3,5 (m, 4H); 3,6-3,7 (b, 2H); 3,9 (s, 2H); 5,3 (d, 2H); 6,1 (d, 1H); 6,5-6,8 (m, 3H); 7,21 (t, 1H); 7,9 (d, 1H);

491 草酸鹽

2,0-2,3 (b, 4H); 3,0-3,4 (b, 8H); 3,6 (s, 3H); 3,9 (b, 2H); 4,1 (b, 2H); 7,1-7,3 (b, 1H); 7,5 (m, 3H); 7,6 (m, 2H); 8,6 (s, 1H);

492

1,7-1,9 (m, 4H); 2,6 (b, 2H); 2,8 (b, 2H); 3,1 (t, 2H); 3,6-3,9 (b, 4H); 6,1 (d, 1H); 7,0 (d, 1H); 7,8 (d, 1H); 8,5 (s, 1H);

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (94)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

493 草酸鹽 1,9-2,1 (b,4H); 2,7 (s,3H); 2,8 (t,2H); 3,0-3,3
 (b,6H); 3,3 (s,3H); 3,4 (t,2H); 3,7 (b,2H); 6,3
 (b,1H); 6,4-6,5 (m,3H); 7,0 (m,1H);

495 反丁烯二酸鹽 1,6-1,8 (b,4H); 2,6 (m,2H); 2,7 (t,2H); 3,2
 (s,3H); 3,3-3,5 (m,4H); 5,9 (s,2H); 6,2-6,5
 (m,3H); 7,0 (m,1H);

497 反丁烯二酸鹽 1,6-1,8 (m,2H); 1,8-2,0 (b,2H); 2,5-2,7 (b,4H);
 2,8-2,9 (m,4H); 3,2 (s,3H); 3,7-3,9 (m,4H); 5,9
 (b,2H); 6,5 (s,2H); 7,4 (d,1H);

498 反丁烯二酸鹽 1,3 (s,9H); 1,8-2,1 (b,4H); 2,7-3,0 (b,6H); 3,3
 (s,3H); 3,5-3,8 (b,6H); 6,1 (b,2H); 6,6 (s,2H);
 6,7 (s,1H);

499 氯化物 1,3 (s,9H); 1,9 (b,2H); 2,2 (s,2H); 2,5 (b,2H);
 2,7 (b,2H); 3,1 (s,2H); 3,4 (s,3H); 3,7 (s,2H);
 3,8 (s,3H); 3,9 (s,3H); 5,0 (d,2H); 6,5 (s,1H);
 6,9 (d,1H); 7,5 (d,1H); 7,7 (s,1H); 11,3 (b,1H);

500 反丁烯二酸鹽 1,3 (s,9H); 1,7-1,9 (b,4H); 2,5-2,7 (b,4H); 2,8-
 2,9 (b,2H); 3,1 (t,2H); 3,6-3,7 (b,2H); 3,8-4,0
 (b,2H); 6,1 (d,1H); 6,6 (s,2H); 6,9 (d,1H); 7,8
 (d,1H)

A7

B7

五、發明說明 (95)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

501 1,3 (s,9H); 1,8~2,0 (m,4H); 2,6 (m,4H); 2,8
 (b,2H); 3,1 (t,2H); 3,4 (s,3H); 3,5 (b,2H); 3,9~
 4,1 (b,2H); 4,4 (b,2H); 6,5 (s,1H)

502 反丁烯二酸鹽 1,3 (s,9H); 1,8~1,9 (b,2H); 2,5~2,6 (b,2H); 2,7
 (b,2H); 3,1 (s,2H); 3,6~3,7 (b,2H); 3,7~4,0
 (m,4H); 5,1 (s,1H); 5,2 (s,1H); 6,1 (d,1H); 6,6
 (s,2H); 6,9 (d,1H); 7,8 (d,1H)

503 反丁烯二酸鹽 1,3 (s,9H); 1,8~1,9 (b,2H); 2,5~2,6 (b,2H); 2,7~
 2,8 (b,2H); 3,2 (s,2H); 3,6 (s,3H); 3,6~3,7
 (b,2H); 3,7 (s,2H); 3,8~4,0 (b,2H); 5,0 (s,1H);
 5,1 (s,1H); 6,6 (s,2H); 6,9 (d,1H); 7,6 (m,3H);
 7,7 (m,2H)

504 反丁烯二酸鹽 1,3 (s,9H); 1,8~1,9 (b,2H); 2,5 (b,2H); 2,6~2,7
 (b,2H); 3,1 (s,2H); 3,3 (s,3H); 3,4 (s,2H); 3,5~
 3,7 (b,2H); 3,8~4,0 (b,2H); 4,9 (d,2H); 6,0
 (s,2H); 6,6 (s,2H); 6,9 (d,1H)

505 反丁烯二酸鹽 1,3 (s,9H); 1,7~1,9 (b,4H); 2,5~2,7 (b,4H); 2,8
 (t,2H); 3,1 (t,2H); 3,4~4,0 (b,4H); 6,1 (d,1H);
 6,5 (d,1H); 6,6 (s,2H); 7,8 (d,1H); 8,2 (d,1H)

506 1,4 (s,9H); 1,8 (m,2H); 2,1~2,2 (b,2H); 2,6
 (m,4H); 2,7 (t,2H); 3,0 (t,2H); 3,4 (s,3H); 3,5~
 4,0 (b,4H); 4,6 (b,2H); 6,2 (d,1H); 8,2 (d,1H)

五、發明說明 (96)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

507 0,9 (t,3H); 1,3 (s,9H); 1,4 (m,2H); 1,7 (m,2H);
 2,1 (b,2H); 2,6 (t,2H); 2,7 (t,2H); 2,8 (t,2H);
 3,3 (s,2H); 3,6-3,7 (b,2H); 3,8 (s,2H); 3,9-4,0
 (b,2H); 5,1 (s,1H); 5,2 (s,1H); 6,1 (s,1H); 6,2
 (d,1H); 7,8 (d,1H)

508 0,9 (t,3H); 1,3 (s,9H); 1,4 (m,2H); 1,7 (m,2H);
 1,9 (m,2H); 2,6 (m,4H); 2,7 (t,2H); 3,1 (d,3H);
 3,2 (s,2H); 3,3 (s,3H); 3,6 (m,1H); 3,7 (s,2H);
 3,6-3,8 (b,4H); 5,0 (d,2H); 6,0 (s,1H)

509 二氯氯化物 0,9 (t,3H); 1,3 (m,2H); 1,4 (s,9H); 1,7 (m,2H);
 2,4-2,5 (b,2H); 2,9 (t,2H); 3,2-3,4 (b,4H); 3,5
 (s,3H); 3,7-3,8 (b,2H); 3,9 (s,2H); 3,9-4,2
 (b,2H); 4,1 (s,2H); 5,4 (s,2H); 6,9 (s,1H); 8,5
 (s,2H); 11,7 (b,1H); 14,0 (b,1H)

510 1,3 (s,9H); 2,0-2,1 (b,2H); 2,7 (t,2H); 2,8
 (t,2H); 3,3 (s,2H); 3,5-3,8 (b,2H); 3,8 (s,2H);
 3,8-4,1 (b,2H); 5,1 (s,1H); 5,2 (s,1H); 6,2
 (m,2H); 7,8 (d,1H); 8,2 (d,1H)

511 1,3 (s,18H); 1,6-1,9 (b,4H); 2,4 (b,2H); 2,7
 (b,2H); 2,8 (t,2H); 3,2 (s,3H); 3,7 (m,4H); 5,8
 (s,1H);

512 1,3 (s,18H); 1,7-1,8 (m,4H); 2,5 (b,2H); 2,7
 (b,2H); 3,0 (t,2H); 3,7-3,8 (m,4H); 6,0 (d,1H);
 7,8 (d,1H);

513 1,6-2,1 (m,17H); 2,7 (s,2H); 3,1 (s,2H); 3,3-3,6
 (b,6H); 3,4 (s,3H); 3,8-3,9 (b,2H); 4,8 (b,2H);
 6,0 (b,2H); 6,8 (s,1H);

五、發明說明 (97)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

糸

- 514 1,6-2,0 (m,17H); 2,5 (s,2H); 2,6 (s,2H); 3,0
 (s,2H); 3,5-3,9 (b,6H); 5,0 (d,2H); 6,0 (d,1H);
 6,8 (d,1H); 7,8 (d,1H);
- 515 1,7-2,0 (m,19H); 2,5 (b,2H); 2,7 (s,2H); 3,0
 (t,2H); 3,5-3,8 (b,4H); 6,0 (d,1H); 6,8 (d,1H);
 7,8 (d,1H);
- 517 二氫氯化物 1,4 (s,9H); 2,4-2,5 (b,2H); 3,3-3,6 (b,4H); 3,5
 (s,3H); 3,7-3,8 (b,2H); 3,8-3,9 (b,2H); 3,9-4,2
 (b,4H); 5,4 (s,2H); 7,1 (d,1H); 8,3 (d,1H); 8,5
 (s,2H); 11,7 (b,1H); 14,5 (b,1H)
- 518 1,3 (s,9H); 1,8-2,0 (b,2H); 2,6 (t,2H); 2,7
 (t,2H); 3,0 (d,3H); 3,2 (s,2H); 3,3 (s,3H); 3,6
 (s,2H); 3,6-3,9 (b,5H); 5,0 (d,2H); 6,2 (s,1H);
 6,3 (m,2H); 7,8 (m,2H)
- 519 1,4 (s,9H); 1,9 (m,2H); 2,6 (t,2H); 2,7 (t,2H);
 3,0 (d,3H); 3,2 (s,2H); 3,3 (s,3H); 3,7 (s,2H);
 3,6-3,9 (b,5H); 5,0 (d,2H); 6,1 (s,1H); 6,3
 (m,2H); 7,6 (m,2H)
- 527 氯化物 1,2-1,5 (b,10H); 1,5-1,8 (b,4H); 3,1 (m,4H); 3,5
 (m,4H); 3,8-4,0 (b,4H); 6,8 (t,1H); 6,9 (b,3H);
 7,1 (t,1H); 10,5 (b,1H);
- 526 草酸鹽 1,3 (s,9H); 1,9-2,1 (b,2H); 2,7-3,0 (b,4H); 3,4
 (b,2H); 3,6 (s,3H); 3,6-3,8 (b,2H); 3,6 (s,2H);
 3,9-4,1 (b,2H); 5,2 (d,2H); 6,2 (m,2H); 6,4
 (s,1H); 7,6 (m,3H); 7,7 (m,4H)

五、發明說明 (98)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

- 528 草酸鹽 0,9 (t,3H); 1,3 (s,9H); 1,4 (m,2H); 1,6 (m,2H);
1,9-2,2 (b,4H); 2,5 (m,2H); 3,0-3,2 (b,4H); 3,2-
3,4 (b,4H); 3,5-3,7 (b,2H); 3,9-4,1 (b,2H); 6,1
(d,1H); 6,4 (s,1H); 7,8 (d,1H)
- 529 二氯化物 0,9 (t,3H); 1,3 (m,2H); 1,4 (s,9H); 1,7 (m,2H);
2,2 (b,3H); 3,0 (t,2H); 3,2 (b,5H); 3,5 (s,3H);
3,5-4,2 (b,7H); 4,5-4,7 (b,1H); 7,0 (d,1H); 8,6
(s,2H); 11,7 (b,1H); 14,2 (b,1H)
- 530 草酸鹽 1,3 (s,9H); 1,9-2,1 (b,2H); 2,7-3,0 (b,4H); 2,3-
2,4 (b,2H); 2,6-4,1 (b,4H); 3,9 (s,2H); 5,2
(s,1H); 5,3 (s,1H); 6,1 (d,1H); 6,2 (m,2H); 6,4
(s,1H); 7,7 (m,2H); 7,8 (d,1H)
- 531 1,3 (s,9H); 1,9 (m,2H); 2,6 (t,2H); 2,7 (t,2H);
3,2 (s,2H); 3,3 (s,3H); 3,7 (s,2H); 3,6-3,9
(b,4H); 4,3 (s,2H); 5,0 (d,2H); 6,2 (s,1H); 6,3
(m,2H); 7,8 (m,2H)
- 533 1,3 (s,9H); 2,1 (m,2H); 2,7 (m,2H); 2,9 (m,2H);
3,3 (s,2H); 3,6-3,8 (b,2H); 3,8 (s,2H); 3,9-4,1
(b,2H); 5,1 (s,1H); 5,2 (s,1H); 6,1 (s,1H); 6,2
(d,1H); 6,3 (m,2H); 7,5 (m,2H); 7,8 (d,1H)
- 532 1,3 (s,9H); 1,9 (m,2H); 2,6 (t,2H); 2,7 (t,2H);
3,2 (s,2H); 3,3 (s,3H); 3,7 (s,2H); 3,6-3,6
(b,4H); 4,3 (s,2H); 5,0 (s,2H); 6,1 (s,1H); 6,3
(m,2H); 7,6 (m,2H)

五、發明說明 (99)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

- 539 氯氣化物 2,2-2,3 (b,2H); 3,0-3,2 (b,2H); 3,5-4,0 (b,8H),
4,2 (s,2H); 5,5 (d,2H); 6,2 (d,1H); 6,9-7,0
(m,3H); 7,0 (t,1H); 7,4 (m,1H); 7,9 (d,1H); 10,9
(b,1H);
- 540 氯氣化物 2,4 (b,2H); 3,2 (b,4H); 3,4 (s,3H); 3,5 (m,2H);
3,7 (b,4H); 4,0 (s,2H); 5,3 (d,2H); 6,8-7,1
(m,4H); 7,2-7,4 (m,3H);
- 542 1,3 (s,9H); 1,9 (m,2H); 1,9-2,1 (b,2H); 2,6
(m,4H); 2,8 (b,2H); 3,2 (t,2H); 3,5-3,7 (b,2H);
3,9-4,2 (b,2H); 6,2 (d,1H); 6,5 (s,1H); 6,8
(d,1H)
- 543 1,3 (s,9H); 1,9 (m,2H); 1,9-2,0 (b,2H); 2,6-2,7
(b,4H); 2,8 (b,2H); 3,1 (t,2H); 3,2 (s,3H); 3,5-
3,6 (b,2H); 3,9-4,1 (b,2H); 6,5 (s,1H); 10,8
(b,1H)
- 544 1,3 (s,9H); 1,8-2,0 (b,4H); 2,6 (m,4H); 2,7-2,8
(b,2H); 3,0 (m,5H); 3,3 (s,3H); 3,5-3,6 (b,2H);
3,9-4,1 (b,3H); 6,5 (s,1H)
- 545 氯氣化物 1,3 (s,9H); 2,1-2,2 (b,3H); 2,5-2,6 (b,1H); 3,1-
3,3 (b,6H); 3,4 (s,3H); 3,4-3,8 (b,4H); 4,0-4,1
(b,1H); 4,6-4,7 (b,1H); 7,0 (s,1H); 8,6 (s,2H);
11,3 (b,1H)
- 546 1,3 (s,9H); 1,9 (m,2H); 2,1 (m,2H); 2,7 (m,4H);
2,9 (m,2H); 3,2 (t,2H); 3,8-3,9 (b,2H); 3,9-4,0
(b,2H); 6,2 (d,2H); 6,3 (m,2H); 7,8 (m,3H)

五、發明說明 (100)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

547 1,3 (s,9H); 1,9 (m,4H); 2,6 (m,4H); 2,8 (t,2H);
 3,1 (t,2H); 3,2 (s,3H); 3,6-4,0 (b,4H); 6,2
 (s,1H); 6,3 (m,2H); 7,8 (m,2H); 9,2 (s,1H)

548 1,3 (s,9H); 1,9 (m,4H); 2,6 (t,4H); 2,8 (t,2H);
 3,1 (t,2H); 3,3 (s,3H); 3,5-3,9 (b,4H); 4,1
 (s,2H); 6,2 (s,1H); 6,3 (m,2H); 7,8 (m,2H)

549 1,4 (s,9H); 1,9 (m,2H); 2,0-2,1 (b,2H); 2,7
 (m,4H); 2,9 (m,2H); 3,2 (t,2H); 3,6-3,8 (b,2H);
 3,8-4,1 (b,2H); 6,1 (s,1H); 6,2 (d,1H); 6,3
 (m,2H); 7,6 (m,2H), 7,8 (d,1H)

550 1,4 (s,9H); 1,9 (m,4H); 2,6 (m,4H); 2,8 (b,2H);
 3,1 (t,2H); 3,2 (s,3H); 3,6-4,0 (b,4H); 6,1
 (s,1H); 6,3 (m,2H); 7,5 (m,2H); 10,0 (b,1H)

551 1,4 (s,9H); 1,9 (m,4H); 2,6 (m,4H); 2,8 (b,2H);
 3,1 (t,2H); 3,4 (s,3H); 3,5-4,0 (b,4H); 4,3
 (s,2H); 6,1 (s,1H); 6,3 (m,2H); 7,5 (m,2H)

五、發明說明 (101)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

糾

- 552 1,3 (s,9H); 2,1 (m,2H); 2,8 (m,2H); 2,9 (m,2H);
 3,3 (s,2H); 3,8 (s,2H); 3,9 (t,2H); 4,1 (b,2H);
 5,1 (s,1H); 5,2 (s,1H); 6,2 (d,1H); 6,5 (d,1H);
 7,8 (d,1H); 8,2 (d,1H)
- 553 氯氣化物 1,3 (s,9H); 2,2-2,3 (b,1H); 2,5-2,7 (b,1H); 3,1
 (s,3H); 3,0-3,2 (b,2H); 3,5-3,7 (b,3H); 3,8-4,1
 (m,6H); 4,4-4,5 (b,1H); 5,4 (d,2H); 6,8 (d,1H);
 8,3 (d,1H); 11,2 (b,1H); 11,9 (s,1H)
- 554 1,3 (s,9H); 1,9 (m,2H); 2,6 (t,2H); 2,7 (t,2H);
 3,2 (s,2H); 3,4 (s,3H); 3,7 (s,2H); 3,8 (m,4H);
 4,4 (s,2H); 5,0 (s,2H); 6,5 (d,1H); 8,2 (d,1H)
- 555 1,3 (s,18H); 2,1 (m,2H); 2,8 (t,2H); 3,0 (t,2H);
 3,3 (s,2H); 3,8 (s,2H); 3,9 (t,2H); 4,1 (t,2H);
 5,1 (s,1H); 5,2 (s,1H); 6,2 (d,1H); 6,5 (s,1H);
 7,8 (d,1H)
- 556 1,3 (s,18H); 1,9 (m,2H); 2,6 (t,2H); 2,7 (t,2H);
 3,2 (s,2H); 3,4 (s,3H); 3,6 (s,2H); 3,9 (m,4H);
 4,2 (s,2H); 5,0 (s,2H); 6,5 (s,1H)
- 557 氯氣化物 1,3 (d,6H); 2,2 (b,1H); 2,6 (b,1H); 3,0 (b,4H);
 3,4 (s,3H); 3,5-3,7 (b,4H); 3,8 (s,2H); 4,1
 (s,2H); 5,4 (s,2H); 6,8 (t,1H); 6,9 (s,1H); 8,5
 (b,2H); 11,6 (b,1H);

五、發明說明 (102)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

559 氢氯化物 1,2 (d,6H); 2,1 (b,4H); 3,0-3,2 (b,8H); 3,5-4,2 (b,4H); 6,1 (d,1H); 6,8 (t,1H); 6,9 (b,1H); 7,8 (d,1H); 11,3 (b,1H);

561 1,3 (s,18H); 1,9 (m,2H); 2,0 (m,2H); 2,7 (t,2H); 2,8 (t,2H); 3,0 (t,2H); 3,2 (t,2H); 3,9 (t,2H); 4,0 (t,2H); 6,1 (d,1H); 6,5 (s,1H); 7,8 (d,1H)

562 1,3 (s,18H); 1,9 (m,4H); 2,6 (m,4H); 2,8 (t,2H); 3,0 (t,2H); 3,4 (s,3H); 3,8 (t,2H); 3,9 (t,2H); 4,3 (s,2H); 6,5 (s,1H)

564 草酸鹽 1,3 (s,9H); 2,0 (b,2H); 2,2 (b,2H); 3,1-3,4 (b,8H); 3,3 (b,2H); 3,8 (s,3H); 4,0 (b,2H); 6,1 (d,2H); 6,9 (s,1H); 7,0 (d,1H); 7,8 (d,1H); 8,1 (d,1H);

563 草酸鹽 1,3 (s,9H); 1,9 (b,2H); 2,2 (b,2H); 2,9 (t,2H); 3,1 (t,2H); 3,3 (b,4H); 3,4 (s,3H); 3,7 (b,2H); 3,8 (s,3H); 4,0 (b,2H); 5,3 (b,2H); 6,8 (s,1H); 6,9 (d,1H); 8,0 (d,1H);

566 1,4 (s,9H); 1,9 (b,2H); 2,5 (b,2H); 2,8 (b,2H); 3,2 (s,2H); 3,3 (s,3H); 3,6 (s,2H); 3,6-3,8 (b,4H); 3,8 (s,3H); 4,8 (b,2H); 5,0 (s,2H); 6,5 (s,1H); 7,0 (d,1H); 8,0 (d,1H);

567 草酸鹽 2,0 (b,2H); 2,8 (b,2H); 3,0 (b,2H); 3,3 (s,3H); 3,4 (s,2H); 3,6 (b,4H); 3,8 (b,2H); 5,1 (s,2H); 5,5 (b,2H); 7,0 (m,2H); 7,7 (t,1H);

五、發明說明 (103)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

- 568 草酸鹽 2,0 (b,2H); 2,2 (b,2H); 3,0 (t,2H); 3,1 (m,2H);
3,2 (b,4H); 3,4 (s,3H); 3,6 (m,2H); 3,9 (b,2H);
6,7 (b,2H); 7,0 (t,2H); 7,7 (t,1H);
- 569 草酸鹽 2,0-2,2 (b,4H); 3,0-3,4 (m,8H); 3,5 (m,2H); 3,9
(b,2H); 6,1 (d,1H); 6,5 (b,2H); 7,0 (t,2H); 7,7
(t,1H); 7,8 (d,1H);
- 570 氯氣化物 1,3 (s,9H); 2,0-2,2 (b,3H); 2,3-2,4 (b,1H); 3,2
(m, 6H); 3,4-4,0 (b,5H); 4,3-4,5 (b,1H); 6,2
(d,1H); 6,8 (d,1H); 7,9 (d,1H); 8,3 (d,1H); 10,8
(b,1H)
- 571 氯氣化物 1,3 (s,9H); 2,0-2,2 (b,3H); 2,3-2,4 (b,1H); 3,1
(s,3H); 3,0-3,2 (m,6H); 3,4-4,0 (b,5H); 4,3-4,5
(b,1H); 6,8 (d,1H); 8,3 (d,1H); 10,9 (b,1H);
11,9 (s,1H)
- 572 1,3 (s,9H); 1,9-2,0 (m,4H); 2,6 (m,4H); 2,8
(t,2H); 3,0 (t,2H); 3,4 (s,3H); 3,8 (t,2H); 3,9
(b,2H); 4,6 (b,2H); 6,5 (d,1H); 8,2 (d,1H)

A5

B5

四、中文發明摘要（發明之名稱： 經取代氮-及二氮環庚烷及-環辛烷化合物
物及其用途)

本案係關於以下化學式之氮-及二氮環庚烷及-環辛烷化
合物：



其中 Ar^1 ， A ， B 及 Ar^2 具所述之意義，且具多巴胺 D_3 受納
體高親和力，因而能夠用以治療感應多巴胺 D_3 配位子之
失調。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

綠

英文發明摘要（發明之名稱： SUBSTITUTED AZA- AND DIAZACYCLOHEPTANE
AND -CYCLOOCTANE COMPOUNDS AND THEIR
USE

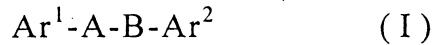
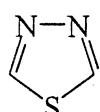
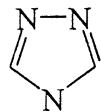
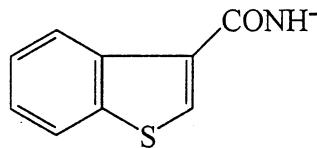
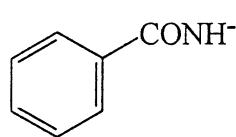
Aza- and diazacyclohexane and -cyclooctane compounds of the
following formula:



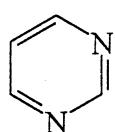
where Ar^1 , A , B and Ar^2 have the meanings stated in the
description have a high affinity for the dopamine D_3 receptor and
can therefore be used to treat disorders which respond to
dopamine D_3 ligands.

六、申請專利範圍

1. 一種化學式 I 之化合物

其中 Ar^1 為

或

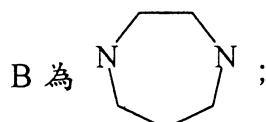


，其中 Ar^1 可以具 1 至 3 個取代基，該取代基係彼此獨立選自 OR^1 ， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基，胺基， NHR^1 ，鹵素，硝基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基， CO_2R^1 ，未經取代或經 1 至 3 個 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基， $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基，鹵素，苯基，氰基或 COR^1 之取代基取代之苯基；

R^1 為 H，未經取代或經 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基或苯基取代之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基；

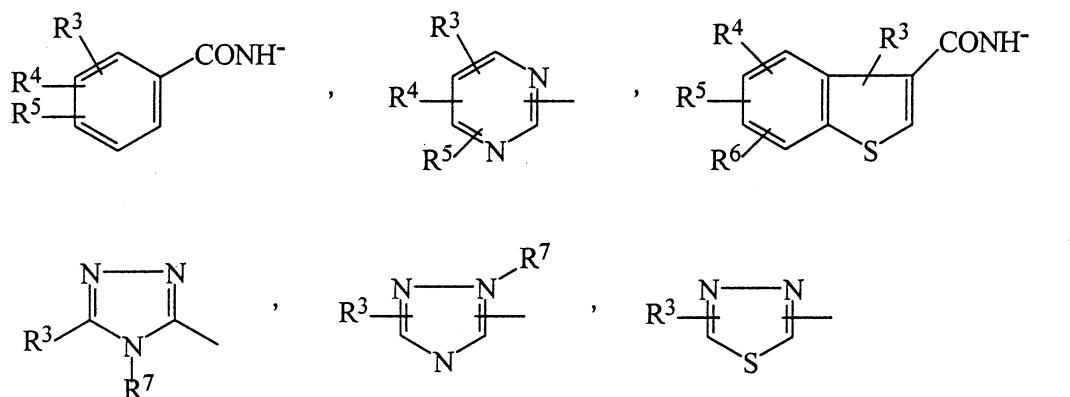
A 為 $-\text{Z}-\text{C}_3\text{-C}_6$ -烯基，尤指 $-\text{Z}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ， $-\text{Z}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ， $-\text{Z}-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ ， $-\text{Z}-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2-$ ， $-\text{Z}-\text{CH}_2\text{C}(=\text{CH}_2)\text{CH}_2-$ ， $-\text{Z}-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$ 或一直鏈 $-\text{Z}-\text{C}_7\text{-C}_{10}$ -伸烷基，其中 Z 係鍵結於 Ar^1 且為 CH_2 ，O 或 S。

六、申請專利範圍



Ar^2 為苯基，吡啶基或嘧啶基，其可以具一或二個取代基，該取代基係彼此獨立選自 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -烷基， $\text{C}_2\text{-}\text{C}_6$ -炔基，鹵素， CN ，鹵烷基，氧烷基， NO_2 ，苯基，吡咯基，咪唑基，吡唑基，噻吩基，環戊基及環己基，及其與耐生理酸之鹽類。

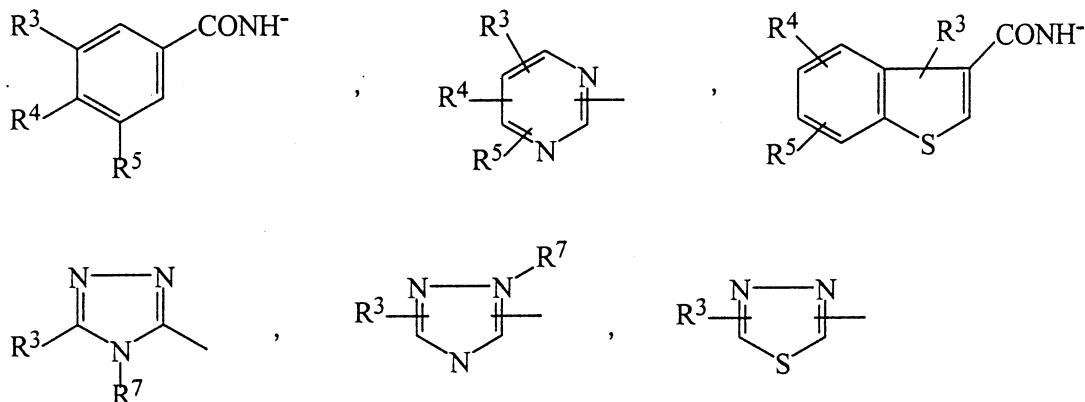
2. 根據申請專利範圍第1項之化學式1之化合物，其中 Ar^2 之取代基係彼此獨立選自 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -烷基， NO_2 與鹵烷基，尤指 CF_3 、 CHF_2 與 CF_2Cl 。
3. 根據申請專利範圍第1項之化學式1之化合物，其中 Ar^1 為



其中 R^3 至 R^6 彼此獨立為 H 或根據申請專利範圍第1項所述反應基 Ar^1 之取代基， R^7 為 H ，未經取代或經 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -烷基或苯基取代之 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4$ -烷基，或 CO_2R^1 。

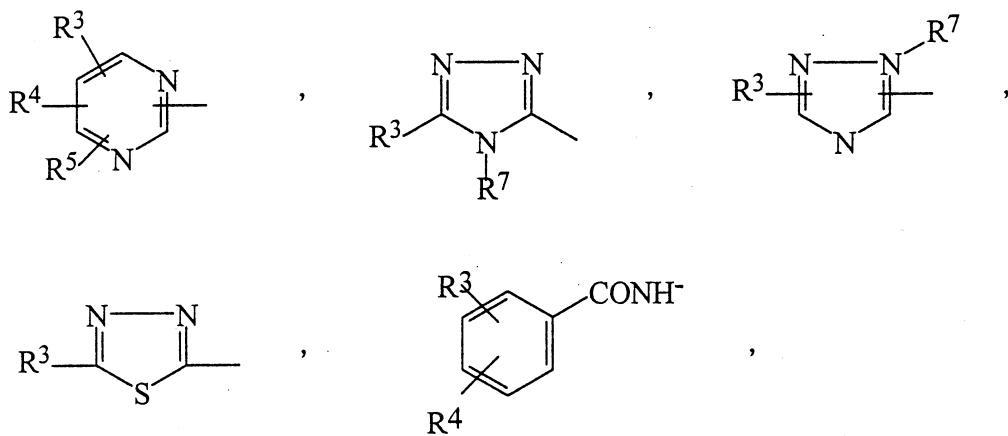
4. 根據申請專利範圍第1項之化學式I之化合物，其中 Ar^1 為

六、申請專利範圍



其中 R^3 至 R^5 及 R^7 具有根據申請專利範圍第3項所述之意義。

5. 根據申請專利範圍第4項之化學式I之化合物，其中 Ar^1 為



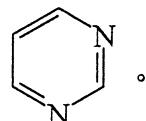
其中 R^3 至 R^5 及 R^7 具有根據申請專利範圍第3項所述之意義。

6. 根據申請專利範圍第5項之化學式I之化合物，其中 R^3 ， R^4 及 R^5 彼此獨立為 H ， OR^1 ， C_1-C_6 -烷基，鹵素，未經取代或經 C_1-C_6 -烷基或鹵素取代之苯基，或 $COOR^1$ ； R^1 為 H ， C_1-C_4 -烷基或苄基；

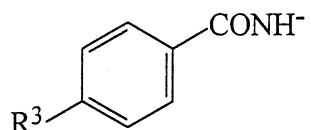
六、申請專利範圍

R^7 為H或 C_1-C_4 -烷基。

7. 根據申請專利範圍第6項之化合物，其中 R^3 至 R^6 係彼此獨立選自H， C_1-C_6 -烷基， OR^1 ，未經取代或經 C_1-C_6 -烷基或鹵素取代之苯基，及鹵素，其中 R^1 具有上述意義， R^7 為H或 C_1-C_4 -烷基。
8. 根據申請專利範圍第7項之化合物，其中 Ar^1 為未經取代或經OH， C_1-C_6 -烷氧基或氧芑基取代之



9. 根據申請專利範圍第7項之化合物，其中 Ar^1 為



其中 R^3 為H或鹵素， C_1-C_6 -烷基或苯基。

10. 一種用於治療感應多巴胺D₃配位子失調之醫藥組合物，其包括至少一種根據申請專利範圍第1至9項任一項之化合物，含或不含生理上可接受之載質及／或輔助物質。
11. 根據申請專利範圍第1至9項任一項之化合物，係用於生產治療感應多巴胺D₃受納體拮抗劑或輔劑失調之醫藥組合物。