

410227

公告本

申請日期	83. 06. 04.
案 號	83105101
類 別	COTD 791/2, A210 45/2, A61K 3/445

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

Int. Cl⁶

發明專利說明書

410227

一、發明 名稱	中 文	作為抗寄生蟲劑之14-經取代之馬可福亭(MARCFORTINES)及衍生物
	英 文	14-SUBSTITUTED MARCFORTINES AND DERIVATIVES USEFUL AS ANTIPARASITIC AGENTS
二、發明人 創作	姓 名	李比揚
	國 籍	韓國
	住、居所	美國密西根州卡拉馬祖市小石澗路5905號
三、申請人	姓 名 (名稱)	美國普強大藥廠 ✓ 羅伯·艾·亞米塔吉
	國 籍	美國
	住、居所 (事務所)	美國密西根州卡林麻梅族市漢瑞特街301號
	代 表 人 姓 名	羅伯·艾·亞米塔吉

裝

訂

線

410227

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C分類：

A6
B6

本案已向：

國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ，☐有 ☐無主張優先權
美 1993.6.16. 08/078,076

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

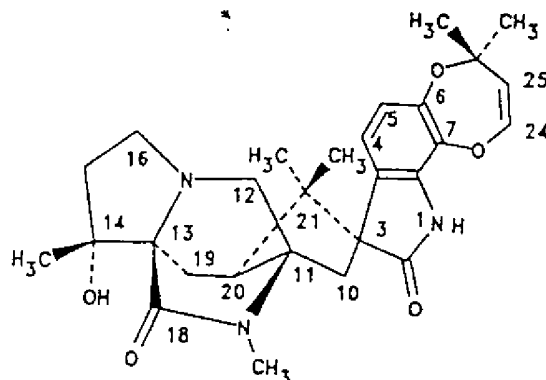
五、發明說明(1)

發明背景

馬可福亭(marcfortines)為已知的化合物，且由 Polonsky et al 揭示於 Journal of the Chemical Society Chemical Communications 1980 601-602 (Marcfortine A)及 Tetrahedron Letters 1981 22 1977-1980 (Marcfortines B 及 C)。化合物為真菌 - 婁地青霉 (Penicillium roqueforti) 之代謝物。馬可福亭結構上和已知化合物 - 帕和圭胺(paraherquamides)相似。後者由 Yamazaki 等人揭示於 Tetrahedron Letters 1981 22 135-136，及 Blanchflower 等人，Journal of Antibiotics, 1991, 44, 492-497。美國專利 4,866,060 及 4,923,867 揭示馬可福亭 A、B 及 C 之用法，及其某些衍生物，可用於治療及預防動物中之寄生蟲病變。

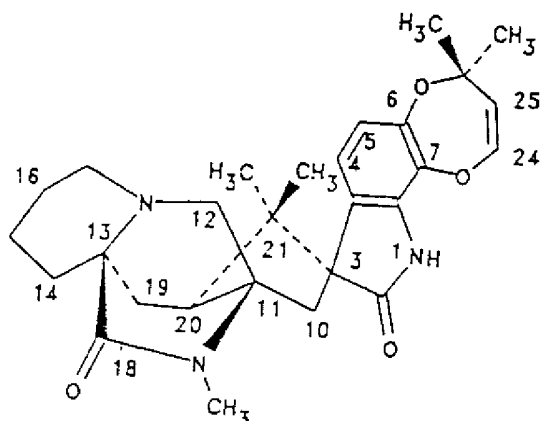
WO 92/22555 (於 1992 年 12 月 23 日發表) 大體上描述馬可福亭或帕和圭胺衍生物 (即部份式 (II) 在 14 位置上為甲基或甲基及羥基所取代)，但並未揭示如何製備此種 14-甲基-14-羥基馬可福亭化合物之方法。

帕和圭胺具有以下結構：

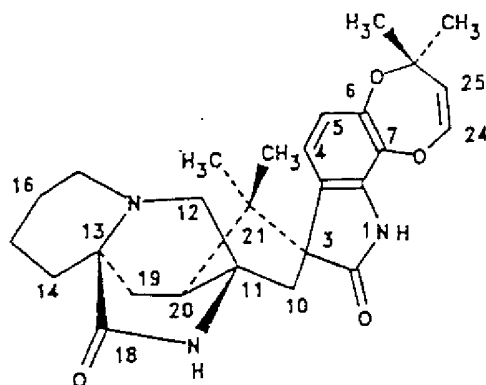


五、發明說明 (2)

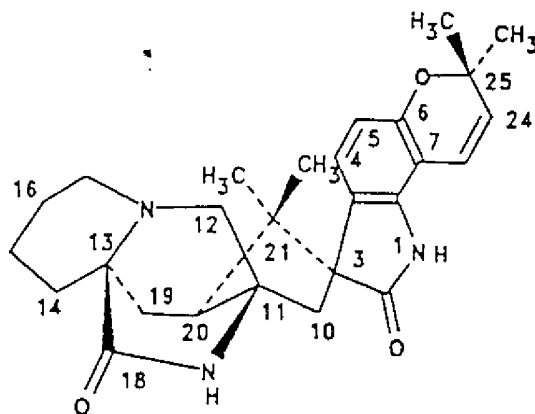
馬可福亭 A 具以下結構：



馬可福亭 B 具以下結構：

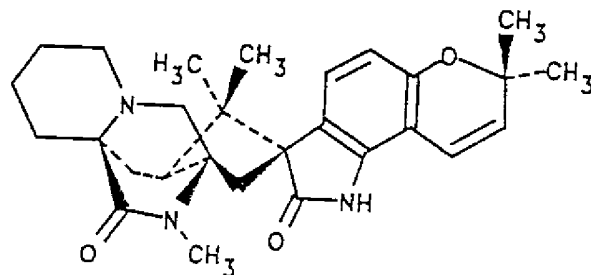


馬可福亭 C 具有以下結構：



五、發明說明(3)

馬可福亭D具有以下結構：



WO 91/09961(發表於1991年7月11日)揭示各種馬可福亭及帕和圭胺之衍生物，及其12a-N-氧化物，尤其是自青霉屬IMI 332995產製VM 29919(帕和圭胺)及VM 55596(帕和圭胺之12a-N-氧化物)。

美國專利案4,873,247揭示帕和圭胺及產製帕和圭胺之查爾斯青霉(*Penicillium charlessi*) MF 5123(ATCC 20841)。美國專利案4,978,656(以及EP 390532-A, EP-301742-A)揭示帕和圭胺的各種合成的衍生物，以及自查爾斯青霉MF 5123(ATCC 20841)產製帕和圭胺。

SmithKline Beecham於國際專利案No. WO 92/22555(於1992年12月23日發表)大體上揭示14 α -羥基-馬可福亭化合物，及使用14-羥基-14-甲基馬可福亭化合物產製抗寄生蟲藥物之方法。然而，並未描述製備14 α -羥基-馬可福亭或14-羥基-14 β -甲基-馬可福亭化合物之任何方法。

發明要點

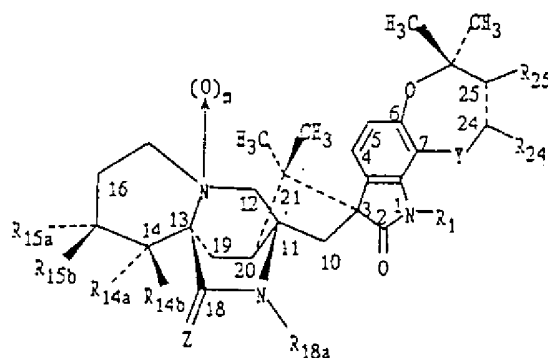
本發明是有關14-經取代之馬可福亭A、B、C及D及其衍

五、發明說明(4)

生物之合成，以及這些化合物充作抗寄生蟲藥物之用法。因此本發明目的是描述這些馬可福亭衍生物。本發明再一目的是描述這些化合物之製法，再來是描述使用被類化合物為抗寄生蟲劑，以治療及預防寄生蟲疾病。又一目的是描述治療寄生蟲疾病之組成物，其中含有本發明新穎的化合物為其活性組份。由讀閱以下說明對進一步之目的將可更為明白。

發明說明

本發明化合物以式 I 示出：



其中：

m 是 0 或 1；

Z 是 O 或 S；

Y 是氧原子 (-O-) 或一鍵；

R₁ 是氫、C₁-C₇ 烷基，環 C₃-C₈ 烷基、苄基、C₂-C₇ 烷醯基 (-C(O)C₂-C₇ 烷基) {視所需為羧基 (-COOH)、C₁-C₇ 烷醯基、羧 C₁-C₇ 烷氧基 (-C(O)OC₁-C₇ 烷基)、-NR₄R₅、胺羧基 (-C(O)NR₄R₅) 所取代}、C₁₀-C₂₄ 烷醯基 (-C(O)C₁₀-C₂₄ 烷基)、環 C₃-C₈ 烷醯基 {視所需為羧基

五、發明說明(5)

、 C_1-C_7 烷醯基、羧 C_1-C_7 烷氧基、 $-NR_4R_5$ 、胺羧基所取代)、烷醯氧基亞甲基($-\text{CH}_2\text{OC}(O)-C_2-C_7$ 烷基)、苯醯氧基亞甲基($-\text{CH}_2\text{OC}(O)$ 苯基){視所需為1或2個選自鹵、 C_1-C_4 烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基及 C_1-C_7 烷氧基之基團所取代}、 $C_{10}-C_{24}$ 烯醯基($-\text{C}(O)C_9-C_{23}$ 烯基)、苯磺醯基($-\text{SO}_2\text{CH}_2$ 苯基){視所需為1或2個選自鹵、 C_1-C_4 烷基、鹵 C_1-C_7 烷基硝基、氟基及 C_1-C_7 烷氧基所取代}、 C_1-C_4 烷胺羧基($-\text{C}(O)\text{N}(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$)、 C_1-C_4 烷胺硫羧基($-\text{C}(S)\text{N}(C_1-C_4 \text{ 烷基})_2$)、 C_1-C_7 烷氧羧基、苯氧羧基{視所需為1或2個選自鹵、 C_1-C_4 烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基及 C_1-C_7 烷氧基之基團所取代}、 $-\text{C}(O)\text{NR}'_4\text{R}'_5$ 、 $-\text{P}(=\text{X})(\text{R}_2)(\text{R}_3)$ 、 $-\text{SR}_6$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_5$ 、苯醯基為 $-\text{CH}_2\text{NR}_4\text{R}_5$ 取代在3或4位置上，或二環 C_8-C_{12} 烷醯基；

R_4 及 R_5 ，可相同或不同，選自氫、 C_1-C_7 烷基、苯基{視所需為1或2個選自鹵、 C_1-C_4 烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基及 C_1-C_7 烷氧基的基團所取代}，或與N一起形成一個飽和的或未飽和之雜環胺環；

R_4' 及 R_5' ，可相同或不同，選自 C_1-C_7 烷基，環(C_3-C_8) 烷基，苯基{視所需為1或2個選自鹵、 C_1-C_4 烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基及 C_1-C_7 烷氧基之基團所取代}，或當加上N，可形成飽和雜環胺環，視所需含有1或2個額外的雜原子，選自N、O或S；

X 是O或S；

五、發明說明(6)

R_2 及 R_3 ，可相同或不同，選自 C_1-C_7 烷基，苯基{視所需為1或2個選自鹵、 C_1-C_4 烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基及 C_1-C_7 烷氧基之基團所取代}、 C_1-C_7 烷氧基、硫(C_1-C_7)烷氧基、苯氧基、硫苯氧基、 $-NR_7R_8$ {其中 R_7 及 R_8 ，可相同或不同，選自H、 C_1-C_7 烷基或加上N形成飽和雜環}，或加上P形成4-至7-員雜環；

R_9 是 C_1-C_7 烷基，鹵 C_1-C_7 烷基、羰 C_1-C_7 烷氧基、 $-NR_9R_{10}$ 其中 R_9 及 R_{10} 可相同或不同，為 C_1-C_7 烷基或苯基(視所需為1或2個選自鹵、低碳烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基、 C_1-C_7 烷氧基所取代)；

R_{24} 是氫、鹵或 C_1-C_7 烷氧基；

R_{25} 是氫或鹵；

R_{13a} 是氫、 C_1-C_7 烷基、 C_2-C_8 烷氧烷基、 C_2-C_8 烯基、 C_2-C_8 炔基或苄基；

R_{14a} 是羥基、氫、 C_1-C_7 烷基、 C_2-C_8 烷氧烷基、環(C_3-C_8)烷基或苄基(視所需為1或2個選自鹵、低碳烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基、 C_1-C_7 烷氧基之基團所取代)；

R_{14b} 是氫、羥基、 C_1-C_7 烷氧基、環(C_3-C_8)烷基或苄氧基(視所需為1或2個選自鹵、低碳烷基、鹵 C_1-C_7 烷基、硝基、氟基、 C_1-C_7 烷氧基之基團所取代)；

R_{15a} 及 R_{15b} 二者均為氫，限制條件為當 R_{14a} 及 R_{14b} 之一是羥基且另一者是氫或甲基， R_{15a} 及 R_{15b} 可為氫或甲基；

介於碳24及25之間之虛線代表單或雙鍵；且整體之限制

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

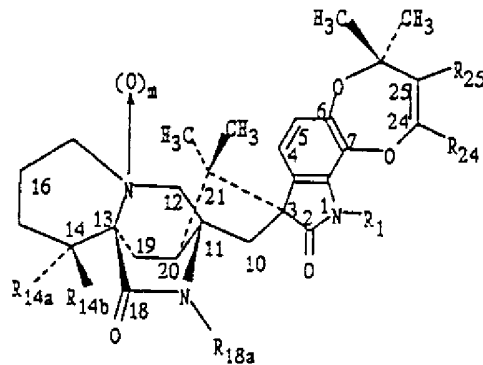
錄

五、發明說明(7)

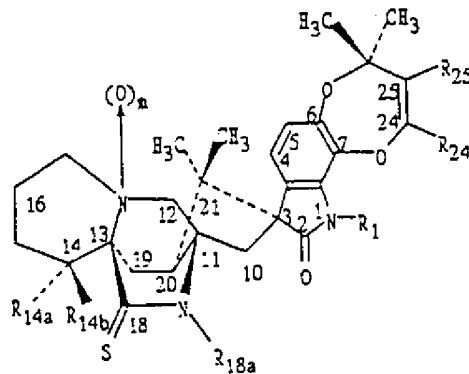
條件為 R_{14a} 及 R_{14b} 非均為氫。

本發明的化合物包括其藥學上可接受的鹽，以及其 12a-N-氧化物。

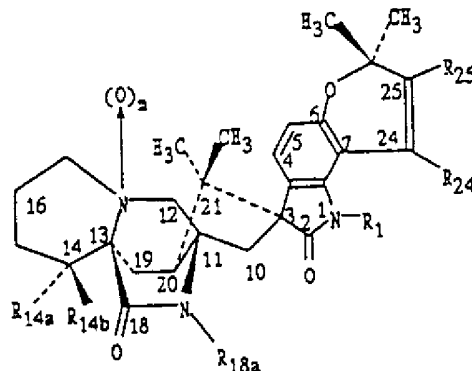
本發明另一方面提出式 IA 之 14- 經取代之馬可福亭 A 及 B 化合物：



本發明另一方面提出式 IB 之 14- 經取代之硫馬可福亭 A 及 B 化合物：

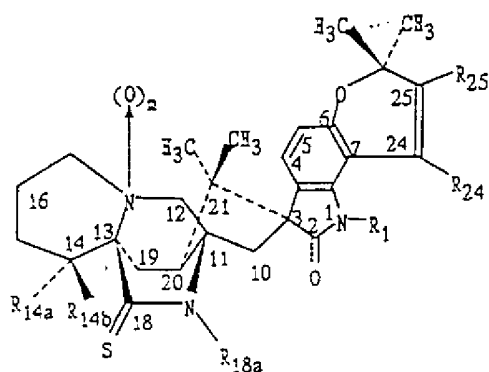


本發明另一方面提出式 II 14- 經取代之馬可福亭 C 及 D 化合物：



五、發明說明(8)

本發明另一方面提出式Ⅲ之14-經取代之硫馬可福亭C及D化合物：



各種含碳氫化物部份之碳含量示於字首，表示部份中最少及最多的碳原子數目，即字首C_i-C_j表示整數“i”至整數“j”碳原子之碳原子含量。因此，C₁-C₃烷基係指包括1-3個碳原子之烷基，或甲基、乙基、丙基及異丙基。

關於上述，“C₁-C₇烷基”用以包括由1至7個碳原子之烷基，可在直或分支之鏈上。此種低碳烷基之實例有：甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第二丁基、第三丁基、戊基、己基、庚基及其他。

環(C₃-C₈)烷基用以包括3至8員之烷基環。環(C₃-C₈)烷基之實例有：環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、二環[2.2.1]庚基等。

C₁-C₈烷氧基用以包括由1至8個碳原子之烷氧基，可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(9)

在直或分支鏈上。此種 C_1-C_8 烷氧基實例有：甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、第二丁氧基、戊氧基、己氧基、庚氧基等。

C_2-C_7 烷醯基用以包括由 2 至 7 個碳原子之烷醯基，可在直或分支鏈上。此種 C_2-C_7 烷醯基之實例包括乙醯基、丙醯基、異丙醯基、丁醯基、戊醯基、己醯基、等。

$C_{10}-C_{24}$ 烷醯基 ($-C(O)C_9-C_{23}$ 烷基) 用以包括由 10 至 24 個碳原子之烷醯基，可在直或分支鏈上。此種 $C_{10}-C_{24}$ 烷醯基之實例包括癸醯基 [$-C(O)(CH_2)_9CH_3$]、月桂醯基 [$-C(O)(CH_2)_{10}CH_3$]、十三碳醯基 [$-C(O)(CH_2)_{11}CH_3$]、肉豆蔻醯基 [$-C(O)(CH_2)_{12}CH_3$]、十五碳醯基 [$-C(O)(CH_2)_{13}CH_3$]、棕櫚醯基 [$-C(O)(CH_2)_{14}CH_3$]、珠光脂醯基 [$-C(O)(CH_2)_{15}CH_3$]、硬脂醯基 [$-C(O)(CH_2)_{16}CH_3$]、花生醯基 [$-C(O)(CH_2)_{18}CH_3$]、二十一碳醯基 [$-C(O)(CH_2)_{19}CH_3$]、山箭醯基 [$-C(O)(CH_2)_{20}CH_3$]、二十三碳醯基 [$-C(O)(CH_2)_{21}CH_3$]、二十四碳醯基 [$-C(O)(CH_2)_{22}CH_3$]、等。

$C_{10}-C_{24}$ 烯醯基 ($-C(O)C_9-C_{23}$ 烯基) 用以包括由 10 至 24 個碳原子之不飽和基，可在直或分支鏈上。此種 $C_{10}-C_{24}$ 烯醯基之實例包括十一碳烯醯基 [$-C(O)(CH_2)_7CH:CHCH_3$]，油醯基 [$-C(O)(CH_2)_7CH:CH(CH_2)_7CH_3$]，亞油醯基 [$-C(O)(CH_2)_7CH:CH.CH_2.CH:CH(CH_2)_4CH_3$]，及其他。

所謂“ C_2-C_8 烷氧烷基”用以包括低碳烷氧基取代之低

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(10)

碳烷基，含2至8個碳原子，且含1至3個氧原子於直或分支鏈上。此種 C_2-C_8 烷氧烷基之實例包括甲氧甲基、甲氧乙氧甲基、甲氧乙氧乙氧甲基、乙氧乙基等。 C_1-C_8 烷氧甲基之實例有：甲氧甲基、乙氧甲基、丙氧甲基、丁氧甲基、戊氧甲基、丁氧甲基、戊氧甲基、己氧甲基及庚氧甲基，及其異構型式。

所謂烷醯氧基亞甲基用以包括經烷醯氧基取代之亞甲基，含2至8個碳原子於直或分支鏈上。此種 C_2-C_8 烷醯氧基亞甲基實例包括乙醯氧基甲基、第三丁氧甲基、正丙氧甲基、戊氧甲基等。

所謂“經取代之苯醯氧基亞甲基”用以包括苯醯氧甲基，其中苯環為0至3個選自下列之取代基所取代：低碳烷基、三氟甲基、 C_1-C_7 烷氧基、硝基或氟基，及鹵原子。

所謂“經取代之苯磺醯基”包括苯磺醯基，其中苯環為0至3個選自下列之取代基所取代：低碳烷基、三氟甲基、 C_1-C_7 烷氧基、硝基或氟基，及鹵原子。

所謂“鹵”包括鹵原子氟、氯、溴及碘。

所謂“鹵 C_1-C_7 烷基”包括鹵經取代之 C_1-C_7 烷基含1至7個碳原子於直或分支鏈上，且有1至3個鹵原子。鹵 C_1-C_7 烷基之實例包括氟甲基、2-溴乙基、3-氯丙基、5-碘戊基、三氟甲基等。

所謂“鹵 C_2-C_8 烯基”包括低碳烷基含2至8個碳原子於直或分支鏈上，其中含1至2個碳-碳雙鍵。此種 C_2-C_8 烯基之實例包括烯丙基、3-丁烯基、2,4-戊二烯基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(11)

己烯基等。

“ C_2-C_8 炔基”用以包括炔基含 1 至 8 個碳原子於直或分支鏈上，其中含 1 至 2 個碳-碳叁鍵。此種 C_2-C_8 炔基之實例包括炔丙基、2-丁炔基、2,4-戊二炔基、5-己炔基等。

“烷氧羰基”($-C(=O)O-(CH_2)_p-C_1-C_7$ 烷氧基)之實例包括乙氧羰基、異丙氧羰基、甲氧羰基、丁氧羰基、己氧羰基及其他。 C_1-C_7 烷酯基用以包括由 1 至 7 個碳原子之烷基，於直或分支鏈上。 C_1-C_7 烷酯基實例包括乙酯基、丙酯基、異丁酯基、戊酯基、5-甲基己酯基等。

胺基羰基($-C(=O)NR_4R_5$)之實例包括二甲胺基羰基、丙基甲胺基羰基、二丁胺基羰基、異丙胺基羰基、己胺基羰基等。

胺基硫代羰基($-C(=S)NR_4R_5$)之實例包括二甲胺基硫代羰基、丙基甲胺基硫代羰基、二丁胺基硫代羰基、異戊胺基硫代羰基、己胺基硫代羰基及其他。

$-P(=X)(R_2)(R_3)$ 基團之實例包括二乙基硫代磷酯基、苯基甲氧基磷酯基、2-硫代-1,3,2-二噁正磷基、N,N-二甲基甲氧基胺基磷酯基、二苯基氧磷基等。

$-SR_6$ 之實例包括 2,4-二硝基苯次磺酯基、二甲胺基次磺酯基、乙氧羰基次磺酯基、三氯甲基次磺酯基、4-嗎福啉次磺酯基等。

$-SO_2NR_4R_5$ 之實例包括二甲基胺磺酯基、苯基甲基胺磺酯基、4-嗎福啉胺磺酯基、六氫吡啶基胺磺酯基等。

所謂“含 P 之雜環”用以包括 1,3-二噁-2-正磷、1-吡

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(12)

-3- 噁 -2- 磷戊環 -1,3- 二吡 -2- 磷戊環、1-噁 -3- 噁
-2- 磷戊環等。

依據 $-NR_4R_5$ 、 $-NR'_4R'_5$ 及 $-NR_7R_8$ 之雜環胺環實例有：

4-嗎福啉，
4-苯基-1-六氫吡啶，
4-(2-吡啶基)-1-六氫吡啶，
2,6-二甲基-4-嗎福啉，
1-四氫吡咯，
4-甲基-1-六氫吡啶，
1-六氫吡啶，
4-苯基-1-六氫吡啶，
噻唑啶，
4-苯基-1,2,3,6-四氫吡啶，
4-苯基六氫吡啶，
脯胺酸乙酯，
四氫呋喃胺，
3-二氫吡咯，
噻唑啶-4-羧酸，
硫代嗎福啉，
派啶醯胺，
2-甲基六氫吡啶，
3-甲基六氫吡啶，
4-甲基六氫吡啶，
N-甲基六氫吡啶，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (13)

1-甲基高六氫吡咩，

1-乙醯基六氫吡咩，

N-乙醯基六氫吡咩，

藥學上可接受之鹽類表示鹽可用於投予本發明化合物、且包括甲磺酸鹽、鹽酸鹽、氫溴化物、氫碘化物、硫酸鹽、磷酸鹽、乙酸鹽、丙酸鹽、乳酸鹽、馬來酸鹽、蘋果酸鹽、琥珀酸鹽、酒石酸鹽等。這些鹽類也可呈水合型式。

本發明較佳的化合物為式 IA 及 IB 化合物，其中 R_{14a} 是羥基及氫、 R_{14b} 是氫、甲基及乙基； R_{24} 及 R_{25} 是氫； R_{18a} 是氫， C_1-C_4 烷基， C_2-C_4 烷氧烷基， C_2-C_4 烯基或苯基；且在 24 及 25 碳間之虛線代表雙鍵。

本發明較佳化合物之實例如下：

14 β -甲基馬可福亭 A，

14 β -乙基馬可福亭 A，及

14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；較好是

14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 A；

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭 A；更好

14 α -羥基馬可福亭 A 及

14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A。

以下化合物利用 EP 0 354 615 A1 (發表於 1990 年 2 月 14 日)、及 PCT/US92/09483 (WO 93/10120，發表於 1993 年 5 月 27 日) 之方法可製備自 14 α -羥基馬可福亭、14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭、14 β -甲基馬可福亭、14 β -乙基馬可福亭、或 14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭，

五、發明說明(14)

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭，及14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭，以上二申請案均列為本案參考：

- 1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-環丙氧基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 2-二環[2,2,1]庚醯基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-琥珀醯基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基馬可福亭A；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-乙醯基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-甲基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-苄基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 1-甲氧羰基-14 α -羥基馬可福亭A；
- 14 α -羥基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；
- 24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基馬可福亭B；
- 1-乙基-14 α -羥基馬可福亭B；
- 1-苄基-14 α -羥基馬可福亭B；

五、發明說明 (15)

18a-乙基-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-苄基-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-甲氧基乙氧基甲基-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-烯丙基-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-炔丙基-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭
B；

1,18a-雙乙基-14 α -羥基馬可福亭B；

1,18a-雙苄基-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羥基馬可福亭B；

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-乙基-24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；

24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭C；

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羥基馬可福亭C；

1-丙醯基-14 α -羥基馬可福亭C；

1-丙基-14 α -羥基馬可福亭C；

1-苄基-14 α -羥基馬可福亭C；

18a-丙基-14 α -羥基馬可福亭C；

18a-苄基-14 α -羥基馬可福亭C；

18a-甲氧基乙氧基甲基-14 α -羥基馬可福亭C；

18-烯丙基-14 α -羥基馬可福亭C；

18a-炔丙基-14 α -羥基馬可福亭C；

1,18a-雙-丙基-14 α -羥基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (16)

- 1,18a-雙- 苄基-14 α -羥基馬可福亭 C ;
- 14 α -羥基馬可福亭 C ;
- 1-(4-乙酯基-1,3- 噻唑啉-3- 基) 羰基-14 α -羥基馬可福亭 A ;
- 1-棕櫚醯基-14 α -羥基馬可福亭 A ;
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基馬可福亭 A ;
- 1-棕櫚醯基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-環丙基羰基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 2-二環[2.2.1] 庚醯基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-(1-六氫吡啶基) 硫代羰基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-琥珀醯基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-(對位- 甲苯磷醯基)-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-甲基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-苄基-14 α -羥基馬可福亭 D ;
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基馬可福亭 D ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

(線

五、發明說明 (17)

- 1-甲氧羰基-14 α -羥基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-環丙基羰基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-苯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B；

五、發明說明(18)

24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

1-(對位甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

1-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-烯丙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-炔丙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

1,18a-雙-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

1,18a-雙-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

18a-乙基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭B;

24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (19)

亭 C ;

1-丙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

1-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

18a-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

18a-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

18a-烯丙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

18a-炔丙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

1,18a-雙丙基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

1,18a-雙苄基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 C ;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 A ;

1-(4-嗎福啉基羰基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭
A ;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 D ;

1-(4-嗎福啉基羰基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭
D ;

14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 D ;

1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 D ;

1-二乙氧磷醯-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 D ;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 D ;

1-環丙羰基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 D ;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(20)

D:

1-(1-六氫吡啶基) 硫代羰基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

24-丙氨基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D;

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D;

1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-環丙羰基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-(1-六氫吡啶基) 硫代羰基-14 α -羥基-14 β -乙基馬

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(21)

可福亭 A；

1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-甲基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-苯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A；

14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 B；

24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 B；

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 B；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 B；

1-乙基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 B；

1-苯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 B；

18a-乙基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 B；

五、發明說明(22)

18a-苄基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-甲氧基乙氧基甲基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭
B；

18a-烯丙基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-炔丙基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羟基-14 β -乙
基馬可福亭B；

1,18a-雙乙基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭B；

1,18a-雙苄基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭B
；

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
25-二氫-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-乙基-24,25-二氫-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭
B；

24,25-二氫-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭C；

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福
亭C；

1-丙醯基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭C；

1-丙基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭C；

1-苄基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭C；

18a-丙基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭C；

18a-苄基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭C；

18a-甲氧基乙氧基甲基-14 α -羟基-14 β -乙基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

封

五、發明說明(23)

C；

18-烯丙基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭C；18a-炔丙基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭C；1,18a-雙丙基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭C；1,18a-雙苄基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭C；14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭C；1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭A；1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭A

；

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D；1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D

；

14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D；1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D；1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D；1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D；1-環丙羰基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D；2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭

D；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-14 β -乙基馬
可福亭D；1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭D；1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 α -羥基-14 β -乙基馬可
福亭D；

五、發明說明 (24)

- 1- (2,4-二硝苯次磺醯基) -14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 1- (對位- 甲苯磺醯基) -14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 1-甲基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 1-苄基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯氧基甲基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1-二乙氧基磺醯基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1-二甲基胺磺醯基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1-環丙基羰基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 2-二環 [2.2.1] 庚醯基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1- (1-六氫吡啶基) 硫代羰基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1-琥珀醯基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1- (4-嗎福啉基次磺醯基) -14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1- (2,4-二硝苯次磺醯基) -14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1- (對位- 甲苯磺醯基) -14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1-乙醯基-14 β -甲基馬可福亭 A ;
- 1-甲基-14 β -甲基馬可福亭 A ;

五、發明說明 (25)

- 1-苄基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺甲醯基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-甲氧羰基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 14 β -甲基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭B；
- 24-甲氧基-24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1-乙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1-苄基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-苄基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-炔丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1,18a-雙乙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1,18a-雙苄基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭C；
- 1-(對位-溴苯磺醯基)-14 β -甲基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(26)

- 1-丙醯基-14 β -甲基馬可福亭C；
 1-丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
 1-苄基-14 β -甲基馬可福亭C；
 18a-丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
 18a-苄基-14 β -甲基馬可福亭C；
 18a-甲氧乙氧甲基-14 β -甲基馬可福亭C；
 18a-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
 18a-炔丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
 1,18a-雙丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
 1,18a-雙苄基-14 β -甲基馬可福亭C；
 14 β -甲基馬可福亭C；
 1-棕櫚醯基-14 β -甲基馬可福亭A；
 1-(4-嗎福啉羰基)-14 β -甲基馬可福亭A；
 1-棕櫚醯基-14 β -甲基馬可福亭D；
 1-(4-嗎福啉羰基)-14 β -甲基馬可福亭D；
 14 β -甲基馬可福亭D；
 1-乙醯氧基甲基-14 β -甲基馬可福亭D；
 1-二乙氧磷醯基-14 β -甲基馬可福亭D；
 1-二甲基胺磷醯基-14 β -甲基馬可福亭D；
 1-環丙羰基-14 β -甲基馬可福亭D；
 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 β -甲基馬可福亭D；
 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 β -甲基馬可福亭D；
 1-琥珀醯基-14 β -甲基馬可福亭D；
 1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 β -甲基馬可福亭D；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (27)

- 1- (2,4-二硝基苯次磺醯基) -14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 1- (對位 - 甲苯磺醯基) -14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯基-14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 1-甲基-14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 1-苄基-14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 1-二甲基胺甲醯基-14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 1-甲氧羰基-14 β -甲基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯氧甲基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-二乙氧基磷醯基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-二甲基磺醯胺基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-環丙基羰基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 2-二環 [2.2.1] 庚醯基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1- (1-六氫吡啶基) 硫代羰基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-琥珀醯基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1- (4-嗎福啉次磺醯基) -14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1- (2,4-二硝基苯次磺醯基) -14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1- (對位 - 甲苯磺醯基) -14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-乙醯基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-甲基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-苄基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-二甲基胺甲醯基-14 β -乙基馬可福亭 A ;
- 1-甲氧羰基-14 β -乙基馬可福亭 A ;

五、發明說明(28)

- 14 β -乙基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 β -乙基馬可福亭B；
- 24-甲氧基-24,25-二氫-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1-乙基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1-苄基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-乙基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-苄基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-炔丙基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 β -乙基馬可福亭
B；
- 1,18a-雙乙基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1,18a-雙苄基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
25-二氫-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24,25-二氫-14 β -乙基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 β -乙基馬可福亭C；
- 1-(對位-溴苯磺醯基)-14 β -乙基馬可福亭C；
- 1-丙醯基-14 β -乙基馬可福亭C；
- 1-丙基-14 β -乙基馬可福亭C；
- 1-苄基-14 β -乙基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(29)

- 18a-丙基-14 β -乙基馬可福亭C；
 18a-苄基-14 β -乙基馬可福亭C；
 18a-甲氧乙氧甲基-14 β -乙基馬可福亭C；
 18-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C；
 18a-炔丙基-14 β -乙基馬可福亭C；
 1,18a-雙丙基-14 β -乙基馬可福亭C；
 1,18a-雙苄基-14 β -乙基馬可福亭C；
 14 β -乙基馬可福亭C；
 1-棕櫚醯基-14 β -乙基馬可福亭A；
 1-(4-嗎福啉羰基)-14 β -乙基馬可福亭A；
 1-棕櫚醯基-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-(4-嗎福啉羰基)-14 β -乙基馬可福亭D；
 14 β -乙基馬可福亭D；
 1-乙醯氧基甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-二乙氧基磷醯基-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-二甲基胺磷醯基-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-環丙基羰基-14 β -乙基馬可福亭D；
 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-琥珀醯基-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 β -乙基馬可福亭D；
 24-丙氧基-24,25-二氫-14 β -乙基馬可福亭D；
 1-(對位-甲苯磷醯基)-14 β -乙基馬可福亭D；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(30)

- 1-乙醯基-14 β -乙基馬可福亭D；
1-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
1-苄基-14 β -乙基馬可福亭D；
1-二甲基胺甲醯基-14 β -乙基馬可福亭D；
1-甲氧羰基-14 β -乙基馬可福亭D；
1-乙醯氧羰基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
14 α -0-甲基馬可福亭A；
14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；
1-二乙氧基磷醯基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-環丙羰基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-琥珀醯基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭A；
24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-(對位-甲苯磷醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-乙醯基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-甲基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-苄基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
1-甲氧羰基-14 α -0-甲基馬可福亭A；

五、發明說明 (31)

14 α -0-甲基馬可福亭B；
 24,25-二氫-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 1-乙基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 1-苄基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-乙基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-苄基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-烯丙基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-炔丙基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基馬可福
 亭B；
 1,18a-雙乙基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 1,18a-雙苄基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-乙基-24-甲氧基-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
 25-二氫-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 18a-乙基-24,25-二氫-14 α -0-甲基馬可福亭B；
 24,25-二氫-14 α -0-甲基馬可福亭C；
 1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭C；
 1-丙醯基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
 1-丙基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
 1-苄基-14 α -0-甲基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(系)

五、發明說明 (32)

- 18a-丙基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 18a-苄基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 18-烯丙基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 18a-炔丙基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 1,18a-雙丙基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 1,18a-雙苄基-14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 14 α -0-甲基馬可福亭C；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-甲基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-甲基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧甲基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-二乙氧基磷醯基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-環丙羰基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-甲基馬可福亭D
- ；
- 1-琥珀醯基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭D
- ；

五、發明說明 (33)

- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-乙醯基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-甲基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-苄基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-甲氧羰基-14 α -0-甲基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧甲基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-二乙氧磷醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- ；
- 1-環丙氧基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-琥珀醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -0-甲基-14 β -馬可福亭A；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (34)

福亭 A ;

1-乙醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 A ;

1-甲基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 A ;

1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 A ;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 A

;

1-甲氧羰基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 A ;

14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

1- (對位 - 甲苯磺醯基) -14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

1-乙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

18a-乙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

18a-苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B

;

18a-烯丙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

18a-炔丙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

1,18a-雙乙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭 B ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(35)

- 1,18a-雙苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭B;
18a-乙基-24-甲氧基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭
B;
1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭B;
18a-乙基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福
亭B;
24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可
福亭C;
1-丙醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
1-丙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
18a-丙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
18a-苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C
;
18-烯丙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
18a-炔丙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
1,18a-雙丙基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
1,18a-雙苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭C;
1-棕櫚醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭A;
1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(36)

A;

1-棕櫚醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-乙醯氧基甲基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-二乙氧基磷醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-環丙羰基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-(1-六氫吡啶基)-硫代羰基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-琥珀醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;1-(對位-甲苯磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

(線

五、發明說明 (37)

1-乙醯基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D；

1-甲基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D；

1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -甲基馬可福亭D；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D

；

1-甲氧羰基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；

1-乙醯氧甲基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-二乙氧磷醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A

；

1-環丙羰基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-(1-六氫吡啶基)-硫代羰基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-琥珀醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-(4-嗎福啉次磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

24-丙氫基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-(對位-甲苯磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (38)

- 1-乙醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；
- 1-甲基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；
- 1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A
- ；
- 1-甲氧羰基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A；
- 14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1-乙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-乙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B
- ；
- 18a-烯丙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-炔丙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1,18a-雙乙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；
- 1,18a-雙苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (39)

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭
B ;

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭B ;

18a-乙基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福
亭B ;

24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可
福亭C ;

1-丙醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

1-丙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

18a-丙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

18a-苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C
;

18-烯丙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

18a-炔丙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

1,18a-雙丙基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

1,18a-雙苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭C ;

1-棕櫚醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭A ;

1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭
A ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(40)

- 1-棕櫚醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧甲基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-二乙氧基磷醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-環丙羰基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-琥珀醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(對位甲苯磷醯基)-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-乙醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(錄)

五、發明說明(41)

- 1-甲基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-苄基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- ；
- 1-甲氧羰基-14 α -0-甲基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧甲基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；
- 1-二乙氧磷醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-環丙基羰基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- ；
- 1-琥珀醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- A；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-(對位-甲苯磷醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-乙醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-甲基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-苄基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (42)

- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
 1-甲氧羰基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
 14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 24,25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 1-乙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 1-苄基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-乙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-苄基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-烯丙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-炔丙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可
 福亭B；
 1,18a-雙乙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 1,18a-雙苄基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-乙基-24-甲氧基-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
 25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 18a-乙基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可福亭B；
 24,25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
 1-(對位溴苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
 1-丙醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；

五、發明說明(43)

- 1-丙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 1-苄基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 18a-丙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 18a-苄基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 18-烯丙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 18a-炔丙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 1,18a-雙丙基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 1,18a-雙苄基-14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 14 α -0-烯丙基馬可福亭C；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉羧基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉羧基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧基甲基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-二乙氧基磷醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-環丙羧基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羧基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-琥珀醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭D；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(錄

五、發明說明(44)

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭
D;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基馬可福亭D;

1-乙醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D;

1-甲基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D;

1-苯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D;

1-甲氧羰基-14 α -0-烯丙基馬可福亭D;

1-乙醯氧基甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭A

;

1-二乙氧磷醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭A

;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭

A;

1-環丙氧基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可
福亭A;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲
基馬可福亭A;

1-琥珀醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭A;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基
馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲

五、發明說明(45)

基馬可福亭 A；

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可

福亭 A；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬

可福亭 A；

1-乙醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 A；

1-甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 A；

1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 A；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭

A；

1-甲氧羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 A；

14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 B；

24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 B；

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可

福亭 B；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬

可福亭 B；

1-乙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 B；

1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 B；

18a-乙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 B；

18a-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 B；

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭

B；

18a-烯丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭 B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(46)

- 18a-炔丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1,18a-雙乙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1,18a-雙苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 1-丙醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 1-丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 18a-丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 18a-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 18-烯丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 18a-炔丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 1,18a-雙丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；

五、發明說明 (47)

- 1,18a-雙苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭C；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 1-二乙氧磷醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- ；
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 1-環丙羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 1-琥珀醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -馬可福亭D；
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(號

五、發明說明(48)

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-乙醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -甲基馬可福亭D;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D;

1-甲氧羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D;

1-乙醯氧甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-二乙氧磷醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A

;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-環丙羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-琥珀醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙

五、發明說明(49)

基馬可福亭A；

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-乙醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；

1-甲氧羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；

14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

1-乙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-乙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

18a-烯丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明 (50)

18a-炔丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B;

1,18a-雙乙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B;

1,18a-雙苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B;

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B;

18a-乙基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭B;

24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

1-丙醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

1-丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

18a-丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

18a-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

18-烯丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

18a-炔丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

1,18a-雙丙基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(線)

五、發明說明(51)

- 1,18a-雙苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C；
- 14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭C；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉基羰基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧基甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-二乙氧磷醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-二甲氧胺磷醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-環丙羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-琥珀醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(線)

五、發明說明(52)

基馬可福亭D；

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；

1-乙醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；

1-甲基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；

1-苄基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；

1-甲氧羰基-14 α -0-烯丙基-14 β -乙基馬可福亭D；

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-環丙氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A；

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A；

五、發明說明(53)

1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭

A;

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -

甲基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基

-15 α -甲基馬可福亭A;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲

基馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -

甲基馬可福亭A;

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A

;

1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬

可福亭A;

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭

A;

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭B;

24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭

B;

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲

基馬可福亭B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

綠

五、發明說明(54)

甲基馬可福亭B；

1-乙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭B；

1-苄基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭B；

18a-乙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭B
；

18a-苄基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭B
；

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬
可福亭B；

18a-烯丙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭
B；

18a-炔丙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭
B；

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羟基-14 β -甲
基-15 α -甲基馬可福亭B；

1,18a-雙乙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福
亭B；

1,18a-雙苄基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福
亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基
馬可福亭B；

1-(2,4-二硝基苯磺酰基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
25-二氫-14 α -羟基馬可福亭B；

18a-乙基-24,25-二氫-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

線

五、發明說明 (55)

基馬可福亭B；

24,25-二氫-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭

C；

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -

甲基馬可福亭C；

1-丙醯基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭C

；

1-丙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭C；

1-苄基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭C；

18a-丙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭C

；

18a-乙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭C

；

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬
可福亭C；

18-烯丙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭
C；

18a-炔丙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭
C；

1,18a-雙丙基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福
亭C；

1,18a-雙苄基-14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福
亭C；

14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明 (56)

- 1- (4-乙酯基-1,3- 噻唑啉-3- 基) 羰基-14 α -羥基
-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭 A ;
- 1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭
A ;
- 1- (4-嗎福啉羰基) -14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基
馬可福亭 A ;
- 1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭
D ;
- 1- (4-嗎福啉羰基) -14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基
馬可福亭 D ;
- 14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福
亭 D ;
- 1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可
福亭 D ;
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬
可福亭 D ;
- 1-環丙羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭
D ;
- 2-二環 [2.2.1] 庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭
D ;
- 1- (1-六氫吡啶基) 硫代羰基-14 α -羥基-14 β -甲基
-15 α -甲基馬可福亭 D ;
- 1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(錄

五、發明說明(57)

D；

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

1-苯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭D；

14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；

1-環丙氧基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；

五、發明說明(58)

1-(1-六氫吡啶基) 硫代羧基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-琥珀醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-乙醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-甲基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-苯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

1-甲氧羧基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A;

14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 B;

24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 B;

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 B;

1-乙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 B;

1-苯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 B;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (59)

- 18a-乙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 18a-苄基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 18a-烯丙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 18a-炔丙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 1,18a-雙-乙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 1,18a-雙-苄基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 1-丙醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 1-丙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 1-苄基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 18a-丙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 18a-苄基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(60)

- 18-烯丙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 18a-炔丙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 1,18a-雙丙基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 1,18a-雙苄基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭C；
- 1-(4-乙酯基-1,3-噻唑基-3-基)-羰基-14 α -羥基
-15 α -甲基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 1-環丙羰基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭
D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-15 α -甲基馬
可福亭D；
- 1-琥珀醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福
亭D；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(61)

可福亭 D；

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 D；

1-乙醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 D；

1-甲基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 D；

1-苯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 D；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 D；

及

1-甲氧羰基-14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 D。

本發明之新穎化合物可由以下化學反應製備，例如，可應用於製備 14 α -羥基馬可福亭 A (式 10, A 圖)、14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 A (式 15, C 圖)、14 β -羥基馬可福亭 A (式 17, D 圖)、14 α -羥基馬可福亭 A N-氧化物 (式 18, D 圖)、14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A (式 19, D 圖)、14 β -甲基馬可福亭 A、14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭 A、14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A，及其前驅體 (A 至 G 圖)。

本發明新穎的化合物可以以下步驟製備：意外地發現到，以碘化氫處理馬可福亭 A、B、C 及 D 或其適合的經取代的 C-24，C-25，N-1 及 N-18a 衍生物，可產生本發明之化合物，因而提供如 A 圖中所說明之方法。

本發明另一方面是依據 A 至 G 圖製備之新穎的中間物，

五、發明說明(62)

包括：

- 16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-乙醯氧甲基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-二乙氧磷醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磺醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-環丙氧基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-琥珀醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉次磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-乙醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-甲基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-苯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺甲醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-甲氧羰基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 24-甲氧基-24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(63)

- 1-乙基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 1-苄基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-乙基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-苄基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-甲氧乙氧甲基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-烯丙基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-炔丙基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 1,18a-雙-乙基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 1,18a-雙-苄基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24-甲氧基-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 18a-乙基-24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 1-(對位-溴苯磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 1-丙醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 1-丙基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 1-苄基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 18a-丙基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 18a-苄基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 18a-甲氧乙氧甲基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 18-烯丙基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (64)

- 18a-炔丙基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 1,18a-雙丙基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 1,18a-雙苄基-16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 16-碘-17-氟基馬可福亭C；
- 1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羰基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-16-碘-17-氟基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧基甲基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-二乙氧磷醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺磺醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-環丙羰基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-琥珀醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉次磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-16-碘-17-氟基馬可福亭D；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-16-碘-17-氟基馬可福亭D；

五、發明說明 (65)

- 1-乙醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭 D ;
- 1-甲基-16-碘-17-氟基馬可福亭 D ;
- 1-苄基-16-碘-17-氟基馬可福亭 D ;
- 1-二甲基胺甲醯基-16-碘-17-氟基馬可福亭 D ;
- 1-甲氧羰基-16-碘-17-氟基馬可福亭 D ;
- 16,17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-乙醯氧甲基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-二乙氧磷醯基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-二甲基胺磺醯基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-環丙羰基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-琥珀醯基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-(4-嗎福啉次磺醯基)-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;
- 1-乙醯基-16, 17-去氫-17-氟基馬可福亭 A ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(66)

- 1-甲基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭A;
- 1-苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭A;
- 1-二甲基胺甲醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭A;
- 1-甲氧羰基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭A;
- 16,17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 24,25-二氫-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 24-甲氧基-24,25-二氫-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 1-乙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 1-苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 18a-乙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 18a-苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 18a-甲氧乙氧甲基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 18a-烯丙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 18a-炔丙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 1,18a-雙乙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 1,18a-雙苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 18a-乙基-24-甲氧基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(67)

25-二氫-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭B;

18a-乙基-24, 25-二氫-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭
B;

24,25-二氫-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-16, 17-去氫-17-甾基馬可福
亭C;

1-丙醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

1-丙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

1-苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

18a-丙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

18a-苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

18a-甲氧乙氧甲基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

18-烯丙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

18a-炔丙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

1,18a-雙丙基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

1,18a-雙苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

16,17-去氫-17-甾基馬可福亭C;

1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羰基-16, 17-去氫
-17-甾基馬可福亭A;

1-棕櫚醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭A;

1-(4-嗎福啉羰基)-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭A;

1-棕櫚醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉羰基)-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;

16,17-去氫-17-甾基馬可福亭D;

五、發明說明(68)

- 1-乙醯氧甲基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-二乙氧磷醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-二甲基胺磷醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-環丙羰基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-琥珀醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-(對位-甲苯磷醯基)-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-乙醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-甲基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-苄基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-二甲基胺甲醯基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 1-甲氧羰基-16, 17-去氫-17-甾基馬可福亭D;
- 17-酮基馬可福亭A;
- 1-乙醯氧基甲基-17-酮基馬可福亭A;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(線

五、發明說明(69)

- 1-二乙氧磷醯基-17-酮基馬可福亭A；
1-二甲基胺磷醯基-17-酮基馬可福亭A；
1-環丙氧基-17-酮基馬可福亭A；
2-二環[2.2.1]庚醯基-17-酮基馬可福亭A；
1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-17-酮基馬可福亭A；
1-琥珀醯基-17-酮基馬可福亭A；
1-(4-嗎福啉次磷醯基)-17-酮基馬可福亭A；
1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-17-酮基馬可福亭A；
24-丙氧基-24,25-二氫-17-酮基馬可福亭A；
1-(對位-甲苯磷醯基)-17-酮基馬可福亭A；
1-乙醯基-17-酮基馬可福亭A；
1-甲基-17-酮基馬可福亭A；
1-苄基-17-酮基馬可福亭A；
1-二甲基胺甲醯基-17-酮基馬可福亭A；
1-甲氧羰基-17-酮基馬可福亭A；
17-酮基馬可福亭B；
24,25-二氫-17-酮基馬可福亭B；
24-甲氧基-24,25-二氫-17-酮基馬可福亭B；
1-(對位-甲苯磷醯基)-17-酮基馬可福亭B；
1-乙基-17-酮基馬可福亭B；
1-苄基-17-酮基馬可福亭B；
18a-乙基-17-酮基馬可福亭B；
18a-苄基-17-酮基馬可福亭B；
18a-甲氧乙氧甲基-17-酮基馬可福亭B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(線

五、發明說明(70)

18a-烯丙基-17-酮基馬可福亭B;

18a-炔丙基-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-17-酮基馬可福亭B

;

1,18a-雙乙基-17-酮基馬可福亭B;

1,18a-雙苄基-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-17-酮基馬可福亭B;

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,

25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B;

18a-乙基-24,25-二氫-17-酮基馬可福亭B;

24,25-二氫-17-酮基馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-17-酮基馬可福亭C;

1-丙醯基-17-酮基馬可福亭C;

1-丙基-17-酮基馬可福亭C;

1-苄基-17-酮基馬可福亭C;

18a-丙基-17-酮基馬可福亭C;

18a-苄基-17-酮基馬可福亭C;

18a-甲氧乙氧甲基-17-酮基馬可福亭C;

18-烯丙基-17-酮基馬可福亭C;

18a-炔丙基-17-酮基馬可福亭C;

1,18a-雙丙基-17-酮基馬可福亭C;

1,18a-雙苄基-17-酮基馬可福亭C;

17-酮基馬可福亭C;

1-(4-乙酯基-1,3-噁唑啉-3-基)羰基-17-酮基馬可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(71)

福亭 A；

- 1-棕櫚醯基-17-酮基馬可福亭 A；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-17-酮基馬可福亭 A；
- 1-棕櫚醯基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-(4-嗎福啉羰基)-17-酮基馬可福亭 D；
- 17-酮基羥基馬可福亭 D；
- 1-乙醯氧甲基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-二乙氧磷醯基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-二甲基胺磷醯基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-環丙羰基-17-酮基馬可福亭 D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-琥珀醯基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-17-酮基馬可福亭 D；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-(對位-甲苯磷醯基)-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-乙醯基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-甲基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-苄基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-二甲基胺甲醯基-17-酮基馬可福亭 D；
- 1-甲氧羰基-17-酮基馬可福亭 D；
- 15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A；
- 1-乙醯氧基甲基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(線)

五、發明說明(72)

- 1-二乙氧基磷醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-二甲基胺磷醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-環丙氧基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-琥珀醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 24-丙氧基-24,25-二氫-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(對位-甲苯磷醯基)-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-乙醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-甲基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-二甲基胺甲醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-甲氧羰基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;
- 24, 25-二氫-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;
- 24-甲氧基-24, 25-二氫-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (73)

B；

1- (對位 - 甲苯磺醯基) -15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

1-乙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

1-苄基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

18a-乙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

18a-苄基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

18a-甲氧乙氧甲基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

18a-烯丙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

18a-炔丙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

1,18a-雙-乙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

1,18a-雙-苄基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B；

18a-乙基-24-甲氧基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 B

；

1- (2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,

25-二氫-14 α -羥基馬可福亭 B；

18a-乙基-24, 25-二氫-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

B；

24,25-二氫-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 C；

1- (對位 - 溴苯磺醯基) -15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 C；

1-丙醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明(74)

- 1-丙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 1-苄基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 18a-丙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 18a-苄基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 18a-甲氧乙氧甲基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 18-烯丙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 18a-炔丙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 1,18a-雙丙基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 1,18a-雙苄基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 15,16-去氫-17-酮基馬可福亭C;
- 1-(4-乙酯基-1,3-噻啞啞-3-基)羧基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-棕櫚醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(4-嗎福啉羧基)-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;
- ;
- 1-棕櫚醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D;
- 1-(4-嗎福啉羧基)-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D;
- ;
- 15,16-去氫-17-酮基馬可福亭D;
- 1-乙醯氧甲基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D;
- 1-二乙氧基磷醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D;
- 1-二甲基胺磷醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D;
- 1-環丙羧基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D;
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (75)

D:

1-(1-六氫吡啶基) 硫代羰基-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭 D;

1-琥珀醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-15, 16-去氫-17-酮基馬可福

亭 D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭 D;

24-丙氧基-24, 25-二氫-15, 16-去氫-17-酮基馬可福

亭 D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-15, 16-去氫-17-酮基馬可福

亭 D;

1-乙醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-甲基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-苄基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-二甲基胺甲醯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-甲氧羰基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可

福亭 A;

1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭 A;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭 A;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(76)

1-環丙羰基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭A;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

1-琥珀醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

1-乙醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A

;

1-甲基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;

1-苄基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭A;

1-甲氧羰基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (77)

14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

24,25-二氫-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

1-乙基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

1-苄基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

18a-苄基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

18a-烯丙基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

18a-炔丙基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

1,18a-雙-乙基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

1,18a-雙-苄基-14 α -羟基-15, 16-去氫-17-酮基馬可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(78)

福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基

馬可福亭B；

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,

25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-乙基-24, 25-二氫-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭B；

24,25-二氫-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭
C；

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羥基-15,16-去氫-17-

酮基馬可福亭C；

1-丙醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C

；

1-丙基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

1-苄基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

18a-丙基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C

；

18a-苄基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C

；

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬
可福亭C；

18-烯丙基-14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭C

；

18a-烯丙基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (79)

C;

1,18a-雙-丙基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 C;

1,18a-雙-苄基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 C;

14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 C;

1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羰基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 A;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 A;

1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 A;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-乙醯氧甲基-14 β -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭 D;

1-環丙羰基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(80)

D；

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭D；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羧基-14 α -羥基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭D；

1-琥珀醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

D；

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-

酮基馬可福亭D；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭D；

24-丙氧基-24, 25-二氫-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-

酮基馬可福亭D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-

酮基馬可福亭D；

1-乙醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D

；

1-甲基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；1-苯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭D；

1-甲氧羧基-14 α -羥基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

D；

14 α -羥基-17-酮馬可福亭A；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (81)

- 1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-環丙羧基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- ；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羧基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-琥珀醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- ；
- 1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- ；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- ；
- 1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- ；
- 1-乙醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-苄基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 1-甲氧羧基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
- 14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B；
- 24,25-二氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(82)

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B

;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭

B;

1-乙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

1-苄基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

18a-苄基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

18a-烯丙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

18a-炔丙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-17-酮基

馬可福亭B;

1,18a-雙-乙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

1,18a-雙-苄基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B;

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,

25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B;

18a-乙基-24,25-二氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭B

;

24,25-二氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭

C;

1-丙醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(83)

- 1-丙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 1-苄基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 18a-丙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 18a-苄基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 18-烯丙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 18a-炔丙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 1,18a-雙-丙基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 1,18a-雙-苄基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 14 α -羥基-17-酮基馬可福亭C；
 1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羰基-14 α -羥基
 -17-酮基馬可福亭A；
 1-棕櫚醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A；
 1-棕櫚醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D；
 1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D；
 14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D；
 1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D；
 1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D；
 1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D；
 1-環丙羰基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D；
 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭D
 ；
 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-17-酮基馬可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(84)

福亭 D ;

1-琥珀醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-乙醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-苯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-甲氧羰基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 D ;

14,17-二酮基馬可福亭 A

1-乙醯氧甲基-14,17-二酮基馬可福亭 A ;

1-二乙氧磷醯基-14,17-二酮基馬可福亭 A ;

1-二甲基胺磺醯基-14,17-二酮基馬可福亭 A ;

1-環丙氧基-14,17-二酮基馬可福亭 A ;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14,17-二酮基馬可福亭 A ;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14,17-二酮基馬可福亭 A ;

1-琥珀醯基-14,17-二酮基馬可福亭 A ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(85)

1-(4-噻福啉次磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭

A;

24-丙氧基-24,25-二氫-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-乙醯基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺甲醯基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-甲氧羰基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

14,17-二酮基馬可福亭B;

24,25-二氫-14, 17-二酮基馬可福亭B;

24-甲氧基-24,25-二氫-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1-乙基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-乙基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-甲氧乙氧甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-烯丙基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-炔丙基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14, 17-二酮基馬可
福亭B;

1,18a-雙-乙基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(86)

- 1,18a-雙-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-乙基-24-甲氧基-14, 17-二酮基馬可福亭B;
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B;
- 18a-乙基-24,25-二氫-14, 17-二酮基馬可福亭B;
- 24,25-二氫-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1-(對位-溴苯磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1-丙醯基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1-丙基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 18a-丙基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 18a-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 18a-甲氧乙氧甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 18a-烯丙基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 18a-炔丙基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1,18a-雙-丙基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1,18a-雙-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭C;
- 14,17-二酮基馬可福亭C;
- 1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羧基-14, 17-二酮基馬可福亭A;
- 1-棕櫚醯基-14, 17-二酮基馬可福亭A;
- 1-(4-嗎福啉基羧基)-14, 17-二酮基馬可福亭A;
- 1-棕櫚醯基-14, 17-二酮基馬可福亭D;
- 1-(4-嗎福啉基羧基)-14, 17-二酮基馬可福亭D;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(87)

14,17-二酮基馬可福亭D;

1-乙醯氧基甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-二乙氧磷醯基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺甲醯基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-環丙羰基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-琥珀醯基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭D;

24-丙氧基-24,25-二氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-乙醯基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-苄基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺甲醯基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-甲氧羰基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

15,16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-乙醯氧基甲基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-二乙氧磷醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(88)

A；

1-二甲基胺甲醯基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福

亭A；

1-環丙羧基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福亭A；

2-二環[2.2.1]庚醯基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬

可福亭A；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羧基-15，16-去氫-14，17-二

酮基馬可福亭A；

1-琥珀醯基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福亭A；

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-15，16-去氫-14，17-二酮

基馬可福亭A；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-15，16-去氫-14，17-二

酮基馬可福亭A；

24-丙氧基-24,25-二氫-15，16-去氫-14，17-二酮基馬

可福亭A；

1-(對位-甲苯磺醯基)-15，16-去氫-14，17-二酮基

馬可福亭A；

1-乙醯基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福亭A；

1-甲基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福亭A；

1-苄基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福亭A；

1-二甲基胺甲醯基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福

亭A；

1-甲氧羧基-15，16-去氫-14，17-二酮基馬可福亭A；

15,16-去氫14,17-二酮基馬可福亭B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (89)

24,25-二氫-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

24-甲氧基-24,25-二氫-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

1-(對位-甲苯磺醯基)-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

1-乙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

1-苄基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

18a-乙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

18a-苄基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

18a-甲氧乙氧甲基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

18a-烯丙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

18a-炔丙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

1,18a-雙-乙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

1,18a-雙-苄基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

18a-乙基-24-甲氧基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 B ;

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -經基馬可福亭 B ;

18a-乙基-24, 25-二氫-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明 (90)

可福亭 B ;

24,25-二氫-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

1-(對位-溴苯磺醯基)-15, 16-去氫-14, 17-二酮基
馬可福亭 C ;

1-丙醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

1-丙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

1-苄基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

18a-丙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

18a-苄基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

18a-甲氧乙氧甲基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福
亭 C ;

18-烯丙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

18a-炔丙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

1,18a-雙-丙基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭
C ;

1,18a-雙-苄基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭
C ;

15,16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;

1-(4-乙酯基-1,3-噁唑啉-3-基) 羧基-15, 16-去氫
-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-棕櫚醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-(4-嗎福啉羧基)-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可
福亭 A ;

1-棕櫚醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 D ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(91)

1-(4-嗎福啉羰基)-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-乙醯氧甲基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-二乙氧磷醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺磺醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-環丙羰基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

2-二環[2.2.1]庚醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-琥珀醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

24-丙氧基-24,25-二氫-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-乙醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(92)

- 1-甲基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;
- 1-苄基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;
- 1-二甲基胺甲醯基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;
- 1-甲氧羰基-15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭D;
- 14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-環丙羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(4-嗎福啉基次磷醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;

五、發明說明(93)

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基

馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮

基馬可福亭A;

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可

福亭A;

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A

;

14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

24,25-二氫基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭

B;

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基

馬可福亭B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮

基馬可福亭B;

1-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

18a-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可

福亭B;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(94)

18a-烯丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B

;

18a-炔丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B

;

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

1,18a-雙-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

1,18a-雙-苯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B;

18a-乙基-24, 25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭B;

24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1-丙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1-苯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

18a-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

五、發明說明(95)

18a-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

18-烯丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

18a-烯丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1,18a-雙-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1,18a-雙-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1-(4-乙酯基-1,3-噁唑啉-3-基)羧基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-(4-嗎福啉羧基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉羧基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(96)

1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-環丙烷基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-(1-六氫吡啶基)硫代烷基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-苯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可

五、發明說明(97)

福亭 D :

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭 D

;

14-酮基馬可福亭 A ;

1-乙醯氧甲基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-二乙氧磷醯基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-二甲基胺甲醯基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-環丙羰基-14-酮基馬可福亭 A ;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-琥珀醯基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-(4-嗎福琳次磺醯基)-14-酮基馬可福亭 A ;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14-酮基馬可福亭 A ;

24-丙氧基-24,25-二氫-14-酮基馬可福亭 A ;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14-酮基馬可福亭 A ;

1-乙醯基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-甲基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-苄基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-二甲基胺甲醯基-14-酮基馬可福亭 A ;

1-甲氧羰基-14-酮基馬可福亭 A ;

14-酮基馬可福亭 B ;

24,25-二氫-14-酮基馬可福亭 B ;

24-甲氧基-24,25-二氫-14-酮基馬可福亭 B ;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14-酮基馬可福亭 B ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(98)

- 1-乙基-14-酮基馬可福亭B；
 1-苄基-14-酮基馬可福亭B；
 18a-乙基-14-酮基馬可福亭B；
 18a-苄基-14-酮基馬可福亭B；
 18a-甲氧乙氧甲基-14-酮基馬可福亭B；
 18a-烯丙基-14-酮基馬可福亭B；
 18a-炔丙基-14-酮基馬可福亭B；
 18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14-酮基馬可福亭B
 ；
 1,18a-雙-乙基-14-酮基馬可福亭B；
 1,18a-雙-苄基-14-酮基馬可福亭B；
 18a-乙基-24-甲氧基-14-酮基馬可福亭B；
 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,
 25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；
 18a-乙基-24, 25-二氫-14-酮基馬可福亭B；
 24,25-二氫-14-酮基馬可福亭C；
 1-(對位-溴苯磺醯基)-14-酮基馬可福亭C；
 1-丙醯基-14-酮基馬可福亭C；
 1-丙基-14-酮基馬可福亭C；
 1-苄基-14-酮基馬可福亭C；
 18a-丙基-14-酮基馬可福亭C；
 18a-苄基-14-酮基馬可福亭C；
 18a-甲氧乙氧甲基-14-酮基馬可福亭C；
 18-烯丙基-14-酮基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(99)

18a-炔丙基-14-酮基馬可福亭C；

1,18a-雙-丙基-14-酮基馬可福亭C；

1,18a-雙-苄基-14-酮基馬可福亭C；

14-酮基馬可福亭C；

1-(4-乙酯基-1,3-噁唑啉-3-基)羰基-14-酮基馬可福亭A；

1-棕櫚醯基-14-酮基馬可福亭A；

1-(4-嗎福啉羰基)-14-酮基馬可福亭A；

1-棕櫚醯基-14-酮基馬可福亭D；

1-(4-嗎福啉羰基)-14-酮基馬可福亭D；

14-酮基馬可福亭D；

1-乙醯氧甲基-14-酮基馬可福亭D；

1-二乙氧基磷醯基-14-酮基馬可福亭D；

1-二甲基胺磷醯基-14-酮基馬可福亭D；

1-環丙羰基-14-酮基馬可福亭D；

2-二環[2.2.1]庚醯基-14-酮基馬可福亭D；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14-酮基馬可福亭D；

1-琥珀醯基-14-酮基馬可福亭D；

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14-酮基馬可福亭D；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14-酮基馬可福亭D；

24-丙氧基-24,25-二氫-14-酮基馬可福亭D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14-酮基馬可福亭D；

1-乙醯基-14-酮基馬可福亭D；

1-甲基-14-酮基馬可福亭D；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (100)

- 1-苄基-14-酮基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺甲醯基-14-酮基馬可福亭D；
- 1-甲氧羰基-14-酮基馬可福亭D；
- 16-硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-乙醯氧基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-二乙氧磷醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺磷醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-環丙羰基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-琥珀醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉次磷醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 24-丙氧基-24,25-二氫-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-(對位-甲苯磷醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-乙醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-甲基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-苄基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-二甲基胺甲醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-甲氧羰基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(線

五、發明說明(101)

24,25-二氫-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

24-甲氧基-24,25-二氫-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

1-乙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

1-苄基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

18a-乙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

18a-苄基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

18a-甲氧乙氧甲基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

18a-烯丙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

18a-炔丙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

1,18a-雙乙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

1,18a-雙苄基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-乙基-24,25-二氫-16-二硫-17-酮基馬可福亭B；

24,25-二氫-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；

1-(對位-溴苯磺醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；

；

1-丙醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；

1-丙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；

1-苄基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (102)

- 18a-丙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 18a-苄基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 18a-甲氧乙氧甲基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 18a-烯丙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 18a-炔丙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 1,18a-雙-丙基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 1,18a-雙-苄基-16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 16-二硫-17-酮基馬可福亭C；
- 1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羰基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-(4-嗎福啉基羰基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭A；
- 1-棕櫚醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉基羰基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 16-二硫-17-酮基羥基馬可福亭D；
- 1-乙醯氧基甲基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 1-二乙氧磷醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 1-二甲基胺磺醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 1-環丙基羰基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 1-琥珀醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；
- 1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(103)

D；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；

24-丙氧基-24,25-二氫-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-二硫-17-酮基馬可福亭D

；

1-乙醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；

1-甲基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；

1-苯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；

1-二甲基胺甲醯基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D；或者

1-甲氧羰基-16-二硫-17-酮基馬可福亭D。

16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-乙醯氧基甲基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-二乙氧基磺醯基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-二甲基胺磺醯基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-環丙羰基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

2-二環[2.2.1]庚醯基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

五、發明說明(104)

1-琥珀醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

24-丙氧基-24,25-二氫-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-

酮基馬可福亭A;

1-乙醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A

;

1-甲基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;

1-苯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺甲醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭A;

1-甲氧羰基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

24,25-二氫-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

B;

24-甲氧基-24,25-二氫-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(105)

酮基馬可福亭B；

1-乙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

1-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

18a-乙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B

；

18a-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B

；

18a-甲氧乙氧甲基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

18a-烯丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

18a-炔丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-24，25-二氫-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

1,18a-雙-乙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

1,18a-雙-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭B；

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24，25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-乙基-24，25-二氫-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(106)

基馬可福亭B；

24,25-二氫-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭
C；

1-(對位-溴苯磺醯基)-16-硫苯基-15，16-去氫-17-
酮基馬可福亭C；

1-丙醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C
；

1-丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

1-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

18a-丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C
；

18a-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C
；

18a-甲氧乙氧甲基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬
可福亭C；

18-烯丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭
C；

18a-炔丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭
C；

1,18a-雙-丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可
福亭C；

1,18a-雙-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可
福亭C；

16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(107)

1-(4-乙酯基-1,3-噁唑基-3-基) 羰基-16-硫苯基-15

，16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-棕櫚醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭

A；

1-(4-嗎福啉羰基)-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基

馬可福亭A；

1-棕櫚醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭

D；

1-(4-嗎福啉基羰基)-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮

基馬可福亭D；

16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-乙醯氧甲基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福

亭D；

1-二乙氧磷醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可

福亭D；

1-二甲基胺磺醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬

可福亭D；

1-環丙羰基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭

D；

2-二環[2.2.1]庚醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮

基馬可福亭D；

1-(1-六氫吡啶基) 硫代羰基-16-硫苯基-15，16-去氫

-17-酮基馬可福亭D；

1-琥珀醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (108)

D；

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫
-17-酮基馬可福亭D；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫
-17-酮基馬可福亭D；

24-丙氧基-24,25-二氫-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮
基馬可福亭D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-
酮基馬可福亭D；

1-乙醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D
；

1-甲基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-苄基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-二甲基胺甲醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬
可福亭D；或

1-甲氧羰基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭
D。

16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-乙醯氧甲基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福
亭A；

1-二乙氧基磷醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬
可福亭A；

1-二甲基胺磺醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬
可福亭A；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (109)

1-環丙羰基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭A;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16-硫苯基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

1-琥珀醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫

-17-酮基馬可福亭A;

24-丙氧基-24,25-二氫-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮

基馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-

酮基馬可福亭A;

1-乙醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A

;

1-甲基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;

1-苯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺甲醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬

可福亭A;

1-甲氧羰基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

A;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(110)

16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

24,25-二氫-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭
B;

24-甲氧基-24,25-二氫-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮
基馬可福亭B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-硫苯基-15,16-去氫-17-
酮基馬可福亭B;

1-乙基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

1-苄基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭B;

18a-乙基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭B

;

18a-苄基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭B

;

18a-甲氧乙氧甲基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬
可福亭B;

18a-烯丙基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭
B;

18a-炔丙基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭
B;

18a-乙基-24-甲氧基-24,25-二氫-16-硫苯基-15,16-
去氫-17-酮基馬可福亭B;

1,18a-雙-乙基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可
福亭B;

1,18a-雙-苄基-16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可

五、發明說明(111)

福亭B；

18a-乙基-24-甲氧基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基

馬可福亭B；

1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24，

25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B；

18a-乙基-24，25-二氫-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮

基馬可福亭B；

24,25-二氫-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭

C；

1-(對位-溴苯磺醯基)-16-硫苯基-15，16-去氫-17-

酮基馬可福亭C；

1-丙醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C

；

1-丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

1-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

18a-丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C

；

18a-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭C

；

18a-甲氧乙氧甲基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬

可福亭C；

18a-烯丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭

C；

18a-炔丙基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(112)

C；

1,18a-雙-丙基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

1,18a-雙-苄基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭C；

1-(4-乙酯基-1,3-噁唑啉-3-基)羰基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-棕櫚醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-(4-嗎福啉基羰基)-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭A；

1-棕櫚醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-(4-嗎福啉羰基)-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基羥基馬可福亭D；

1-乙醯氧甲基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-二乙氧基磷醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-二甲基胺磷醯基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-環丙羰基-16-硫苯基-15, 16-去氫-17-酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(113)

D；

2-二環[2.2.1]庚醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-琥珀醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

24-丙氧基-24,25-二氫-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-(對位-甲苯磺醯基)-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-乙醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-甲基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-苄基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；

1-二甲基胺甲醯基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D；或

1-甲氧羰基-16-硫苯基-15，16-去氫-17-酮基馬可福亭D。

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (114)

;

1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-環丙羧基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-(1-六氫吡啶基)硫羧基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(115)

可福亭A；

1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可

福亭A；

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可

福亭A；

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭A；

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭A；

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭B；

24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭B；

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲

基-17-酮基馬可福亭B；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α

-甲基-17-酮基馬可福亭B；

1-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可

福亭B；

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可

福亭B；

18a-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬

可福亭B；

18a-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬

可福亭B；

五、發明說明(116)

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭B;

18a-烯丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭B;

18a-炔丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲

基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭B;

1, 18a-雙-乙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-

酮基馬可福亭B;

1, 18a-雙-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-

酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭B;

1-(2, 4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24,

25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B;

18a-乙基-24, 25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲

基-17-酮基馬可福亭B;

24, 25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -

甲基-17-酮基馬可福亭C;

1-丙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬

可福亭C;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(117)

1-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可
福亭C;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可
福亭C;

18a-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬
可福亭C;

18a-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬
可福亭C;

18a-甲氧乙氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基
-17-酮基馬可福亭C;

18-烯丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基
馬可福亭C;

18a-炔丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基
馬可福亭C;

1,18a-雙-丙基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-
酮基馬可福亭C;

1,18a-雙-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-
酮基馬可福亭C;

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C;

1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羥基-14 α -羥基-14
 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基
馬可福亭A;

1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明 (118)

-17-酮基馬可福亭 A；

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭 D；

1-(4-嗎福啉基羰基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲

基-17-酮基馬可福亭 D；

14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D；

1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮

基馬可福亭 D；

1-二乙氧基磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭 D；

1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭 D；

1-環丙基羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭 D；

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲

基-17-酮基馬可福亭 D；

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-14 β -甲基

-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D；

1-琥珀醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭 D；

1-(4-嗎福啉次磷醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -

甲基-17-酮基馬可福亭 D；

1-(2,4-二硝基苯次磷醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基

-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D；

五、發明說明 (119)

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-乙醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-苄基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-甲氧羰基-14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-乙醯氧基甲基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺磺醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

1-環丙氧基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明(120)

馬可福亭 A；

1-(1-六氫吡啶基) 硫代羧基-14 α -羥基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭 A；

1-琥珀醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A

；

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭 A；

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭 A；

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭 A；

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮

基馬可福亭 A；

1-乙醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A；

1-甲基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A；

1-苯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A；

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可

福亭 A；

1-甲氧羧基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A

；

14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 B；

24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 B

；

24-甲氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (121)

馬可福亭 B；

1- (對位 - 甲苯磺醯基) -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮

基馬可福亭 B；

1- 乙基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福亭 B；

1- 苄基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福亭 B；

18a- 乙基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福亭 B；

18a- 苄基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福亭 B；

18a- 甲氧乙氧甲基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可
福亭 B；

18a- 烯丙基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福亭 B

；

18a- 炔丙基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福亭 B

；

18a- 乙基 -24- 甲氧基 -24, 25- 二氫 -14 α - 羥基 -15 α - 甲
基 -17- 酮基馬可福亭 B；

1, 18a- 雙 - 乙基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福
亭 B；

1, 18a- 雙 - 苄基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬可福
亭 B；

18a- 乙基 -24- 甲氧基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮基馬
可福亭 B；

1- (2, 4- 二硝基苯磺醯基) -18a- 乙基 -24- 甲氧基 -24,
25- 二氫 -14 α - 羥基馬可福亭 B；

18a- 乙基 -24, 25- 二硝基 -14 α - 羥基 -15 α - 甲基 -17- 酮

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

綠

五、發明說明(122)

基馬可福亭B；

24,25-二氫-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C

；

1-(對位-溴苯磺醯基)-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮

基馬可福亭C；

1-丙醯基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

1-丙基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

1-苄基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

18 α -丙基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

18 α -苄基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

18 α -甲氧乙氧甲基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

18-烯丙基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

18 α -炔丙基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C

；

1,18 α -雙-丙基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

1,18 α -雙-苄基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭C；

1-(4-乙酯基-1,3-噻唑啉-3-基)羰基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A；

1-棕櫚醯基-14 α -羟基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A

；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(123)

1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬

可福亭A;

1-棕櫚醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D

;

1-(4-嗎福啉羰基)-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬

可福亭D;

14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D;

1-乙醯氧甲基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭

D;

1-二乙氧磷醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福

亭D;

1-二甲基胺磷醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可

福亭D;

1-環丙羰基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D

;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基

馬可福亭D;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14 α -羥基-15 α -甲基

-17-酮基馬可福亭D;

1-琥珀醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭D

;

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基-17-

酮基馬可福亭D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (124)

-17-酮基馬可福亭 D ;

24-丙氧基-24,25-二氫-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-乙醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-甲基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-苄基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-二甲基胺甲醯基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D ;

1-甲氧羰基-14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 D ;

15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-乙醯氧甲基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-二乙氧磷醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-二甲基胺磺醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-環丙氧基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

2-二環[2.2.1]庚醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

1-琥珀醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;

五、發明說明 (125)

1-(4-嗎福啉基次磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

24-丙氧基-24,25-二氫-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-(對位-甲苯磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-乙醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-甲基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-苄基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺甲醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

1-甲氧羰基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭A;

15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

24,25-二氫-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

24-甲氧基-24,25-二氫-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1-(對位-甲苯磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1-乙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1-苄基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-乙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-苄基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(126)

18a-甲氧乙氧甲基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭

B;

18a-烯丙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-炔丙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1, 18a-雙-乙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1, 18a-雙-苄基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

18a-乙基-24-甲氧基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

1-(2, 4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B;

18a-乙基-24, 25-二氫-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭B;

24, 25-二氫-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

1-(對位-溴苯磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

1-丙醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

1-丙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

1-苄基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-丙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-苄基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-甲氧乙氧甲基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭C;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (127)

- 18-烯丙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;
- 18a-炔丙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;
- 1,18a-雙-丙基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;
- 1,18a-雙-苄基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;
- 15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 C ;
- 1-(4-乙酯基-1,3-噁唑啉-3-基) 羰基-15 α -甲基-14
 , 17-二酮基馬可福亭 A ;
- 1-棕櫚醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 A ;
- 1-(4-嗎福啉羰基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福
 亭 A ;
- 1-棕櫚醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 D ;
- 1-(4-嗎福啉羰基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福
 亭 D ;
- 15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 D ;
- 1-乙醯氧甲基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 D ;
- 1-二乙氧磷醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 D
 ;
- 1-二甲基胺磷醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭
 D ;
- 1-環丙羰基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭 D ;
- 2-二環[2.2.1]庚醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可
 福亭 D ;
- 1-(1-六氫吡啶基) 硫代羰基-15 α -甲基-14, 17-二酮
 基馬可福亭 D ;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (128)

1-琥珀醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

24-丙氧基-24,25-二氫-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-乙醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-甲基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-苯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺甲醯基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

1-甲氧羰基-15 α -甲基-14, 17-二酮基馬可福亭D;

14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

1-乙醯氧甲基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

1-二乙氧磷醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

1-二甲基胺磺醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

1-環丙羰基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

2-二環[2.2.1]庚醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (129)

可福亭 A；

1- (1-六氫吡啶基) 硫代羰基 -14, 15-去氫 -16, 17-二

酮基馬可福亭 A；

1-琥珀醯基 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 A；

1- (4-嗎福琳次磺醯基) -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基
馬可福亭 A；

1- (2,4-二硝基苯次磺醯基) -14, 15-去氫 -16, 17-二
酮基馬可福亭 A；

24-丙氧基 -24, 25-二氫 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬
可福亭 A；

1- (對位 - 甲苯磺醯基) -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基
馬可福亭 A；

1-乙醯基 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 A；

1-甲基 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 A；

1-苯基 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 A；

1-二甲基胺甲醯基 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福
亭 A；

1-甲氧羰基 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 A；

14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 B；

24, 25-二氫 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 B；

24-甲氧基 -24, 25-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 B；

1- (對位 - 甲苯磺醯基) -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基
馬可福亭 B；

1-乙基 -14, 15-去氫 -16, 17-二酮基馬可福亭 B；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(130)

- 1-苄基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-乙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-苄基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-甲氧乙氧甲基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-烯丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-炔丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 1,18a-雙-乙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 1,18a-雙-苄基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 18a-乙基-24-甲氧基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 1-(2,4-二硝基苯磺醯基)-18a-乙基-24-甲氧基-24, 25-二氫-14 α -羥基馬可福亭B;
- 18a-乙基-24, 25-二氫-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭B;
- 24,25-二氫-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1-(對位-溴苯磺醯基)-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1-丙醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;
- 1-丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(131)

1-苄基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-苄基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-甲氧乙氧甲基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-烯丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

18a-炔丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

1,18a-雙-丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

1,18a-雙-苄基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭C;

1-(4-乙酯基-1,3-噁唑啉-3-基)羰基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

1-棕櫚醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

1-(4-嗎福啉羰基)-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭A;

1-棕櫚醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉羰基)-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-乙醯氧甲基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

;

1-二乙氧磷醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

410225

五、發明說明 (132)

D:

1-二甲基胺磺醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-環丙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

2-二環[2.2.1]庚基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(1-六氫吡啶基)硫代羰基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-琥珀基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(4-嗎福啉次磺醯基)-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(2,4-二硝基苯次磺醯基)-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

24-丙氧基-24,25-二氫-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-(對位-甲苯磺醯基)-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-乙基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-甲基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-苯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D;

1-二甲基胺甲醯基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D; 及

1-甲氧基-14, 15-去氫-16, 17-二酮基馬可福亭D。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (133)

製備雜芳族 N-氧化物之一般步驟，可見於 "Chemistry of the Heterocyclic N-Oxides"，A.R. Katritzky and J.M. Lagowski 的第 II 章，由 Academic Press 於 1971 年出版 (Vol. 19 of ORGANIC CHEMISTRY-A Series of Monographs)。典型而言，N-氧化物之形成，可由過羧酸在適合的溶劑中反應而成。使用於非極性溶劑中之最適合的芳族過酸，因為反應通常在室溫下進行。適合的芳族過酸包括過苯甲酸、氯過苯甲酸及過酞酸。

起始物之製備

N-18a 經取代之馬可福亭 B 及 C 及 C24-C25 經修飾之馬可福亭，可以美國專利案 4,923,867 中所示之步驟容易地製備，此揭示已列為本案參考文獻。

利用標準的醃酵及分離技術可分離出馬可福亭 A、B 及 C，加上先前已知之若圭福亭 (roquefortine)，為婁地青霉 (Penicillium roqueforti) 之真菌代謝物。馬可福亭 A 之分離，以及分析及結構特性，已詳述於 Polonsky 等人的 the Chemical Society Chemical Communications 1980, 601-602。馬可福亭 B 及 C 之分析及結構特性，詳述於 Polonsky et al 的 Tetrahedron Letters 1981, 22, 1977-1980。

另外，且較好的是馬可福亭 A、C 及 D 可分離自青霉屬 UC7780 (依 Upjohn Culture Collection, UC 7780, The Upjohn Company, Kalamazoo, MI 命名)。此菌株分離自於伊利諾州收集之土樣中，貯於 Peoria, IL 中之 U.S.

五、發明說明(134)

Department of Agriculture(美國農業部)專利培養物收集所，且編號為NRRL 18887號。為進一步鑑定真菌，於是依循I. John Pitt, The Genus *Penicillium*, Academic Press, London, (1979)所述之方法及材料進行分類學研究。以掃描式電子顯微鏡，依Dietz, A. 及Matthews, J. Appl. Microbiology 18:694-696(1969)之方法檢查孢子及菌絲體表面。於玻片培養物製成後可由光學顯微鏡看見完整的分生孢子梗 [A.H.S. Onions et al., Smith's Introduction to Industrial Mycology, John Wiley and Sons, New York, pp 301-302 (1979)]: 將包括有玻璃珠、顯微玻片及蓋玻片之玻璃培養皿滅菌。將1小片馬鈴薯右旋糖瓊脂置在玻片上，並將真菌培養物接種在4個玻片上。蓋玻片安置在經接種之瓊脂團上，再加無菌水以維持濡濕。在24℃下培育6天。移去蓋玻片並置於一滴乳酚棉藍染料上。

青霉菌 UC 7780 (NRRL 18887)之特色如下：

外形學 - 一種二輪生的帶狀分生孢子梗（在分生孢子及菌柄間二個分支點）。這些分支（梗基）支持瓶梗或帶有分生孢子之結構。分生孢子梗（約35微米）終止於2-5個（10-14微米）梗塞之一輪孢子上。瓶梗在2-5個（7微米）一輪孢子中是安瓿形的。分生孢子是平滑且樣似球形（2微米），通常呈長柱狀。菌柄壁十分平滑。

培養物接種在三個培養皿上，為Czapek酵母瓊脂(CYA)，為直徑6公分者，及麥芽浸膏瓊脂(MEA)及25%硝酸甘

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (135)

油酯瓊脂 (G25N)。接種物由半固體懸液中製成 (0.5 毫升 0.2% 瓊脂加 0.05% 吐溫 80)。一接種匙之分生孢子加至管中並混合。一茶匙懸液再接種至各盤三處上。以針來刺穿接種 6 公分盤。接種方式為：一個 CYA 加上 MEA 及 G25N 盤在 24℃ 下，一個 CYA 盤在 37℃，及 6 公分 CYA 盤在 5℃。7 天後記錄集落直徑、顏色，及其他特色，並示於表 I。在馬鈴薯右旋糖瓊脂上 (PDA, Difco)，可在集落底部或反面產生深紅色。

並未見到有性階段。此造成培養物 (NRRL 18887) 歸在青霉菌索引之亞屬中。在青霉菌索引中，帚狀分生孢子梗型單獨決定此菌種所配屬之亞屬。此菌種與二輪生亞屬有不同的特性，即使其分生孢子梗是二輪生的。此菌種在硝酸甘油酯瓊脂上 7 天，可一致地產生直徑大於 10 毫米之集落。梗基似乎較瓶梗為長，且 2-5 個一輪。這些特色將此青霉菌 (NRRL 18887) 歸於叉狀亞屬。

前述說明用以解釋青霉菌 UC 7880 (NRRL 18887) 菌種，其可用來產生馬來福亭及其衍生物。然而，本發明也包括上述微生物之突變體。如，由自然篩選或經突變劑產生之突變體，包括離子照射如紫外線照射，或化學突變劑如亞硝基胍或其他處理，也包括在本發明範圍內。

此說明書也希望且意欲包括，由熟知之遺傳技術所產生之特異內及特異間遺傳重組體，如利用共軛、transultion 及遺傳工程技術所產生者。

青霉菌 UC 7780 (NRRL 18887) 可培養在需氣條件下，如

五、發明說明(136)

技藝中常用來培養已知青霉屬之共同方式。

至於培養基組份，可應用供青霉菌之任何熟知之營養物質。如，在可同化碳源中有葡萄糖、甘油、麥芽糖、糊精、澱粉、乳糖、蔗糖、糖蜜、大豆油、棉籽油等，較好是應用葡萄糖及甘油，至於可同化之氮源有：大豆粉、花生粉、棉籽粉、魚粉、穀物浸漬液、蛋白胨、米、麴、肉類浸膏、酵母、酵母浸膏、硝酸鈉、硝酸銨、硫酸銨等。此外，如氯化鈉、磷酸鹽、碳酸鈣等無機鹽也可加至培養基中。若必要時少量金屬鹽也可加入。再者若必要時也可加入少量重金屬。

特別地，在需氧條件下培養青霉菌(NRRL 18887)，一般的需氧培養方法均可有益地利用，如固體培養，在通氣及攪動下培養、震盪培養等。

於以通氣及攪動進行培養中，可適當地運用抗起泡劑、如矽油、植物油、界面活性劑等。

培養基之pH值通常在3-9 pH內，且較好在中性範圍內，且培養溫度通常是20°-30℃，特佳為約21℃。

可連續培養直到馬可福亭A在培養基中有相當的累積為止，通常是20小時至240小時，較好是48至168小時，且於培養後可以各種適合的綜合方法分離及回收培養物中之馬可福亭A。如，可以有機溶劑（如乙醚、乙酸乙酯或氯仿）萃取；溶解至更具極性之溶劑中如丙酮或乙醇；以較非極性溶劑移去雜質、如石油醚或己烷，以活性碳或矽膠行吸附層析；經由“sephadex”（可購自Pharmacia Co.

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (137)

， Ltd, U.S.A) 管柱行凝膠過濾，等等。

本發明化合物為意外的強力抗寄生蟲劑，可對抗內及外寄生蟲。特別是蠕蟲及節肢動物，彼等可在人類、動物及植物上引起許多寄生蟲疾病。

寄生蟲疾病可由內寄生蟲或外寄生蟲所引起。內寄生蟲為活在宿主體內，可在器官內（如胃、肺、心臟、腸等）或僅在皮膚內。外寄生蟲活在宿主外表面，但仍可吸取宿主之營養。

內寄生蟲疾病通常是指蠕蟲病，因為由稱為蠕蟲之寄生蟲感染宿主所致。蠕蟲病由於感染飼養動物、如豬、羊、馬、牛、山羊、貓、狗及家禽因而是普及性且嚴重的全世界經濟問題。許多此類感染是由稱為線蟲之類所致，其造成之疾病可分佈全世界各動物種類。這些疾病通常是嚴重的，且可造成受感染動物之死亡。上述所指最普遍的感染動物線蟲屬有：血矛線蟲屬、毛圓線蟲屬、奧斯脫氏線蟲屬、細頸線蟲屬、古柏線蟲屬、蛔蟲屬、邦司頓線蟲屬、結節線蟲屬、夏氏線蟲屬、毛首線蟲屬、圓線蟲屬、毛線蟲屬、網尾線蟲屬、毛細線蟲屬、異刺線蟲屬、弓蛔蟲屬、雞蛔蟲屬、尖尾線蟲屬、鈎口線蟲屬、鈎蟲屬、弓蛔線蟲屬及副蛔蟲屬。許多寄生蟲是種屬特異的（僅感染一種宿主），且大多數也在動物中有較佳之感染位置。因此血矛線蟲屬及奧斯脫氏線蟲感染胃，而細頸線蟲及古柏線蟲屬主要侵犯腸。其他寄生蟲較喜駐留在心臟、眼睛、肺、血管等，而其他仍有皮下寄生蟲。蠕蟲病會造成衰弱、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (138)

體重減輕、貧血、腸傷害、營養不良及其他器官之傷害。
若未加以治療，這種疾病會造成動物之死亡。

外寄生節肢動物之感染、如脾、蟻、虱、既蝨、馬蠅、麗蠅、蚤、等也是嚴重問題。由這些寄生蟲造成之感染會有血液喪失、皮膚傷害、及會干擾正常的吃食習慣因此使體重喪失。這些感染會造成嚴重疾病之傳染、如腦炎、紅血球孢子虫病、豬痘等，可致命的。

動物可在同時為許多寄生蟲菌種所感染，因為為一種寄生蟲感染會使動物衰弱，而使其更易為第二種寄生蟲所感染。因此具廣效性之化合物在治療這些疾病上更有益處。本發明化合物在拮抗這些寄生蟲方面有意外的高活性，且此外地也可拮抗在狗之惡絲蟲、在老鼠之螺旋線蟲及管狀線蟲，咬人昆蟲及會移動之雙翅目幼蟲、如牛中之皮蠅及馬中之骨蠅。

本化合物也可用於拮抗造成人類寄生蟲病之內及外寄生蟲。此種會感染人類之內寄生蟲實例包括鉤口線蟲屬、板口線蟲屬、蛔蟲屬、圓線蟲屬、毛形線蟲屬、毛細線蟲屬、毛首線蟲屬、蟯蟲屬等之胃腸寄生蟲。可感染人類的其他內寄生蟲可見於血液及其他器官中。此種寄生蟲實例有絲蟲的吳策線蟲屬、布魯格氏絲蟲屬、盤尾絲蟲屬等，以及腸內圓絲蟲及毛形線蟲之腸外階段。寄生人類之外寄生蟲包括節肢動物、如蟬、蚤、蟻、虱、等，且如同飼養動物盤為這些寄生蟲感染時會造成嚴重且甚至致命疾病之傳染。本化合物可有效地拮抗內及外寄生蟲，且此外也可拮

五、發明說明 (139)

抗咬人昆蟲及其他干擾人類之雙翅目害虫。本化合物當口服或經腸外投藥，劑量為每公斤動物重由0.05至20毫克。

本化合物也可用於拮抗一般的家庭害虫、如非蠟（蟑螂）、袋衣蛾、皮蠹（黑皮蠹）、家蠅、及拮抗外引紅火蠅。

化合物進一步可用於拮抗農業害虫、如蚜虫（無網長管蚜）、飛蝗、及象甲、以及拮抗昆虫害虫，其可侵犯倉貯穀物、如擬谷盜及拮抗寄生在植物組織未成熟階段之昆虫。化合物可充作殺線虫藥，以控制土壤線虫，此點將是農業上十分重要的。

於充作動物之抗寄生虫藥時，本化合物可口服或注射地內服，或以液體頓服藥或洗髮精般局部使用。

於口服時，化合物可呈膠囊劑、錠劑或頓服藥大丸型式投予，或者其可混合於動物飼料中。膠囊劑、錠劑及頓服藥大丸劑由活性組份混合適合的載劑而成，如澱粉、滑石、硬脂酸鎂、或磷酸二鈣。這些單位劑型由活性組份與適當的細碎惰性組份緊密混合而製成，包括稀釋劑、充填劑、崩散劑、助懸劑、及／或粘合劑，如此可得均勻的混合溶液劑或懸液劑。所謂惰性組份係不與本化合物反應者，且對接受治療之動物無毒。適合的惰性組份包括澱粉、乳糖、滑石、硬脂酸鎂、植物膠及油、等。這些調和物可含各種劑量之活性及非活性組份，依接受治療之動物體型大小及型式、及感染型式及嚴重度等各種因素而定。活性組份也可呈飼料之添加物般投予，可單純地與飼料混合，或

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明(140)

將化合物應用至飼料表面。另外，活性組份可與惰性載體混合，且生成之組成物與飼料混合或直接餵養動物。適合的惰性載劑包括穀粉、檸檬粉、醱酵殘留物、穀粒、乾穀物及其他。活性組份與惰性載劑緊密混合，利用磨碎、攪拌、磨粉或滾筒，如此最終組成物含有由0.001至5.0%按重計之活性組份。

化合物另外可以腸外方式投予、經由活性組份溶於惰性液體載劑組成之調和物注射而投藥。注射方式有肌肉、瘤胃內、氣管內或皮下方式。可注射調和物由活性組份混合適合的惰性液體載劑而成。可接受之液體載劑包括植物油、如花生油、棉籽油、芝麻油及其他，以及有機溶劑如可溶性縮醛、甘油等。另外，也可使用水性腸外調和物。植物油為較佳的液體載劑。調和物之製備係將活性組份溶解或懸浮在液體載劑中，如此最終調和物可含有由0.005至20%按重計之活性組份。

本發明化合物之局部應用可經由液體頓服藥或洗髮精之使用，其中含本化合物呈水性溶液劑或懸液劑。這些調和物通常含有助懸劑、如皂土，且通常含有抗起泡劑。含有由0.005至20%按重計活性組份之調和物是可接受的。較佳調和物為含有本化合物0.5至5%按重計者。

本化合物主要可充作抗寄生蟲藥，以治療及／或預防飼養動物中之蠕蟲病、如牛、羊、馬、狗、貓、山羊、豬及家禽。其也可用於預防及治療為如蝨、蟎、虱、蚤等外寄生蟲對動物之寄生蟲感染症。其也可有效地治療人類之寄

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (141)

生虫感染。在治療此種感染症時，本發明化合物可單獨使用或互相組合或與其他不相關之抗寄生虫劑合用。為達最佳結果所需之本化合物劑量依許多因素而定，如動物之種類及體型大小、感染之型式及嚴重度、投藥方法及所使用之化合物。本化合物口服投藥之劑量水平由每公斤動物體重0.005至50毫克，可呈單一劑量或數劑量間隔數天，通常可得良好結果。本發明化合物之一之單一劑量可得良好的控制，然而可給予重覆劑量可對抗再次感染，或用於不尋常持續之寄生虫種類。投予這些化合物至動物之技術為獸醫學領域精藝者已知的。

本發明化合物也可用來對抗農業害虫，彼等侵犯在野地或在穀倉中之農作物。化合物可呈噴霧劑、粉塵、乳劑等型式以用於此種用途，應用至生長中之植物或已收穫之作物上。以此方式施用這些化合物之技術為精於農業技藝人士已知的。

提出以下實例使本發明可更被充份了解，其並不用以限制本發明。

步驟 No. 1: 馬可福亭 A 之產生及分離

種子醱酵過程：

利用經分離的青霉菌 UC 7780 (NRRL 18887) 瓊脂團、貯於液態氮下，接種種子醱酵物。將三團解凍充作接種物。GS-7 由葡萄糖及棉籽粉組成（以“Pharmamedia”商品名由 Traders Protein, Procter & Gamble Oilseed Products Co., Memphis, TN, U.S.A. 出品）。以未添加

五、發明說明(142)

之自來水來水化培養基組份，且培養基以 NH_4OH 調至 pH 7.2。培養基分配至無調節板閉合系統之燒瓶中，每 1000 毫升燒瓶中加入 300 毫升，並在 121°C 下高壓滅菌 30 分。各密閉系統燒瓶含有 300 毫升 GS-7 培養基，其中接種以三團青霉菌 UC 7780 (NRRL 18887) 瓊脂，並在 250 rpm 之旋轉震盪槽中震盪 36 小時， 22°C 。

二次種子醱酵過程：

成熟種子培養物充作接種物於 2 次培養基中，種子比率為 0.3%。二次培養基之組成為每升逆滲透級水中有 25 克葡萄糖-水合物（以 Cerelease 由 C.P.C. International 出品）、25 克棉籽粉（以 "Pharmamedia" 商品名上市）、329.8 毫克 $\text{MgCl}_2 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$ ，11.4 毫克 $\text{MnSO}_4 \cdot \text{H}_2\text{O}$ 、3.2 毫克 $\text{FeSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ ，1.8 毫克 $\text{Na}_2\text{MoO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ ，367.6 毫克 $\text{CaCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ ，84.2 毫克 NaCl ，5.8 毫克 KCl ，0.1 毫克 $\text{ZnSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ ，0.1 毫克 $\text{CoCl}_2 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$ ，3.1 毫克 $\text{CuSO}_4 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$ ，及 0.5 毫升聚矽氧抗起泡劑（以 SAG-471 Antifoam 商品名上市）。足供 200 升二次種子培養基之培養基組份以逆滲透級水水化至 190 升體積，再置 250 升醱酵槽中。於調和後，培養基之 pH 值以 NH_4OH 調至 pH 7.2，再於 121°C 下滅菌 30 分。以成熟的一次種子培養之二個密閉系統燒瓶為接種物，比率為 0.3% 種子。二次種子培養物培育於 22°C ，有 125 slm 通氣，5 psig 反壓及 250 rpm 歷 36 小時。

產製醱酵過程：

五、發明說明 (143)

產製培養基內蜂蜜糖50克、16克魚粉（以 Menhaden Select Fish Meal 商品名上市）、10克酵母浸膏、（以 Fidco 商品名上市）、329.8 毫克 $MgCl_2 \cdot 6H_2O$ 、11.4 毫克 $MnSO_4 \cdot H_2O$ 、3.29 毫克 $FeSO_4 \cdot 7H_2O$ 、1.8 毫克 $Na_2MoO_4 \cdot 2H_2O$ 、367.6 毫克 $CaCl_2 \cdot 2H_2O$ 、84.2 毫克 $NaCl$ 、5.8 毫克 KCl 、0.1 毫克 $ZnSO_4 \cdot 7H_2O$ 、0.1 毫克 $CoCl_2 \cdot 6H_2O$ 、3.1 毫克 $CuSO_4 \cdot 5H_2O$ 、及 0.5 毫升聚矽氧抗起泡劑（以 SAG-471 Antifoam 商品名上市）於每升逆滲透級水中所組成。

足供 5,000 升培養基之培養基組份，以逆滲透級水水化加至 4,700 升，於 5,000 升醱酵槽中。於調和後，培養基之 pH 值以 KOH 調至 pH 7.0，再以 123℃ 滅菌 30 分。以成熟的二次種子培養物為接種物，比率為 1.0% 種子。在 22℃ 下培育、2,500 slm 通氣，5 psig 反壓及 250 rpm 歷 96 小時。

馬可福亭 A 之分離：

4900 升醱酵體積以通過高切力混合器回收至回收容器中。轉移後，加入 4% wt./v. 矽藻土及 1/2 體積之二氯甲烷。回收之溶液再利用過濾壓機過濾。濾塊以 10% 體積二氯甲烷洗二次。

所得之濾液傾析除去水相。留下的富含產物之二氯甲烷相再濃縮至 44 升體積。濃縮物再利用 20% 濃縮體積（9 升）的二氯甲烷及濾器上之矽藻土打光。

53 升經打光之濃縮物再進一步純化以分出馬可福亭 A 及其他組份，利用矽膠層析及結晶作用。

五、發明說明(144)

在層析前，經打光之濃縮物分成4等份。各份在新充填之9"直徑管柱上層析，其製備自25公斤之矽膠（床體積59升）。填料管柱以120升10%丙酮／二氯甲烷，120升20%丙酮／二氯甲烷，120升30%丙酮／二氯甲烷，160升40%丙酮／二氯甲烷，及130升丙酮溶離，收集30及40%溶離液，為20升流份。溶離液以TLC追蹤，利用之溶劑系統含有6%異丙醇及0.3%氫氧化銨於二氯甲烷，以展開Whatman LK6DF矽膠板。馬可福亭A之流份（含有少量馬可福亭D，其可與D共層析）自丙酮中結晶。適合的流份（40-100升）在減壓下濃縮至約5升體積。溶液（或輕淤漿）再轉移至旋轉蒸發器中，並在減壓下繼續濃縮。在濃縮過程中加入數份1升丙酮，直到二氯甲烷完全置換為止。生成之丙酮淤漿（約1升體積）冷藏一夜，並收集馬可福亭A晶體再以數份少量的冷丙酮洗液，並真空乾燥。此種晶體可摻雜有數百分率的馬可福亭D。自二氯甲烷／丙酮（依所述置換二氯甲烷）中重覆再結晶可生成純的馬可福亭A。

馬可福亭D之分離：

4900升醱酵體積通過高切力混合器而回收至回收容器內。轉移後，加入4% wt./v. 矽藻土及1/2體積二氯甲烷。收穫的溶液再利用過濾壓機過濾。濾塊以10%體積的二氯甲烷洗二次。

所得之濾液傾析以移去水相。其餘富含產物之二氯甲烷相再濃縮至44升體積。濃縮物利用20%濃縮體積（9升）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明(145)

之二氯甲烷及濾器上之矽藻土打光。

53升經打光之濃縮物再進一步純化以將馬可福亭A與其他組份分離，利用矽膠層析及結晶法。

層析前，經打光之濃縮物分成約4等份。各份在新充填的9"直徑管柱上層析，以25公斤之矽膠製成的(床體積59升)。填料管柱以120升，10%丙酮/二氯甲烷，120升20%丙酮/二氯甲烷，120升30%丙酮/二氯甲烷，160升40%丙酮/二氯甲烷，及130升丙酮溶離，收集30及40%溶離液，為20升流份。溶離液以TLC追蹤，利用由6%異丙醇及0.3%氫氣化銨/二氯甲烷組成之溶劑系統，以展開Whatman LK6DF矽膠板。含馬可福亭A之馬可福亭D流份予以濃縮。1克此物質溶於甲酸中(20毫升，93%)，並靜置室溫下16小時。於揮發組份在減壓下移去後，殘留物接受矽膠層析(1:20 MeOH: CH₂Cl₂)，生成呈白色固體之馬可福亭D(100毫克)。產物之結構可由NMR光譜及質譜儀証實。C₂₈H₃₅N₃O₃ + H之HRMS (FAB) M/Z [M+H] 估計值為462.2756，實測值為462.2739。

步驟1A馬可福亭A及C之產製及分離。

一次種子醱酵過程：

種子醱酵利用貯於液態氮下之經分離的青霉菌UC 7780 (NRRL 18887) 瓊脂團接種。三團解凍並充作100毫升GS-7種子培養基之接種物。GS-7由葡萄糖及棉籽粉組份(以商品名"Pharmamedia"由Traders Protein, Procter & Gamble Oilseed Products Co., Memphis, TN,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(146)

U.S.A.出品)各自濃度為每升自來水有25克。經調和後，GS-7之pH值以 NH_4OH 調至7.2。培養基以100毫升體積於500毫升無擋板醱酵燒瓶中高壓滅菌30分。無菌的GS-7如上述般接種，並在 23°C 下以250 rpm震盪35-58小時。

產製醱酵過程(震盪槽燒瓶)：

以成熟的種子培養為產製培養基之接種物，種子比率為1%。產製培養基含有45克葡萄糖、25克經酵素水解之酪蛋白(以Peptonized Milk Nutrient商品名由Sheffield Products, Norwich, N.Y., U.S.A.出品)，2.5克酵母浸膏(以BACTO Yeast Extract Code: 0127商品名由Difco Laboratories, Detroit, MI出品)每升的自來水。於調和後，產製培養基利用氫氧化鉀調至pH 7.0。此培養基再以100毫升體積含於500毫升無擋板醱酵燒瓶中高壓滅菌30分。無菌產製培養基如上述般接種，並在 21°C 下以250 rpm震盪7-14天。

產製醱酵過程(實驗室醱酵槽)：

成熟的種子培養充作無菌產製培養基之接種物，比率為0.5%種子。產製培養基如上述。經以 KOH 調至pH 7.0後，此培養基10升於12升實驗室醱酵槽中(New Brunswick Scientific CO., Inc.)高壓滅菌90分。槽中接種0.5%種子，並在 20°C 下以500 rpm攪拌5-9天。空氣流速維持在10-15升/分間。

馬可福亭A及C之分離：

完全的醱酵肉汁(35升)以低速浸泡於一個大的

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (147)

Waring Blender中，再以等體積二氯甲烷拌合。混合物在冷藏中貯存一夜，再接受離心以打破乳劑。生成之澄清二氯甲烷層吸出，並減壓蒸發。殘留物（37.4克）於二氯甲烷之濃縮溶液，填料至矽膠（1公斤）淤漿充填於二氯甲烷之管柱中。管柱以丙酮於二氯甲烷之漸增濃度溶液溶離（10%、20%、30%、40%及50%丙酮）。流份以TLC追蹤，適合的流份再蒸發並自丙酮中結晶可生成馬可福亭A及馬可福亭C。

步驟1B馬可福亭A及C之產製及分離

種子醱酵方法：

種子醱酵利用貯於液態氮之經分離的青霉菌UC 7780 (NRRL 18887) 瓊脂團接種。將三團解凍，並充作100毫升GS-7種子培養基之接種物。GS-7由葡萄糖及棉籽粉組成（以商品名“Pharmamedia”由Traders Protein, Procter & Gamble Oilseed Products Co., Memphis, TN, U.S.A. 出品），各自為每升自來水25克。於調和後，GS-7之pH值以NH₄OH調至pH 7.2。培養基以100毫升體積於500毫升無擋板醱酵燒瓶中高壓滅菌30分鐘。無菌的GS-7如上述般接種，並在23℃下以250 rpm震盪35-58小時。

產製醱酵過程（震盪燒瓶）：

成熟種子培養充作產製培養基之接種物，比率為1%種子。產製培養基含有20克葡萄糖、15毫升甘油、20克棉籽粉（以“Pharmamedia”商品名由Traders Protein, Procter & Gamble Oilseed Products Co., Memphis,

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明(148)

TN, U.S.A.)、10克大豆粉、及3克 K_2HPO_4 ，每升自來水。於調和後，產製培養基之pH值以氫氧化鉀調至pH 6.8。此培養基再以100毫升體積含於500毫升無擋板醱酵燒瓶中高壓滅菌30分。無菌產製培養基如上述般接種，並在21℃下以250 rpm震盪7-14天。

產製醱酵過程（實驗室醱酵槽）：

成熟的種子培養充作無菌產製培養基之接種物、比率為0.5%種子。產製培養基如上述。經以KOH將pH值調至7.0，10升此培養基於12升實驗室醱酵槽中（New Brunswick Scientific Co., Inc.）高壓滅菌90分。此槽接種以0.5%種子，並在20℃下以500 rpm攪拌5-9天。空氣流速維持在10-15升／分之間。

馬可福亭A及C之分離：

全部的醱酵肉汁（35升）以低速浸泡於大的Waring Blender中，再以等體積二氯甲烷摻和。混合物在冷藏下貯存一夜，再接受離心以打破乳劑。生成之澄清二氯甲烷層吸出，並於減壓下蒸發。殘留物（37.4克）於二氯甲烷之濃縮溶液填加至以矽膠（1公斤）淤鑒於二氯甲烷之管柱中。管柱以丙酮於二氯甲烷之漸增濃度溶液溶離（10%、20%、30%、40%及50%丙酮）。流份以TLC追蹤，且適合的流份蒸發並自丙酮中結晶以生成馬可福亭A及馬可福亭C。

14-經取代之馬可福亭之合成。

以碘化氫處理馬可福亭A（式1a，A圖）可產生16 α -碘

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

（裝

訂

（線

五、發明說明 (149)

-17 β -氟基馬可福亭 A 及 16 β -碘-17 α -氟基馬可福亭 A 之混合物 (式 5)，其可以矽膠層析分離。此混合物以氫氧化鉀 / 甲醇脫去碘化氫，可生成 16,17-去氫-17-氟基馬可福亭 A (式 6)，其以二氧化硒氧化生成 17-酮基馬可福亭 A (式 7)。在 C15 及 C16 間引入雙鍵，可由 16 位置之硒化作用 (苯基氧硒基氯及 LDA)、繼以過氧化氫氧化硒中間物而成。接下來消去苯基硒酸生成 15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 8)。此化合物為 14 α -羥基馬可福亭 A 合成中之關鍵中間物 (前者為式 10)，此中可以二個不同的合成路徑中任一者轉代。

於第一路徑中，利用雙 (三甲基矽烷基) 醯胺鉀及 2-苯基磺醯基-3-苯基噁氮丙啶行此物質之 14-位置烯丙基氧化作用，可經由 16-位置之氧化作用生成所需的 14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 9a) 及 14,15-去氫-16-羥基-17-酮基馬可福亭 A (式 9b) 而完成。此二產物以矽膠層析分離。式 9a 化合物利用氫化鋰鉛 / THF 還原，以生成 14 α -羥基馬可福亭 A (式 10)，為本發明揭示之標題化合物。另外，式 8 化合物 (B 圖) 以二氧化硒 / 二噁烷氧化，生成 2:1 的 14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 9a) 及 15,16-去氫-14,17-二酮基馬可福亭 A (式 11) 之混合物。這些可利用矽膠層析分離。這些化合物各自獨立轉化成 14 α -羥基-17-酮基馬可福亭 A (式 12a)：式 9a 化合物以三乙基氫硼化鋰還原 15,16-雙鍵；式 11 化合物以氫硼化鋰還原 14 位置上之羰基。於後一例中，也可產生

五、發明說明(150)

等量的 14β -羥基-17-酮基馬可福亭A(式12b)，其以層析可移去。式12a化合物以硼烷四氫呋喃(THF)複合物還原，生成 14α -羥基馬可福亭A(式10)。

14α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A(式9a，C圖)以三乙基氫硼化鋰還原成 14α -羥基-17-酮基馬可福亭A(式12a)。此利用Swern氧化作用轉形，使用草醯氯及DMSO以生成14,17-二酮基馬可福亭A(式13)。於格利維(Grignard)反應中以甲基鎂化溴處理可產生 14α -羥基- 14β -甲基-17-酮基馬可福亭A(式14a)及 14β -羥基- 14α -甲基-17-酮基馬可福亭A(式14b)之混合物，其可以矽膠層析分離。產物比率依所使用之溶劑而定，二氫甲烷可有6:1比率，而THF有大於50:1比率。以氫化鋰鋁還原式13a化合物可生成 14α -羥基- 14β -甲基馬可福亭A(式15)。

14α -羥基馬可福亭A(式10，D圖)行Swern氧化作用可生成14-酮基馬可福亭A(式16)，其以氫硼化鈉還原生成 14β -羥基馬可福亭A(式17)。以乙基鎂化溴處理14-酮基馬可福亭A(式16)，於格利雅反應中，可生成 14α -羥基-14-乙基馬可福亭A(式19)。以間位-氯過氧基苯甲酸處理 14α -羥基馬可福亭A(式10)產生 14α -羥基馬可福亭A N-氧化物(式18)。 14β -甲基馬可福亭A可利用去羥基作用製備自 14α -羥基- 14β -甲基馬可福亭A。因此， 14α -羥基- 14β -甲基馬可福亭A可在鹼存在下以苯基氯硫逐甲酸酯處理。 14α -羥基- 14β -甲基馬可福亭A之硫逐甲

五、發明說明 (151)

酸酯衍生物以氫化之正丁基錫還原以產生14 β -甲基馬可福亭A。

另外，14 α -羥基馬可福亭A可合成自馬可福亭A (E圖)。
以碳酸氫鈉及碘於四氫呋喃水溶液處理馬可福亭A，可產生17-酮基馬可福亭A (式7)，其利用LDA及苯基化二硫行二次磺醯化可生成16-二硫苯基-17-酮基馬可福亭A (式20，E圖)，自馬可福亭A之產率為60%。以間位-氯過氧基苯甲酸氧化可產生16-硫苯基-16-亞砷基苯基-17-酮基馬可福亭A (式21)，其在迴流之甲苯中消去生成15,16-去氫-16-硫苯基-17-酮基馬可福亭A (式22)。接下來以間位-氯過氧基苯甲酸處理，可產生15,16-去氫-16-亞砷基苯基-17-酮基馬可福亭A (式23)，其利用二乙胺於甲醇中行重排，可產生15,16-去氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A (式9a)。

14 α -羥基-45 α -甲基馬可福亭A (式35，G圖)可合成自15,16-去氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A (式9a，G圖)。因此，15,16-去氫-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A (式9a)以甲基鎂化溴或二甲基銅鋰處理，可產生15 α -甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A (式34)，以硼烷-二甲硫複合物還原可產生15 α -甲基-14 α -羥基馬可福亭A (式35)。15 α -甲基-14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A (式34)以草醯氯及DMSO行Swern氧化作用轉形成15 α -甲基-14,17-二酮基馬可福亭A (式36)。在格利反應中以甲基鎂化溴處理可產生15 α -甲基-14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (152)

馬可福亭 A (式 37) , 其以硼烷 - 二甲硫複合物還原, 產生 15 α -甲基-14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 A (式 38)。

先前所述的這些步驟可用來產生 14- 經取代之馬可福亭 B、C 及 D 衍生物。

16- 碘-17-氟基馬可福亭 A 呈非對映立體異構物混合物型式般製備 (式 5)

固體碘化氟 (11.7 克, 76.5 毫莫耳) 加至馬可福亭 A (10.5 克, 22 毫莫耳) 於 CHCl_3 (150 毫升) 之溶液, 且反應混合物迴流加熱直到所有的馬可福亭 A 消耗 (約 5 小時)。生成之黑色溶液冷卻至室溫, 以 CH_2Cl_2 稀釋 (100 毫升)、以飽和的 NaHCO_3 洗滌, 再以 Na_2SO_3 溶液洗滌。有機相分出, 於 MgSO_4 上乾燥, 並濃縮至乾。生成之粗製固體接受矽膠層析 (3:2-EtOAc:己烷) 可生成 16- 碘-17-氟基馬可福亭 A (12.5 克, 90%), 為白色粉末固體。產物結構可由核磁共振光譜及質譜儀証實。

16,17-去氫-17-氟基馬可福亭 A 之製備 (式 6)

16- 碘-17-氟基馬可福亭 A (9.5 克, 15 毫莫耳) 溶於 MeOH (150 毫升), 並加入 KOH 水溶液 (45%, 3 毫升)。反應混合物在室溫下攪拌 2 小時。加水且生成之白色沈澱以過濾收集, 以水洗並真空下乾燥一夜以生成 16,17-去氫-17-氟基馬可福亭 A (6.6 克, 75%) 為白色粉末。產物結構可由核磁共振光譜及質譜儀証實。MS (FAB) M/Z $[M+H]^+$: 501。

17-酮基馬可福亭 A 之製備 (式 7)

五、發明說明 (153)

二氧化硒 (2.9 克, 26 毫莫耳) 加至 16,17-去氫-17-氟基馬可福亭 A (6.0 克, 10 毫莫耳) 於 95% EtOH (100 毫升) 之溶液中, 且反應混合物在室溫下攪拌 2 小時。反應加飽和的 NaHCO_3 (100 毫升) 中止。生成的混合物以 CH_2Cl_2 萃取 (2×200 毫升)。萃取物混合, 乾燥 (MgSO_4) 並濃縮以生成 7 克粗製的產物。此物質以矽膠層析 (EtOAc) 純化可生成 17-酮基馬可福亭 A (3.6 克, 75%) 為白色固體。產物的結構由核磁共振光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z $[M+H]$ 估計 $\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{N}_3\text{O}_5+H$: 492.2498; 實測值: 492.2478。

另外且較好的, 標題化合物可利用對位-甲苯磺酸合成。因此, 對位-甲苯磺酸-水合物 (1 克) 加至 16,17-去氫-17-氟基馬可福亭 A (10 克) 於 95% MeOH (50 毫升) 之溶液中, 且反應混合物在室溫下攪拌 1 小時。三乙基胺 (2 毫升) 加至混合物中, 並蒸發溶劑。殘留物以 10% 碳酸鈉水溶液 (100 毫升) 研磨, 固體過濾並乾燥以生成呈固體之標題產物 (90% 產率)。產物之結構可由核磁共振光譜及質譜儀証實。

15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A 之製備 [式 8]

二異丙基醯胺鋰之溶液製備自正丁基鋰 (1.6M, 9.9 毫升, 15.4 毫莫耳) 於己烷, 及二異丙胺 (2.2 毫升, 15.7 毫莫耳)。此以無水四氫呋喃稀釋 (THF, 20 毫升), 並冷卻至 -78°C 。逐滴加入 17-酮基馬可福亭 A (2.0 克, 4.1 毫莫耳) 於無水 THF (20 毫升) 之溶液, 令反應加溫

五、發明說明 (154)

至 -40°C 歷 1 小時。混合物再次冷卻至 -78°C ，並以苯基硒化氫 (19 毫克, 5.2 毫莫耳) 於 THF (10 毫升) 處理。5 分鐘後，反應以飽和的 NaHCO_3 中止，以 CH_2Cl_2 萃取、乾燥 (MgSO_4) 並濃縮以生成黃色固體，其可使用勿需再純化。此物質溶於 THF (150 毫升) 並以 H_2O_2 (30%, 1.5 毫升) 在 0°C 下處理。冷卻浴移去且反應混合物在室溫下攪拌 30 分。反應加 NaOH 中止 (1N, 100 毫升)。混合物以 CH_2Cl_2 萃取 (2×200 毫升)。萃取物混合，乾燥 (MgSO_4) 並濃縮生成粗製產物。此物質以矽膠層析純化 (EtOAc) 可生成 15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (1.3 克, 65%) 為白色固體。產物結構以核磁共振光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z $[M+H]$ 估計 $\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_5 + \text{H}$: 490.2342; 實測值: 490.2345。

14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 9a) 利用噁氮丙啶化學製備

雙 (三甲基矽烷基) 醯胺鉀於甲苯 (0.5M, 1 毫升, 0.5 毫莫耳) 之溶液，逐滴加至 15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (66 毫克, 0.14 毫莫耳) 於 THF (2 毫升) 在 -78°C 下之溶液中。生成之淺黃色、混沌溶液令其加溫至 -40°C 歷 1 小時。反應混合物冷卻至 -78°C 、攪拌 15 分，再以逐滴加入 2-苯基磺醯基-3-苯基噁氮丙啶 (42 毫克, 0.16 毫莫耳) 於 THF (2 毫升) 之溶液而處理。混合物攪拌 5 分鐘，之後反應加 NaHCO_3 中止之。混合物以 CH_2Cl_2 (2×25 毫升) 萃取。萃取物混合、乾燥 (MgSO_4) 並濃縮生成粗製物質

五、發明說明 (155)

。此以製備式薄層層析純化 (矽膠, EtOAc) 以生成 14 α -
 羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (8 毫克, 12%), 為
 白色固體。結構可由核磁共振光譜及質譜儀証實。HRMS
 (FAB) M/Z [M+H] 估計 C₂₈H₃₁N₃O₆+H: 506.2291; 實測值
 : 506.2280。自此層中也可得到 14,15-去氫-16-羥基
 -17-酮基馬可福亭 A (14 毫克, 20%)。其結構可由核磁共振
 光譜証實。

14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 9a)、15,16-去氫-14,17-二酮基馬可福亭 A (式 11) 及 14,15-去氫-16,17-二酮基馬可福亭 A (式 20) 利用二氧化硒製備

15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (1.29 克, 2.6 毫莫耳)
) 溶於對位-二噁烷 (30 毫升) 中, 再以二氧化硒 (390
 毫克) 處理。混合物迴流 1 小時, 溶劑再真空蒸發。殘留
 物以二氯甲烷 (30 毫升) 研磨並過濾。濾液濃縮, 殘留物
 接受矽膠層析 (1:2 MeOH: EtOAc) 以生成 14 α -羥基-15,
 16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (430 毫克, 32%) 呈固體。也
 可自層析中得到 15,16-去氫-14,17-二酮基馬可福亭 A (
 式 11, 212 毫克, 16%)。自層析中也可得 14,15-去氫-16,
 17-二酮基馬可福亭 A (式 24, 106 毫克, 8%)。這些產
 物之結構可由核磁共振及質譜儀証實。

轉化 14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 9a) 至
 15,16-去氫-14,17-二酮基馬可福亭 A (式 11)

14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (60 毫克,
 式 9a) 溶於二氯甲烷 (10 毫升), 並以二氧化鎂 (60 毫克)

五、發明說明 (156)

處理。混合物在室溫下攪拌1小時再濃縮。殘留物在矽膠上行製備式薄層層析(50%二氯甲烷/EtOAc)可生成15, 16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭A式11, 35毫克, 60%)。這些產物之結構可由核磁共振光譜及質譜儀証實。

實例1 14 α -羥基馬可福亭A之製備(式10)

14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A(20毫克, 0.040毫莫耳)溶於THF(5毫升),並以氫化鋰鉛(1M, 0.11毫升, 0.11毫莫耳)於THF之溶液在0℃下處理。混合物在0℃攪拌0.5小時,之後加入NaHCO₃溶液(10%)。混合物以CH₂Cl₂萃取(2×10毫升)。萃取物混合,乾燥(MgSO₄)並蒸發溶劑。殘留物在矽膠上行製備式薄層層析(10% MeOH/EtOAc)可生成14 α -羥基馬可福亭A(3毫克, 15%)為白色固體。產物的結構可由核磁共振光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z [M+H]估計值C₂₈H₃₅N₃O₅+H: 494.2655, 實測值: 494.2653。

自14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A(式9a)製備14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A(式12a)

14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A(50毫克, 0.1毫莫耳)溶於THF(5毫升),再於-78℃下以三乙基氫硼化鋰於THF(1M, 0.7毫升)之溶液處理。混合物在-78℃下攪拌0.5小時。反應加MeOH(1毫升)中止,混合物再濃縮。生成之固體接受矽膠層析(1:20 MeOH: CH₂Cl₂)可生成14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A(43毫克, 86%)為白色固體。產物之結構以NMR光譜及質譜儀証實。

五、發明說明(157)

HRMS (FAB) M/Z [M+H]估計值 $C_{28}H_{33}N_3O_6 + H$: 508.2447,

實測值 : 508.2437。

自 15,16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 A(式 11) 製備 14 α -
- 羟基-17-酮基馬可福亭 A(式 12a)

15,16-去氫-14, 17-二酮基馬可福亭 A (470 毫克, 0.93 毫莫耳) 溶於 THF 中, 並在室溫下以氫硼化鋰於 THF (1M, 2 毫升) 之溶液處理。混合物攪拌 2 小時, 之後加入 $NaHCO_3$ 溶液 (10%)。混合物以 CH_2Cl_2 萃取 (2×20 毫升)。萃取物混合、乾燥 ($MgSO_4$) 且溶劑蒸發。殘留物含有二種差向異構物之混合, 其可以矽膠層析容易地分離 (1:20 MeOH: EtOAc), 分別為 14 α -羟基-17-酮基馬可福亭 A (90 毫克, 19%) 及 14 β -羟基-17-酮基馬可福亭 A (94 毫克, 20%)。二產物之結構可由 NMR 光譜及質譜儀証實。

自 14 α -羟基-17-酮基馬可福亭 A(式 12a) 製備 14 α -羟基
馬可福亭 A(式 10)

14 α -羟基-17-酮基馬可福亭 A (413 毫克, 0.81 毫莫耳) 溶於 THF (20 毫升), 並以甲硼烷 THF 複合物於 THF 之溶液 (1M, 2.43 毫升) 在 0℃ 下處理。混合物攪拌 2.25 小時。混合物攪拌 0.5 小時, 之後加入 MeOH (3 毫升)。於溶劑蒸發後, 殘留物接受矽膠層析 (1:16 MeOH: EtOAc) 生成 14 α -羟基馬可福亭 A (250 毫克, 92% 產率依回收之起始物計) 及 14 α -羟基-17-酮基馬可福亭 A (起始物, 140 毫克, 34%)。

14,17-二酮基馬可福亭 A 之製備 (式 13)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(158)

草酸氮(40微升)於無水 CH_2Cl_2 (5毫升)之溶液,以二甲亞砜(45微升)在 -78°C 下處理。混合物在 -78°C 下攪拌1小時。逐滴加入14 α -羥基-17-酮基馬可福亭A(27毫克)於 CH_2Cl_2 之溶液。反應混合物在 -78°C 下攪拌20分。加三乙胺(0.3毫升)至反應混合物中,再以20分鐘令其加溫至室溫。混合物分配於10% Na_2CO_3 (10毫升)及 CH_2Cl_2 (10毫升)之間。有機層乾燥(MgSO_4)並濃縮。殘留物接受矽膠層析(1:20 MeOH: CH_2Cl_2)可生成14,17-二酮基馬可福亭A(22毫克,80%)為白色固體。產物結構可由NMR光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z [M+H]估計值 $\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_5+\text{H}$: 506.2291; 實測值: 506.2280。

14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A之製備(式14a)

14,17-二酮基馬可福亭A(16毫克,0.032毫莫耳)於 CH_2Cl_2 (5毫升)之溶液,在 -78°C 下以 -78°C 之甲基鎂化溴(3M,0.16毫升,0.48毫莫耳)於 Et_2O 之溶液處理。生成之混合物在 -78°C 下攪拌0.5小時。反應加10% Na_2CO_3 (數滴)中止。混合物以 CH_2Cl_2 (10毫升)稀釋,乾燥(MgSO_4)並濃縮。殘留物接受矽膠層析(1:20 MeOH: CH_2Cl_2)以生成14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A(8毫克,50%, $R_f=0.25$)為白色固體。產物結構可由NMR光譜後質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z [M+H]估計 $\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{N}_3\text{O}_5+\text{H}$: 522.2604; 實測值: 522.2620。自層中也可得14 β -羥基-14 α -甲基-17-酮基馬可福亭A(1.2毫克

五、發明說明 (159)

克，7%， $R_f=0.4$) 為白色固體。產物的結構可由NMR光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) $M/Z [M+H]$ 估計 $C_{29}H_{35}N_3O_5+H$: 522.2604; 實測值: 522.2630如此得到之產物比率6:1增加至50:1，且產率於THF取代 CH_2Cl_2 充作反應溶劑時可增加至80%。

實例2: 製備14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A(式15)

14 α -羥基-14 β -甲基-17-酮基馬可福亭A (5毫克，0.01毫莫耳) 於THF (5毫升) 之溶液，以氫化鋁鋁 (1M，0.03毫升，0.03毫莫耳) 於THF之0℃溶液處理。混合物在0℃下攪拌0.5小時，之後加入 $NaHCO_3$ 溶液 (10%)。混合物以 CH_2Cl_2 萃取 (2×5毫升)。萃取物混合，乾燥 ($MgSO_4$)，溶劑再蒸發。殘留物在矽膠上 (1:20 MeOH: CH_2Cl_2) 行製備式薄層層析，可生成14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A (2毫克，40%)。產物結構可由NMR光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) $M/Z [M+H]$ 估計 $C_{29}H_{37}N_3O_5+H$: 508.2811，實測值: 508.2816。

14-酮基馬可福亭A之製備 (式16)

草酸氯 (150微升) 於無水 CH_2Cl_2 (20毫升) 之溶液以DMSO (170微升) 在-78℃下處理。混合物在-78℃下攪拌1小時。逐滴加入14 α -羥基馬可福亭A (110毫克) 於 CH_2Cl_2 (5毫升) 之溶液。反應混合物在-78℃下攪拌20分。加三乙胺 (1毫升) 至反應混合物中，再令其以20分加熱至室溫。混合物分配於10% Na_2CO_3 (20毫升) 及 CH_2Cl_2 (20毫升) 之間。有機層乾燥 ($MgSO_4$) 並濃縮。殘

五、發明說明 (160)

留物接受矽膠層析 (1:25 MeOH: CH₂Cl₂) 可生成 14-酮基馬可福亭 A (82 毫克, 75%) 為白色固體。產物的結構可由 NMR 光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z [M+H] 估計 C₂₈H₃₃N₃O₅+H: 492.2498, 實測值: 492.2510。

實例 3: 製備 14β-羟基馬可福亭 A (式 17)

14-酮基馬可福亭 A (10 毫克) 於 MeOH (2 毫升) 之溶液, 在 0℃ 下以氫硼化鈉 (5 毫克) 處理。混合物在 0℃ 下攪拌 0.5 小時, 之後加入 NaHCO₃ 溶液 (10%)。混合物以 CH₂Cl₂ 萃取 (2×10 毫升)。萃取物混合、乾燥 (MgSO₄)、溶劑再蒸發。殘留物在矽膠 (1:16 MeOH: EtOAc) 上行製備式薄層層析可生成 14β-羟基馬可福亭 A (5 毫克, 50%)。產物結構可由 NMR 光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z [M+H] 估計 C₂₈H₃₅N₃O₅+H: 494.2655; 實測值: 494.2653。

實例 4: 製備 14α-羟基馬可福亭 A N-氧化物 (式 18)

14α-羟基馬可福亭 A (15 毫克) 於 CH₂Cl₂ (3 毫升) 之溶液, 以間位-氯過氧苯甲酸 (15 毫克) 在 0℃ 下處理。混合物在 0℃ 下攪拌 0.5 小時後, 以三乙胺 (30 微升) 處理再濃縮。殘留物在矽膠 (1:8 MeOH: CH₂Cl₂) 上行製備式薄層層析, 可生成 14α-羟基馬可福亭 A N-氧化物 (12 毫克, 80%)。產物之結構以質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z [M+H] 估計值 C₂₈H₃₅N₃O₆+H: 510.2604; 實測值: 510.2615。

實例 5: 製備 14α-羟基-14β-乙基馬可福亭 A (式 19)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(線)

五、發明說明 (161)

14-酮基馬可福亭 A (25毫克, 0.05毫莫耳) 於 THF (5毫升) 之溶液, 在 -78°C 下以 -78°C 之乙基鎂化溴 (3M, 0.15毫升, 0.45毫莫耳) 於 Et_2O 之溶液處理。生成之混合物在 -78°C 下攪拌 0.5 小時。令反應混合物在 20 分鐘內加溫至室溫。反應加 10% Na_2CO_3 (數滴) 中止。混合物以 CH_2Cl_2 (10毫升) 稀釋、乾燥 (MgSO_4) 再濃縮。殘留物接受矽膠層析 (1:20, $\text{MeOH}:\text{CH}_2\text{Cl}_2$) 可生成 14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A (10毫克, 45%) 為白色固體。產物之結構可由 NMR 光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z [M+H] 估計值 $\text{C}_{30}\text{H}_{39}\text{N}_3\text{O}_5 + \text{H}$: 522.2968; 實測值: 522.2983。

自 14 α -羥基-14 β -乙基馬可福亭 A 製備 14 β -甲基馬可福亭 A

雙 (三甲基矽烷基) 醯胺於甲苯 (0.5M, 1 毫升, 0.5 毫莫耳) 之溶液, 在 -78°C 下逐滴加至 14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 A (66毫克, 0.14毫莫耳) 於 THF (2毫升) 之溶液中。生成的淺黃色混濁溶液令其在 1 小時間加溫至 -40°C 。反應混合物再冷卻至 -78°C , 攪拌 15 分, 再以苯基氯硫逐甲酸酯 (0.094毫升, 0.7毫莫耳) 於 THF (2毫升) 之溶液逐滴加入處理之。10 分鐘後移去乾冰浴。再反應 3 小時後, 反應加 NaHCO_3 中止。混合物以 CH_2Cl_2 (2×25 毫升) 萃取。萃取物混合、乾燥 (MgSO_4), 並濃縮生成粗製物質。將其以製備式薄層層析 (矽膠, EtOAc) 純化可生成 14 α -O-苯氧基硫代羰基-14 β -甲基馬可福亭 A。

五、發明說明 (162)

對 14α -0-苯氧基硫代羰基- 14β -甲基馬可福亭 A (64 毫克, 0.1 毫莫耳) 於甲苯 (5 毫升) 之溶液, 加入 AIBN (3.3 毫克), 再加氯化三丁錫 (54 微升, 0.2 毫莫耳)。混合物迴流 3 小時。於溶劑蒸發後, 殘留物以製製式薄層層析純化 (矽膠, EtOAc) 可生成 14β -甲基馬可福亭 A。結構可由核磁共振光譜及質譜儀証實。

17-酮基馬可福亭 A (式 7, E 圖) 之另一合成法

在馬可福亭 A (65 克, 0.136 莫耳) 及碳酸氫鈉 (137 克, 1.63 莫耳) 於四氫呋喃 (THF, 2 升) 及水 (1.25 升) 在迴流中, 以 1 小時期逐滴加入在 THF (1.25 升) 中之碘 (206 克, 0.81 莫耳)。(另外, 混合物可在室溫下攪拌 16 小時)。令其緩慢冷卻至環境溫度 (2.5 小時) 後, 反應加飽和的硫代硫酸鈉 ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$, 1.5 升) 中止, 再以乙酸乙酯 (2×1 升) 萃取。混合的有機層以飽和的硫代硫酸鈉 (1 升) 洗滌、乾燥 (MgSO_4)、過濾、蒸發並於真空烘箱中 (65°C) 乾燥一夜, 生成 62 克粗製的 17-酮基馬可福亭 A (式 7), 為黃色固體。 ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 7.68 (s, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.32 (d, 1H), 4.90 (d, 1H), 3.75 (q, 2H), 3.23 (t, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.80 (d, 1H), 2.65 (d, 1H), 2.49-2.21 (m, 2H), 2.08 (d, 1H), 1.98-1.45 (m, 5H), 1.46 (s, 3H), 1.44 (s, 3H), 1.09 (s, 3H), 0.90 (s, 3H)。

另外, ICl 可取代碘使用。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

線

五、發明說明 (163)

合成 16-二硫苯基-17-酮基馬可福亭 A (式 20)

粗製的 17-酮基馬可福亭 A (5 克, 10.2 毫莫耳) 經由在 -78°C 下在 THF (150 毫升) 中之導管加至 LDA 溶液中, 其製備係在 0°C 下將 $n\text{-BuLi}$ (1.6M, 24.8 毫升, 0.04 莫耳) 逐滴加至二異丙胺 (5.7 毫升, 0.041 莫耳) 於 THF (100 毫升) 中。反應混合物以 1 小時緩慢加溫至 -50°C 。生成之混純紅棕色混合物再以苯基化二硫 (4.4 克, 0.02 莫耳) 處理。反應立即以飽和的碳酸氫鈉溶液 (100 毫升) 中止, 並以二氯甲烷萃取 (CH_2Cl_2 , 300 毫升)。有機相乾燥 (MgSO_4)、濃縮 (8 克) 並在矽膠上層析 (120 克, 60% 乙酸乙酯/己烷為溶離劑) 可生成標題化合物, 為摻白色固體 (4.4 克, 61% 自馬可福亭 A)。FAB-MS 708 ($\text{M}^+ + \text{H}$); ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.74(s, 1H), 7.71(d, 2H), 7.64(d, 2H), 7.45-7.30(m, 6H), 6.81(d, 1H), 6.72(d, 1H), 6.32(d, 1H), 4.91(d, 1H), 3.70(q, 2H), 3.16(t, 1H), 3.01(s, 3H), 2.75(d, 1H), 2.53(dt, 1H), 2.35(dt, 1H), 2.15-1.50(m, 5H), 1.47(s, 3H), 1.45(s, 3H), 1.06(s, 3H), 0.82(s, 3H)。

合成 16-硫苯基-16-亞砷基-苯基-17-酮基馬可福亭 A (式 21)

在 -78°C 、氮大氣下, 對 16-二硫苯基-17-酮基馬可福亭 A (10 克, 14 毫莫耳) 於 CH_2Cl_2 (250 毫升) 中, 以 15 分鐘逐滴加入於 CH_2Cl_2 (200 毫升) 中之間位-氯過氧苯甲

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(錄)

五、發明說明(164)

酸 (m-CPBA, 64%, 4.2 克, 15.5 毫莫耳)。反應立即以飽和的硫代硫酸鈉 (200 毫升) 中止, 以飽和的 NaHCO_3 (200 毫升) 稀釋, 並以 CH_2Cl_2 (200 毫升) 萃取。乾燥 (MgSO_4), 再減壓濃縮生成 11 克粗製的 16-硫苯基-16-亞磺基苯基-17-酮基馬可福亭 A (式 21)。 ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.0-7.29(m, 11H), 6.80(d, 1H), 6.70(d, 1H), 6.31(d, 1H), 4.90(d, 1H), 3.68(d, 1H), 3.41(d, 1H), 3.14(t, 1H), 3.07(s, 3H), 2.82(dt, 1H), 2.80-2.65(m, 2H), 2.16(dt, 1H), 2.05-1.1(m, 4H), 1.47(s, 3H), 1.43(s, 3H), 0.96(s, 3H), 0.83(s, 3H)。

合成 16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 22)

粗製的 16-硫苯基-16-亞磺基苯基-17-酮基馬可福亭 A (式 21, 11 克) 於甲苯 (250 毫升) 中迴流 45 分, 冷卻至室溫, 以飽和的碳酸氫鈉 (300 毫升) 稀釋, 再以 EtOAc 萃取 (300 毫升)。有機層乾燥 (MgSO_4) 並濃縮以生成 10.6 克粗製的 16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 22)。FAB-MS 598 ($\text{M}^+ + \text{H}$); HRMS M/Z ($\text{M}^+ + \text{H}$, $\text{C}_{34}\text{H}_{35}\text{N}_3\text{O}_5\text{S} + \text{H}_1$), calc. 598.2376, obsd. 598.2387. ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.18(s, 1H), 7.55-7.45(m, 2H), 7.29-7.45(m, 3H), 6.83(d, 1H), 6.70(d, 1H), 6.34(d, 1H), 5.92(dt, 1H), 4.91(d, 1H), 3.87(q, 2H), 3.30(dd, 1H), 3.21(t, 1H), 3.08(s, 3H), 2.80(d, 1H), 2.35(dd, 1H), 2.10(d,

五、發明說明(165)

1H), 2.03(dd, 1H), 1.78(dd, 1H), 1.46(s, 3H),

1.44(s, 3H), 1.11(s, 3H), 0.88(s, 3H)。

合成 16-亞砒基苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A(式 23)

對粗製的 16-硫苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A(式 22, 10.6克) 於二氯甲烷 (300 毫升), 在 -78℃ 下逐滴加入於 CH₂Cl₂ (125 毫升) 中之 m-CPBA (64%, 2.8克)。反應加飽和的硫代硫酸鈉 (300 毫升) 中止, 並加飽和的碳酸氫鈉 (300 毫升), 以二氯甲烷萃取 (300 毫升)。有機層乾燥 (MgSO₄)、過濾及濃縮可生成 13 克粗製的 16-亞砒基苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 23)。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) 7.75-7.3(m, 5H), 6.81(s, 1H), 6.75-6.6(m, 2H), 6.31(d, 1H), 4.90(d, 1H), 3.78-3.58(m, 2H), 3.22(t, 1H), 2.98(s, 3H), 2.88-2.45(m, 2H), 2.12-1.55(m, 5H), 1.46(s, 3H), 1.44(s, 3H), 1.12(s, 3H), 0.88(s, 3H)。

合成 14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A(式 9a) 自 16-亞砒基苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 23)

對粗製的 16-亞砒基苯基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭 A (式 23, 13克) 於 MeOH 水溶液 (10/1, 300 毫升) 加入二乙胺 (15 毫升)。經迴流 0.5 小時, 反應混合物冷卻至室溫, 以水稀釋 (450 毫升), 再以 CH₂Cl₂ 萃取 (500 毫升)。乾燥 (MgSO₄), 繼以濃縮, 再行矽膠層析 (130 克, 30% 丙酮 / CH₂Cl₂ 為溶離劑) 可產生 14 α -羥基-15, 16-

五、發明說明(166)

去氫-17-馬可福亭A(式9a, 3.6克, 50%產率自16-硫苯基-17-酮基馬可福亭A計)呈白色固體。

實例6. 合成14 α -羥基-N(1)-嗎福啉基羰基馬可福亭A(式25)

氫化鉀(70毫克的50%油分散相)加至14 α -羥基馬可福亭A(30毫克)於3毫升無水四氫呋喃之溶液中。溶液在室溫下攪拌1小時,再分配於5%碳酸氫鈉水溶液(3微升)及二氯甲烷(3毫升)間。分相,且水相以二氯甲烷萃取(3毫升)。混合的萃取物於硫酸鎂上乾燥,過濾、並真空下蒸發。殘留物在矽膠板上行製備式薄層層析,以5%甲醇/二氯甲烷溶離可生成14 α -羥基-N(1)-嗎福啉基羰基馬可福亭A(15毫克)。HRMS (FAB) M/Z [M+H]⁺估計C₃₃H₄₂N₄O₇ +H: 607.3132;實測值: 607.3153。

實例7. 合成14 α -乙醯氧基馬可福亭A(式26)

14 α -羥基馬可福亭A(50毫克)溶於乙腈/二氯甲烷(4毫升/2毫升)。此溶液以醋酐(50微升)、三乙胺(50微升)及4-二甲基胺吡啶(20毫克)處理。混合物迴流1小時,再冷卻至室溫。將之於室溫下攪拌16小時,再分配於5%碳酸氫鈉水溶液(3毫升)及二氯甲烷(3毫升)之間。分層,水層以二氯甲烷萃取(3毫升)。混合的有機萃取物於硫酸鎂上乾燥,過濾並真空蒸發。殘留物在矽膠板上行製備式薄層層析,以2.5%甲醇/二氯甲烷溶離可生成14 α -乙醯氧基馬可福亭A(30毫克)。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) 8.70(s, NH), 6.80(d, J=8.1 Hz, C₄-H),

五、發明說明(167)

6.68(d, J=8.1 Hz, C₅-H), 6.37(d, J=7.7 Hz, C₂₄-H), 5.44(t, J=2.5 Hz, C₁₄-H), 4.92(d, J=7.7 Hz, C₂₅-H), 3.75(d, J=11.8 Hz, 1 C₁₂-H), 3.12(s, 3H, N-Me), 3.04(t, J=10.2 Hz, C₂₀-H), 2.6-2.8(m, 2H), 2.5-2.1(m, 3H), 2.16(s, 3H, O-乙醯基), 2.0-1.5(m, 4H), 1.44(s, 6H, C₂₇-H & C₂₈-H), 1.12(s, 3H), 0.88(s, 3H)。

實例 8. 合成 14 α -O-乙氧羰基胺基羰基馬可福亭 A(式 27)

14 α -羥基馬可福亭 A (33毫克) 溶於乙腈 / 二氯甲烷 (2 毫升 / 1 毫升) 中。此溶液以乙酸乙氧羰基酯 (30微升) 處理。混合物在室溫下攪拌 1 小時，再濃縮。殘留物在矽膠板上行製備式層析，以 5% 甲醇 / 二氯甲烷溶離，可生成 14 α -乙氧羰基胺基羰基馬可福亭 A (25毫克)。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) 8.80(br, 1H, NH), 7.50(s, NH), 6.80(d, J=8.1 Hz, C₄-H), 6.68(d, J=8.1 Hz, C₅-H), 6.37(d, J=7.7 Hz, C₂₄-H), 5.42(t, J=2.5 Hz, C₁₄-H), 4.92(d, J=7.7 Hz, C₂₅-H), 4.24(q, 2H, J=7.1 Hz, O-CH₂), 3.72(d, J=11.8 Hz, 1 C₁₂-H), 3.13(s, 3H, N-Me), 3.08(t, J=10.2 Hz, C₂₀-H), 2.6-2.8(m, 2H), 2.5-2.1(m, 5H), 2.0-1.5(m, 5H), 1.44(s, 6H, C₂₇-H & C₂₈-H), 1.28(t, 3H, J=7.1 Hz, OCH₂-CH₃), 1.12(s, 3H), 0.88(s, 3H)。

實例 9. 合成 14 α -羥基-N(1)-乙醯基馬可福亭 A(式 28)

氫化鉀 (70毫克之 50% 油分散相) 加至 14 α -羥基馬可福

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(168)

亭 A (40 毫克) 於 3 毫升無水四氫呋喃之溶液中。溶液在室溫下攪拌 1 小時，再加醋酐 (50 微升)。混合物在室溫下攪拌 1 小時，再分配於 5% 碳酸氫鈉水溶液 (3 毫升) 及二氯甲烷 (3 毫升) 中。分相，水相以二氯甲烷萃取 (3 毫升)。混合的萃取物於硫酸鎂上乾燥，過濾並真空蒸發。殘留物在矽膠板上行製備式層析，以 5% 甲醇 / 二氯甲烷溶離，可生成 14 α -羥基-N(1)-乙醯基馬可福亭 A (10 毫克)。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 6.88 (q, $J=8.1$ Hz, $\text{C}_4\text{-H}$ & $\text{C}_5\text{-H}$), 6.37 (d, $J=7.7$ Hz, $\text{C}_{24}\text{-H}$), 4.09 (br, $\text{C}_{14}\text{-H}$), 4.86 (d, $J=7.7$ Hz, $\text{C}_{25}\text{-H}$), 3.23 (d, $J=11.3$ Hz, 1 $\text{C}_{12}\text{-H}$), 3.11 (s, 3H, N-Me), 3.0-1.5 (m, 12H), 2.61 (s, 3H, N-乙醯基), 1.44 & 1.46 (2s, 6H, $\text{C}_{27}\text{-H}$ & $\text{C}_{28}\text{-H}$), 1.08 (s, 3H), 0.82 (s, 3H)。

實例 10. 合成 14 α -O-(10-十一醯基) 馬可福亭 A (式 29)

14 α -羥基馬可福亭 A (33 毫克) 溶於乙腈 / 二氯甲烷 (4 毫升 / 2 毫升)。溶液以 10-十一醯基氯 (40 微升)、三乙胺 (40 微升) 及 4-二甲胺吡啶 (18 毫克) 處理。混合物迴流 16 小時，再冷卻至室溫。將之分配於 5% 碳酸氫鈉水溶液 (3 毫升) 及二氯甲烷 (3 毫升) 中。分相，水相以二氯甲烷萃取 (3 毫升)。混合的萃取物於硫酸鎂上乾燥、過濾、並在真空下蒸發。殘留物在矽膠板上行製備式層析，以 5% 甲醇 / 二氯甲烷溶離，可生成 14 α -O-(10-十一醯基) 馬可福亭 A (7 毫克)。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.42 (s, NH), 6.80 (d, $J=8.1$ Hz, $\text{C}_4\text{-H}$), 6.68 (d,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(線

五、發明說明(169)

$J=8.1$ Hz, C_5-H), $6.35(d, J=7.7$ Hz, $C_{24}-H$),
 $5.78(m, 1H)$, $5.44(br, C_{14}-H)$, $4.89-5.0(m, 3H)$,
 $3.74(d, J=11.8$ Hz, $1 C_{12}-H$), $3.12(s, 3H, N-Me)$,
 $3.05(t, J=10.2$ Hz, $C_{20}-H$), $2.6-2.8(m, 2H)$,
 $2.9-1.2(m, 28H)$, $1.44(s, 6H, C_{27}-H \text{ \& } C_{28}-H)$,
 $1.11(s, 3H)$, $0.82(s, 3H)$ 。

實例 11. 製備 14α -羥基- 14β -乙烯基馬可福亭 A (式 30)

14 -酮基馬可福亭 A (200 毫克, 0.4 毫莫耳) 於 THF (5 毫升) 在 -78°C 之溶液, 以乙烯基鎂化溴 (1M, 4.0 毫升, 4 毫莫耳) 於 THF 之溶液處理。生成之混合物在 -78°C 下攪拌 2 小時, 並加溫至室溫。將其在室溫下攪拌 2 小時。反應加 10% Na_2CO_3 (3 毫升) 中止。混合物以 CH_2Cl_2 (30 毫升) 稀釋, 以飽和的氯化銨溶液洗滌, 乾燥 (MgSO_4) 再濃縮。殘留物接受矽膠層析 (6:4 己烷: 丙酮) 可生成 14α -羥基- 14β -乙烯基馬可福亭 A (120 毫克, 60%, $R_f=0.45$), 呈白色固體。 ^1H NMR (300MHz, CDCl_3) δ 7.86(s, NH), 6.78 & 6.67(d, $J=8.1$ Hz, C_4-H & C_5-H), 6.32(d, $J=7.7$ Hz, $C_{24}-H$), 6.58(dd, $J=17.4$, 10.9 Hz, 1H, 乙醯基), 5.43(d, $J=17.4$ Hz, 1H, 乙烯基), 5.18(d, $J=10.9$ Hz, 1H, 乙烯基), 4.89(d, $J=7.7$ Hz, $C_{25}-H$), 3.7(br, 1H), 3.11(s, 3H, N-Me), 2.95(t, 1H, $C_{20}-H$), 2.8-1.5(m, 12H), 1.44(s, 6H, $C_{27}-H$ & $C_{28}-H$), 1.08(s, 3H), 0.82(s, 3H). MS (FAB) M/Z $[M+H]: 520$ 。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(錄

五、發明說明 (170)

實例 12. 合成 14 α -0-嗎福啉基羰基-N(1)-嗎福啉基羰基馬可福亭 A (式 31)

氫化鉀 (50 毫克的 50% 油分散相) 加至 14 α -羥基馬可福亭 A (25 毫克) 於 3 毫升無水四氫呋喃之溶液。溶液在室溫下攪拌 1 小時，再加醋酐 (30 微升)。混合物在室溫下攪拌 3 小時，再分配於 5% 碳酸氫鈉水溶液 (3 毫升) 及二氯甲烷 (3 毫升) 中。分相，水相以二氯甲烷 (3 毫升) 萃取。混合的萃取物於硫酸鎂上乾燥，過濾，再真空蒸發。殘留物在矽膠板上行製備式層析，以 5% 甲醇 / 二氯甲烷溶離可生成 14 α -0-嗎福啉基羰基-N(1)-嗎福啉基羰基馬可福亭 A (17 毫克)。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 6.84 (q, J=8.1 Hz, C₄-H & C₅-H), 6.41 (d, J=7.7 Hz, C₂₄-H), 3.8-3.2 (m, 17H), 2.98 (s, 3H, N-Me), 3.0-1.5 (m, 13H), 1.45 (s, 6H, C₂₇-H & C₂₈-H), 1.41 (s, 3H, C₁₄-Me), 1.18 (s, 3H), 0.83 (s, 3H)。

實例 13. 製備 14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭 A N-氧化物 (式 32)

14 α -羥基馬可福亭 A (30 毫克) 於 CH₂Cl₂ (3 毫升) 以 0℃ 之間位-氯過氧基苯甲酸 (20 毫克) 處理。混合物攪拌 0.5 小時後，再分配於 5% 碳酸氫鈉水溶液 (10 毫升) 及二氯甲烷 (20 毫升) 中。分相，水相以二氯甲烷 (10 毫升) 萃取。混合的萃取物於硫酸鎂上乾燥、過濾並在 0℃ 之真空下蒸發，以三乙胺 (30 微升) 處理，並濃縮以產生標題化合物，呈固體 (20 毫克)。¹H NMR (300 MHz,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

(或)

五、發明說明 (171)

CD₃OD) δ 6.91 & 6.70 (d, J=8.1 Hz, C₄-H & C₅-H),
6.36 (d, J=7.7 Hz, C₂₄-H), 4.91 (d, J=7.7 Hz,
C₂₅-H), 4.08 & 3.76 (AB q, J=12.9 Hz, 2H, C₁₂-H),
3.5-3.1 (m, 4H), 3.12 (s, 3H, N-Me), 2.8-1.6 (m,
7H), 1.46 & 1.44 (2s, 6H, C₂₇-H & C₂₈-H), 1.50 (s,
3H, C₁₄-Me), 1.20 (s, 3H), 0.93 (s, 3H)。

實例 14. 合成 14 α -羥基-14 β -甲基-N(1)-乙醯基馬可福亭 A (式 33)

氫化鉀 (50毫克之50%油分散相) 加至 14 α -羥基-14 β -
- 甲基馬可福亭 A (25毫克) 於3毫升無水四氫呋喃之溶液
中。溶液在室溫下攪拌1小時，再加醋酸 (50微升)。混
合物在室溫下攪拌1小時，再分配於5%碳酸氫鈉水溶液 (3
毫升) 及二氯甲烷 (3 毫升) 中。混合物分相，水相以
二氯甲烷 (3 毫升) 萃取。混合的萃取物乾燥於硫酸鎂上
，過濾、並真空下蒸發。殘留物在矽膠板上行製備式層析
，以5%甲醇/二氯甲烷溶離，可生成 14 α -羥基-14 β -甲
基-N(1)-乙醯基馬可福亭 A (20毫克)。¹H NMR (300
MHz, CDCl₃) δ 6.88 (q, J=8.1 Hz, C₄-H & C₅-H),
6.37 (d, J=7.7 Hz, C₂₄-H), 4.86 (d, J=7.7 Hz,
C₂₅-H), 3.68 (d, 1 C₁₂-H), 3.11 (s, 3H, N-Me),
2.9-2.7 (m, 2H), 2.61 (s, 3H, N-乙醯基), 2.5-1.5 (m,
10H), 1.47 & 1.46 (2s, 6H, C₂₇-H & C₂₈-H), 1.50 (s,
3H, C₁₄-Me), 1.08 (s, 3H), 0.82 (s, 3H)。

製備 14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A (式 34)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (172)

14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A(式9a, 300毫克)於THF(12毫升)之溶液,以甲基鎂化溴(3M, 1.0毫升, 5當量)在室溫下處理。生成之混合物迴流1.5小時,再冷卻至室溫。反應加飽和的氯化銨(3毫升)中止。混合物以CH₂Cl₂(30毫升)稀釋,以飽和的氯化銨溶液洗滌、乾燥(MgSO₄)並濃縮。殘留物接受矽膠層析(1:20 MeOH:二氯甲烷)可生成14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A(90毫克, 30%)為白色固體。¹H NMR(300 MHz, CDCl₃) δ 7.90(s, NH), 6.80 & 6.70(d, J=8.1 Hz, C₄-H & C₅-H), 6.32(d, J=7.7 Hz, C₂₄-H), 4.89(d, J=7.7 Hz, C₂₅-H), 4.36(br, 1H, C₁₄-H), 3.74(br, 2H, C₁₂-H), 3.20(t, 1H, C₂₀-H), 3.06(s, 3H, N-Me), 2.78 & 2.10(d, 2H, J=15.8 Hz, C₁₀-H), 2.5-1.8(m, 5H), 1.46 & 1.44(2s, 6H, C₂₇-H & C₂₈-H), 1.13(d, 3H, C₁₅-Me), 1.12(s, 3H), 0.88(s, 3H)。

另外,標題化合物可利用酮酸二甲酯鋰試劑製備。對0℃下,碘化銅(0.4克, 0.002莫耳)於THF中,逐滴加入甲基鋰(1.4M, 9毫升, 0.013莫耳)。生成之淺黃色混合物攪拌15分,再以14 α -羥基-15,16-去氫-17-酮基馬可福亭A(式9a, 0.5克, 0.001莫耳)於THF(12毫升)0℃下逐滴處理。經15分鐘之攪拌後,混純的橘色混合物加飽和氯化銨(25毫升)中止,再以EtOAc(30毫升)萃取。有機萃取物乾燥(MgSO₄),過濾,並濃縮以生成粗製物質

五、發明說明 (173)

，經色譜純化（4 毫米板，4% MeOH/CH₂Cl₂）可生成產物（0.23克，44%）呈白色固體。

實例 15. 製備 14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A (式 35)

14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A（90 毫克，0.18 毫莫耳）溶於 THF（10 毫升），再以 0℃ 之甲醚烷二甲硫複合物（12M，0.18 毫升）處理。混合物在 0℃ 下攪拌 2 小時，再加 MeOH（0.4 毫升），並再攪拌 1 小時。於溶劑蒸發後，殘留物接受矽膠層析（30:70 丙酮：二氯甲烷）以生成 14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭 A（20 毫克）呈固體。¹H NMR（300 MHz, CDCl₃） δ 8.39(s, NH), 6.79 & 6.70(d, J=8.1 Hz, C₄-H & C₅-H), 6.36(d, J=7.7 Hz, C₂₄-H), 4.91(d, J=7.7 Hz, C₂₅-H), 3.81(br, 1H, C₁₄-H), 3.67(d, 1H, J=11.7 Hz, C₁₂-H), 3.03(t, 1H, C₂₀-H), 3.11(s, 3H, N-Me), 2.68 & 1.86(d, 2H, J=15.7 Hz, C₁₀-H), 2.7-1.2(m, 8H), 1.44(2s, 6H, C₂₇-H & C₂₈-H), 1.02(d, 3H, J=6.8 Hz, C₁₅-Me), 1.11(s, 3H), 0.85(s, 3H). HRMS (FAB) M/Z [M+H] 估計值 C₂₉H₃₇N₃O₅+H: 508.2811; 實測值: 508.2840。

製備 14,17-二酮基-15 α -甲基馬可福亭 A (式 36)

草醯氯（40 微升）於無水 CH₂Cl₂（5 毫升）之溶液，以 -78℃ 之 DMSO（45 微升）處理。混合物在 -78℃ 下攪拌 1 小時。再逐滴加入 14 α -羥基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A（27 毫克）於 CH₂Cl₂（2 毫升）之溶液。反應混合物在 -78℃ 下攪拌 20 分。加三乙胺（0.3 毫升）至反應混合物

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

（裝

訂

（錄

五、發明說明(174)

，令其以20分鐘加溫至室溫。混合物分配於10% Na_2CO_3 (10毫升) 及 CH_2Cl_2 (10毫升) 之間。有機層乾燥 (MgSO_4) 並濃縮。殘留物接受矽膠層析 (1:20, $\text{MeOH}:\text{CH}_2\text{Cl}_2$) 以生成14,17-二酮基馬可福亭A(22毫克, 80%)為白色固體。產物之結構可由NMR光譜及質譜儀証實。HRMS (FAB) M/Z $[M+H]$ 估計 $\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_6+H$: 506.2291; 實測值: 506.2280。

製備14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A (式37)

14,17-二酮基-15 α -甲基馬可福亭A (25毫克, 0.05 毫莫耳) 於 CH_2Cl_2 (5 毫升) 在 -78°C 之溶液, 以甲基鎂化溴 (3M, 0.2 毫升, 0.6 毫莫耳) 於 Et_2O 在 -78°C 之溶液處理。生成之混合物在 -78°C 下攪拌0.5 小時。反應加10% Na_2CO_3 (數滴) 中止。混合物以 CH_2Cl_2 (10毫升) 稀釋、乾燥 (MgSO_4) 並濃縮。殘留物接受矽膠層析 (1:25 $\text{MeOH}:\text{CH}_2\text{Cl}_2$) 以生成14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭A(16毫克, 62%)為白色固體。 ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.13(s, 1H), 6.78(d, 1H), 6.70(d, 1H), 6.33(d, 1H), 4.91(d, 1H), 3.75(q, 2H), 3.16(t, 1H), 3.05(s, 3H), 2.78(d, 1H), 2.68-2.57(m, 1H), 2.42-2.0(m, 6H), 1.64(s, 3H), 1.45(s, 3H), 1.44(s, 3H), 1.11(s, 3H), 1.04(d, 3H), 0.92(d, 3H)。

實例16. 製備14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝

訂

(線

五、發明說明 (175)

(式 38)

14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基-17-酮基馬可福亭 A (15毫克, 0.028 毫莫耳) 溶於 THF (10 毫升), 再以 0℃ 之甲硼烷二甲硫複合物 (10M, 0.02 毫升) 處理。混合物在 0℃ 下攪拌 2 小時, 再加 MeOH (0.4 毫升) 並再攪拌 1 小時。經蒸發溶劑後, 殘留物接受矽膠層析 (30:70 丙酮: 二氯甲烷) 以生成 14 α -羟基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭 A (4 毫克, 29%) 為固體。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 7.82 (s, 1H), 6.79 (d, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.33 (d, 1H), 4.90 (d, 1H), 3.65 (d, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.98 (t, 1H), 2.69 (d, 1H), 2.60-2.22 (m, 7H), 2.06 (dd, 1H), 1.87 (d, 1H), 1.85-1.75 (m, 1H), 1.44 (s, 6H), 1.43 (s, 3H), 1.10 (s, 3H), 0.94 (d, 3H), 0.86 (s, 3H)。

用於上述反應序列中之起始物之適合的 C-24, C-25, N-1 及 N-18a 經取代之馬可福亭 A、B、C 及 D 衍生物, 可以美國專利 4,923,867 中所示之步驟容易地製備。反應於適合的惰性溶劑中進行, 如吡啶、甲基吡啶、甲苯 (較佳者)、二甲苯、二噁烷、四氫呋喃、等, 溫度為由 10° 至 180℃, 較好是 80° 至 140℃。

另外, C-24, C-25 及 N-1 衍生物可製備自馬可福亭。如, 經由 N-18a 經取代之馬可福亭, 其 N-1 烷化作用可製備大系列之馬可福亭類似物。這些衍生物可被容易地製備, 係將馬可福亭 A, N-18a-經取代之馬可福亭 B, 或 N-18a-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(176)

經取代之馬可福亭C，於無質子有機溶劑中，如四氫呋喃、乙醚、苯等，以過量之強鹼依序處理，如氫化鉀（較佳者），氫化鈉、丁基鋰、第三丁氧基鉀、等，經以適合的烷化劑處理，在0℃至50℃中歷0.25至48小時。適合的烷化劑包括烷基溴、烷基碘、烷基砒、烯基碘、炔基溴、烷氧基烷基氫等。

修飾馬可福亭A、B、C之C24-C25雙鍵，可產生額外的衍生物系列。24,25-二氫類似物可容易地製備，即在醇性溶劑中，如甲醇、乙醇、丙醇等，加有催化劑如鈀、鉑、銻（三苯膦）化氫銻等下，及氫氣存在下攪拌適合的馬可福亭溶液。產物為24,25-二氫基馬可福亭類似物，可利用精藝者已知之技術分離及純化。注意，上述修飾馬可福亭結構其他部份之反應，也可應用至24,25-二氫馬可福亭類似物，以製備相當的24,25-二氫類似物。經由24,25-二溴，可製備馬可福亭額外的G環經修飾類似物，其可經由1莫耳當量溴處理馬可福亭於鹵化溶劑、如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等之溶液，溫度由-20℃至25℃，歷0.25至8小時。此過程可生成相當的24,25-二溴-24,25-二氫馬可福亭A衍生物，其可利用精藝者已知之技術分離及純化。注意到24,25-二氫類似物可由在上述過程中以氫替代溴而製備。上述之24,25-二溴-24,25-二氫-馬可福亭類似物可充作製備額外衍生物之有用中間物。因此，在醇性溶劑如甲醇、乙醇、丙醇等，以強鹼如1,8-二吡二環[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)處理二溴溶液，由0℃至30℃，歷

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (177)

0.25至24小時，可生成24-烷氧基-25-溴-24,25-二氫馬可福亭類似物，其可以精藝者已知之技術分離及純化。這些24-烷氧基，25-溴衍生物，可以化合物於無質子有機溶劑之溶液，如苯、甲苯、己烷等，以氫化錫還原試劑、如氫化之丁錫、氫化之苯錫等，加或不加啟動劑如偶氮雙異丁腈(AIBN)處理而去溴化，溫度在25℃至120℃，歷0.5小時至48小時。此過程可生成相當的24-烷氧基-馬可福亭衍生物(R₂₄=低碳烷氧基於一般結構中)，其可利用精藝者已知之技術分離及純化。

捻轉血毛線虫／蛇形毛圓線虫／沙鼠分析法：

此活體內分析利用感染有二種重要反芻動物標的寄生虫捻轉血毛線虫(*H. contortus*)及蛇形毛圓線虫(*T. colubriformis*)之沙鼠(可使用對蠕虫-敏感或具抗性之虫)。最初，僅評估抗捻轉血毛線虫之活性，如G.A. Conder et al. *J. Parasitol.* 76, 168-170(1990)中所述，而接續之研究則檢查抗二種寄生虫之活性，利用G.A. Conder et al., *J. Parasitol.* 77, 621-623(1991)所示之技術。14 α -羥基馬可福亭A，14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A，14 β -羥基馬可福亭A，14 α -羥基馬可福亭A N-氧化物，及馬可福亭D之活性示於表I中。

五、發明說明 (178)

表 I

捻轉血毛線虫及蛇形毛圓線虫自沙鼠中之清除率，其經由口接種約1000個去鞘膜、且具感染力之各寄生虫之幼虫，在接種後(PI)第10天以受試化合物經口處理，並在接種後第13天解剖。

化合物	純度	劑量 (毫克/沙鼠)	n (至解剖時 之存活)	消除率	
				捻轉血 毛線虫	蛇形毛 圓線虫
馬可福亭 A	100 %	0.33	3(3)	97-100	99-100
馬可福亭 D	100 %	1.0	3(3)	0	72
實 例 1.	100 %	0.11	3(3)	99-100	99-100
實 例 2.	100 %	0.33	3(3)	100	100
實 例 3.	100 %	1.0	3(3)	54	41
實 例 4.	100 %	0.33	3(3)	100	99
實 例 5.	100 %	0.33	3(3)	88-99	99-100
實 例 6.	100 %	0.33	3(3)	100	100
實 例 7.	100 %	0.11	3(3)	100	100
實 例 8.	100 %	0.33	3(3)	98-99	100
實 例 9.	100%	0.11	3(3)	100	99
實 例 10.	100 %	0.11	3(3)	98-99	100
實 例 11.	100 %	0.33	3(3)	92-98	94-96
實 例 12.	100 %	0.33	3(3)	100	99
實 例 13.	100 %	0.33	3(3)	98-100	97-99
實 例 14.	100 %	0.33	3(3)	99-100	100
實 例 15.	100 %	0.11	3(3)	98	99
實 例 16.	100 %	0.33	3(3)	80	100

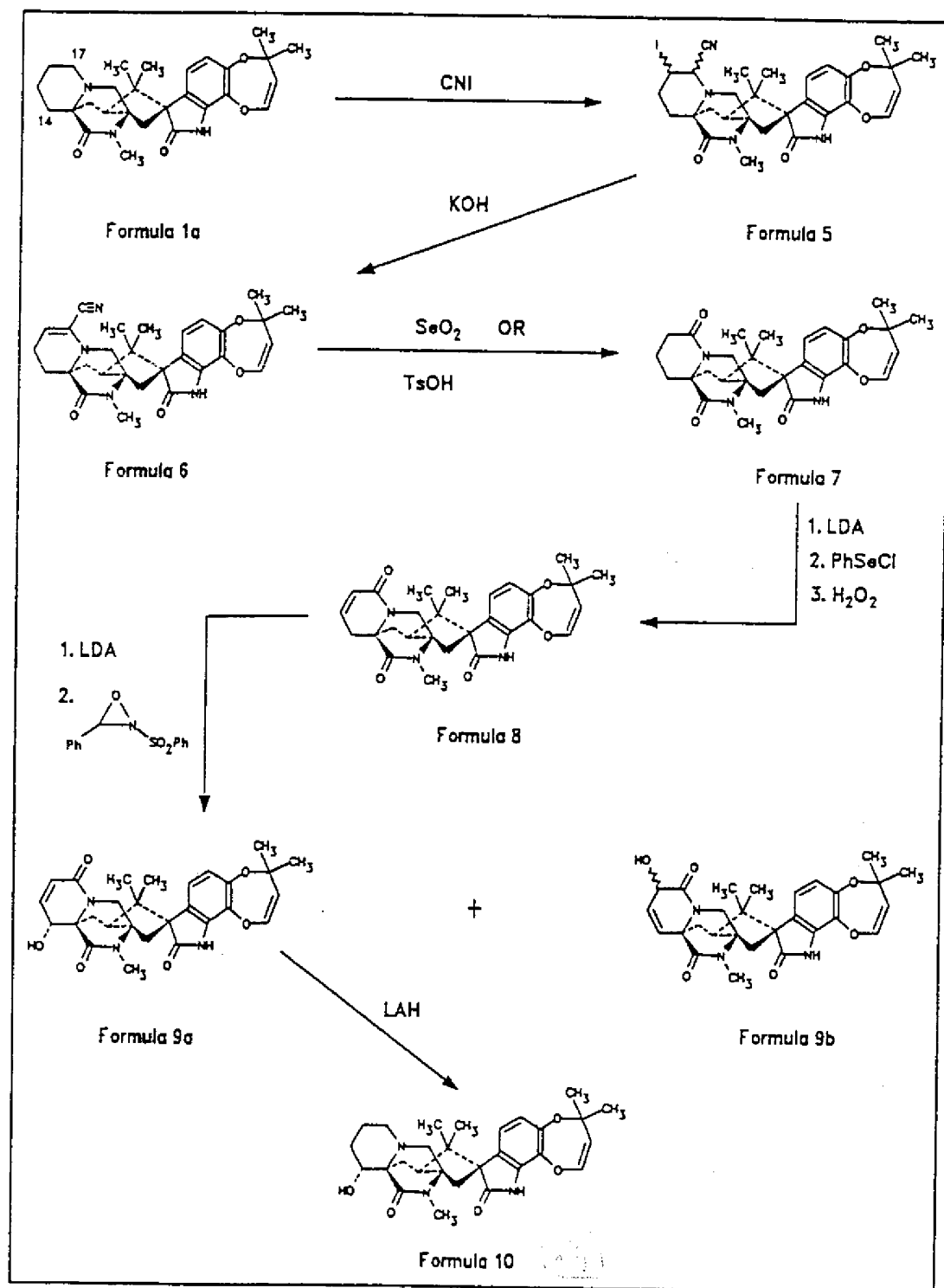
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

(裝)

訂

五、發明說明 (179)

[圖] A



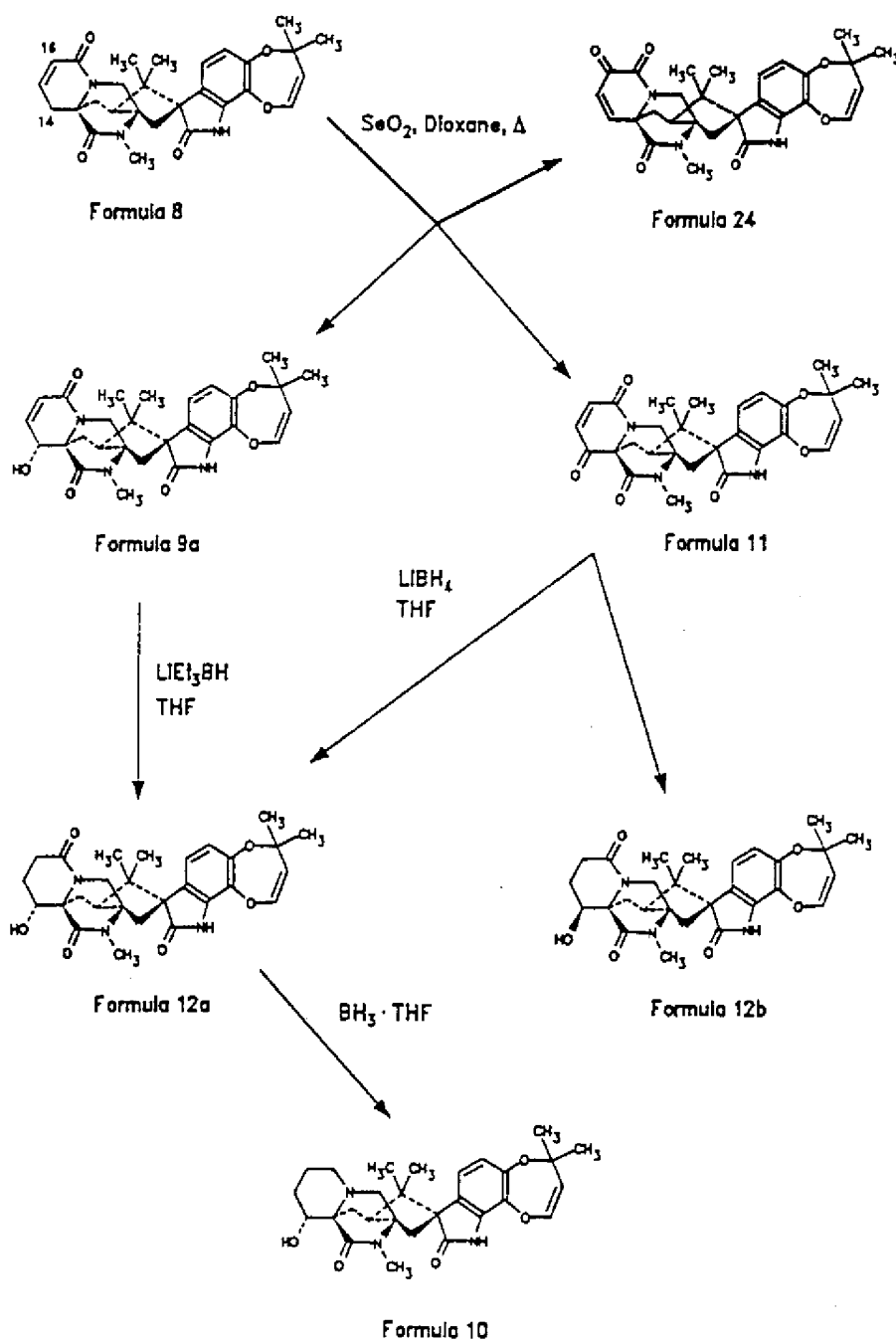
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (180)

[圖] B

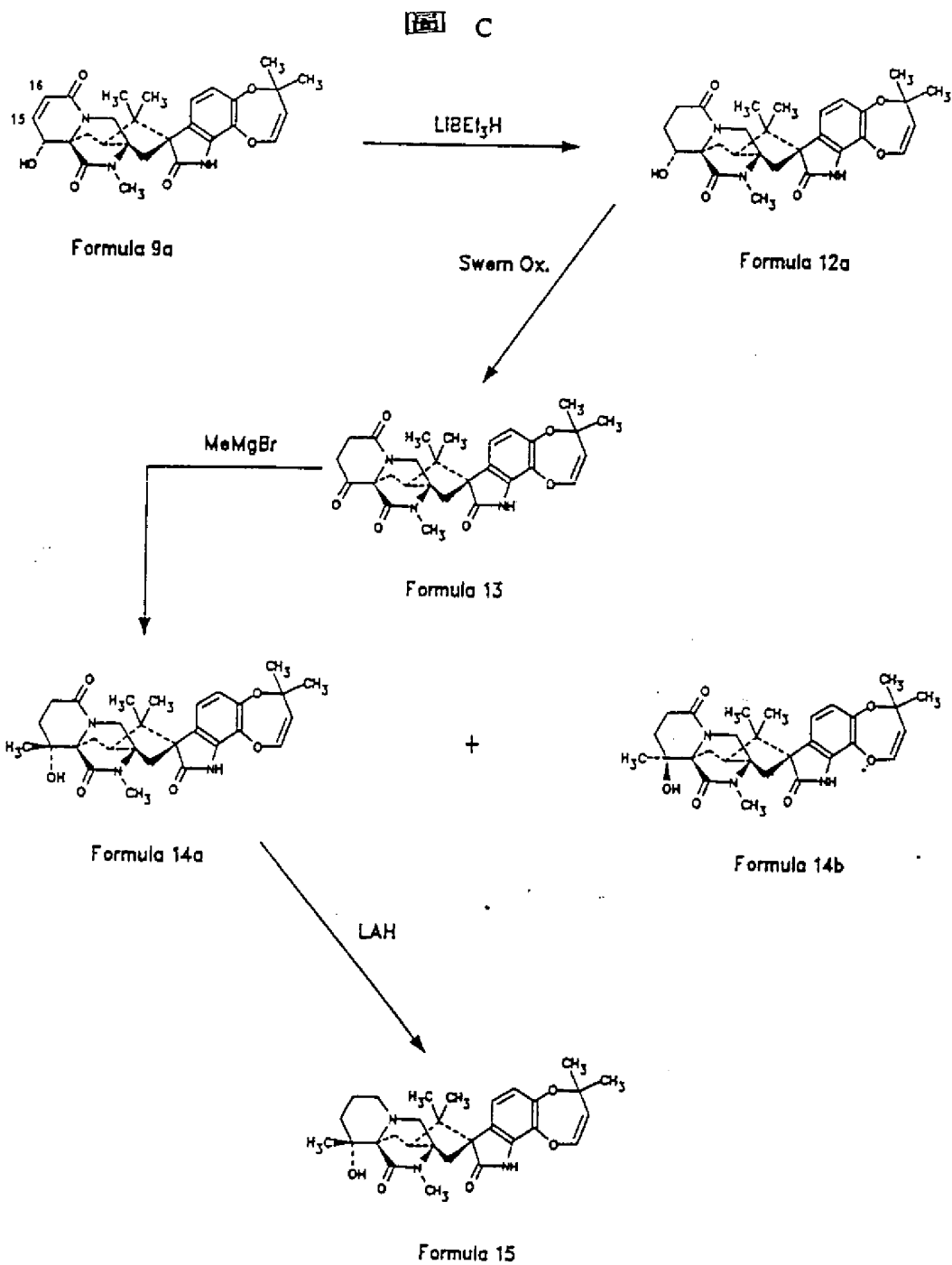


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

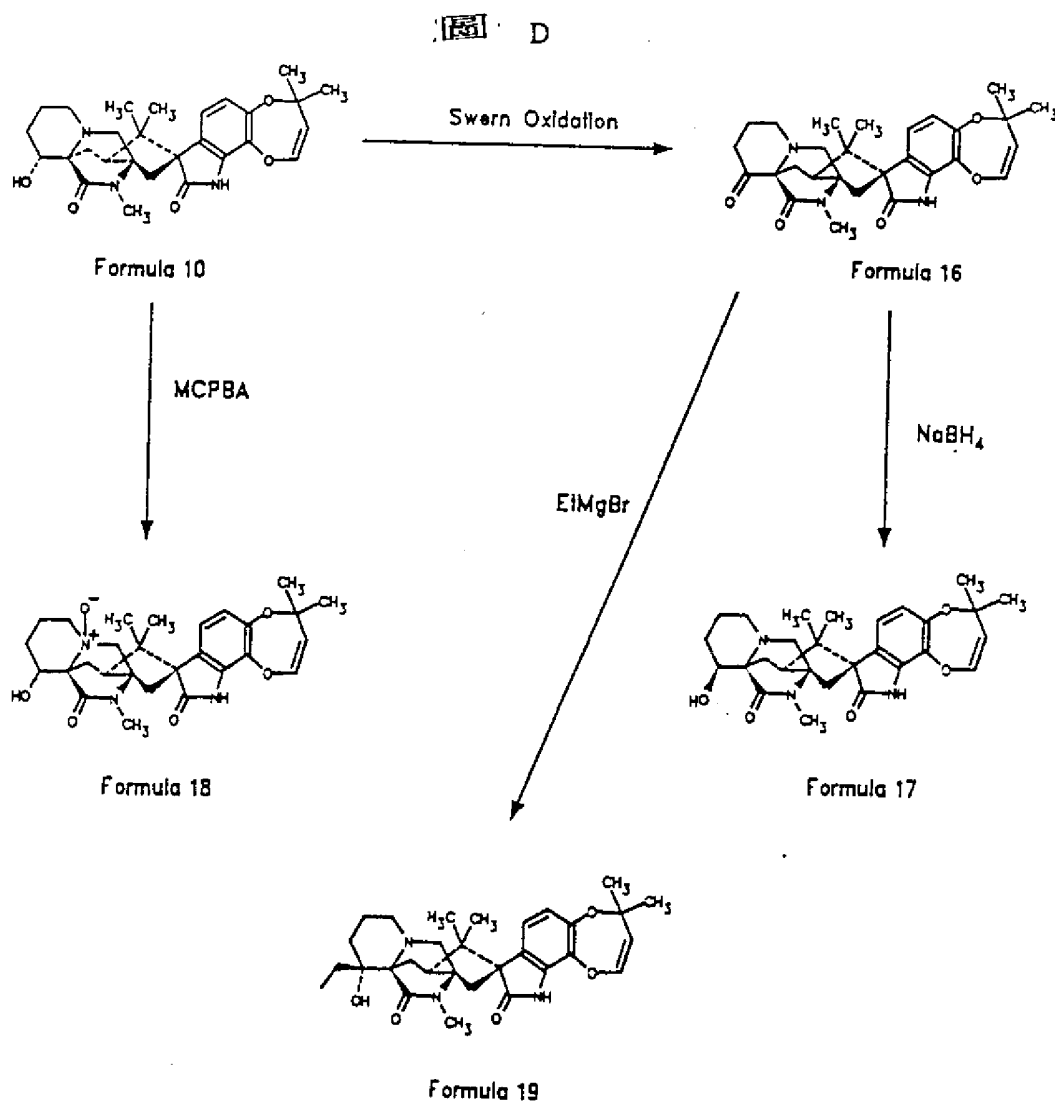
訂

五、發明說明 (181)



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

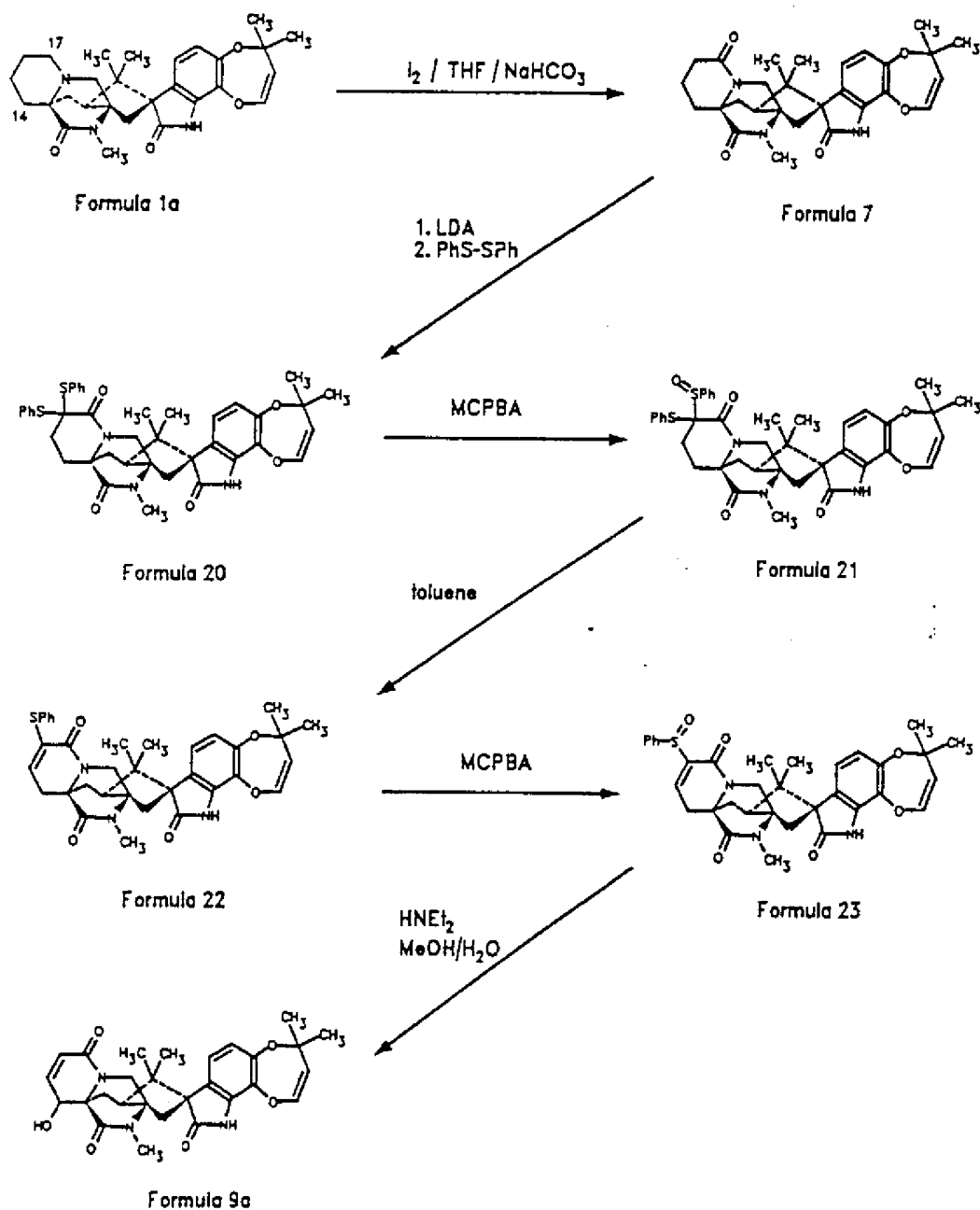
五、發明說明 (182)



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (183)

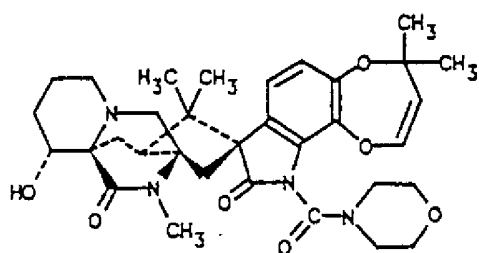
圖 E



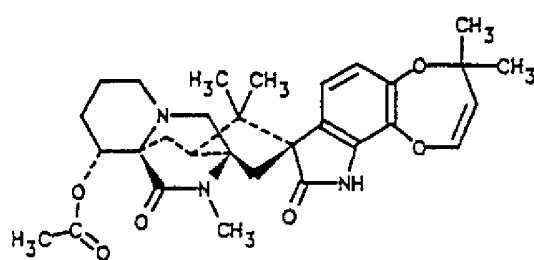
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (184)

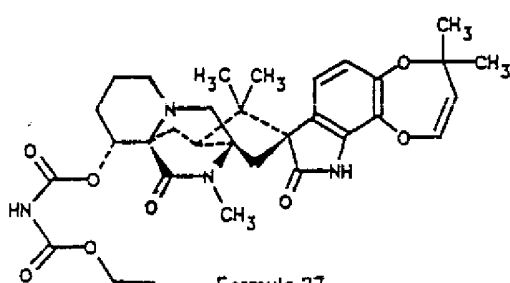
F



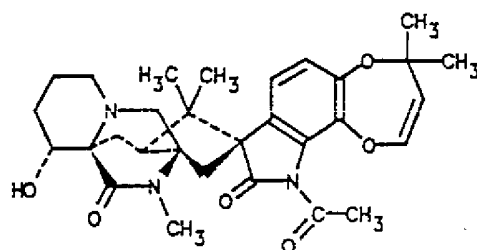
Formula 25



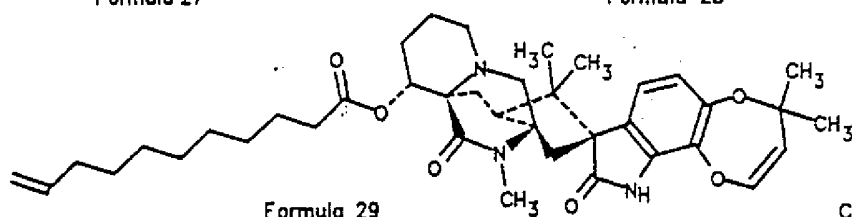
Formula 26



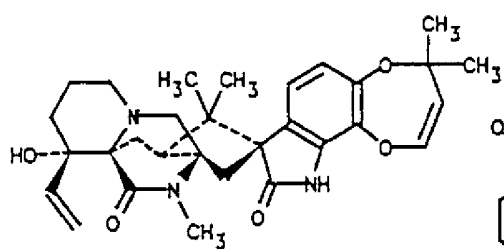
Formula 27



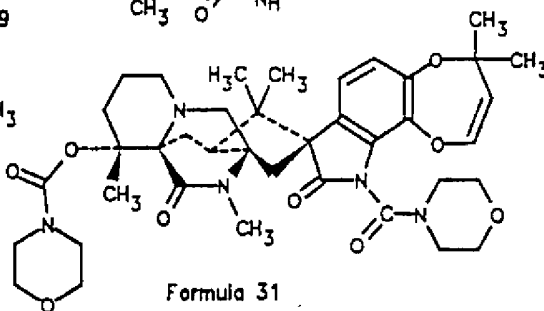
Formula 28



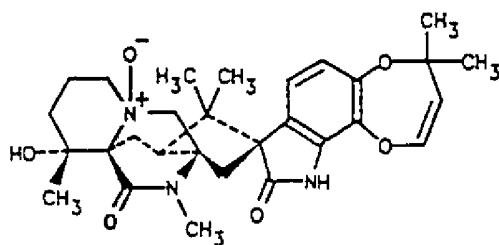
Formula 29



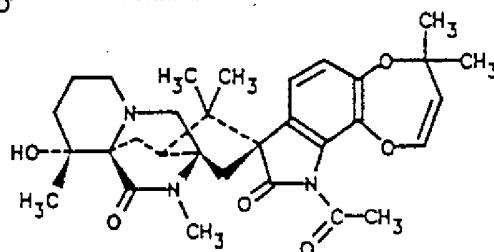
Formula 30



Formula 31



Formula 32



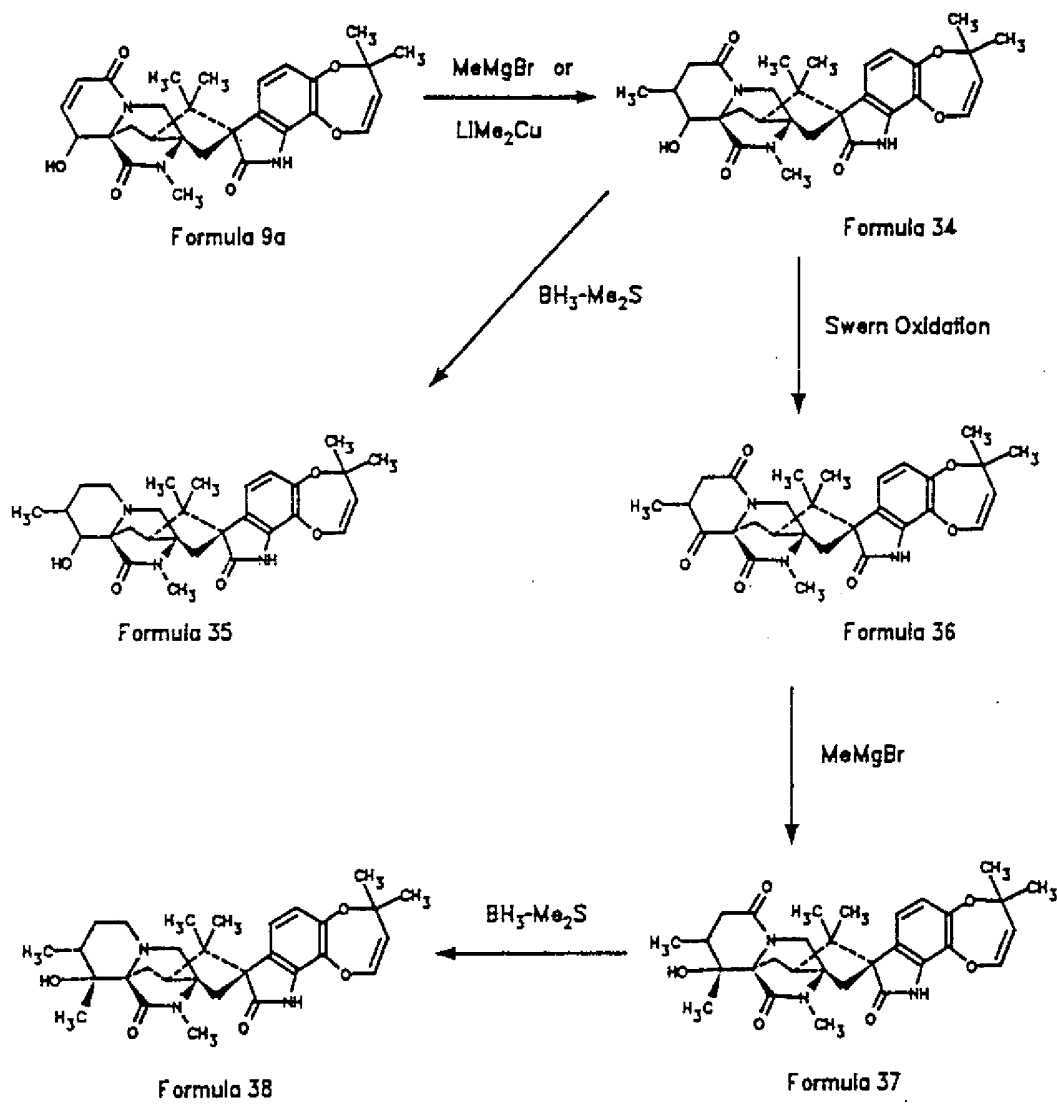
Formula 33

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (185)

[圖] G

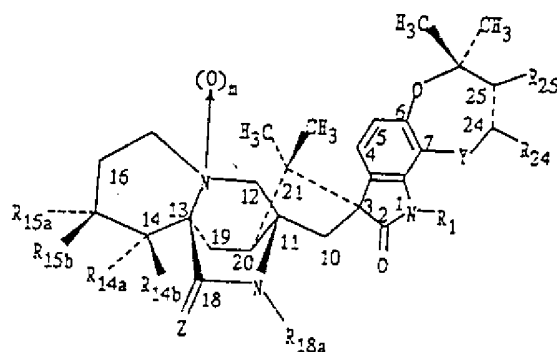


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

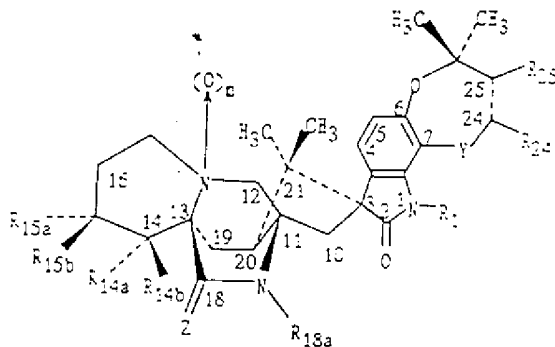
四、中文發明摘要 (發明之名稱：作為抗寄生蟲劑之14-經取代之馬可福亭 (MARCFORTINES) 及衍生物)

本發明揭示天然產物馬可福亭 (marcfortine) A 之 14 α -
經基馬可福亭衍生物，B、C 及 D，可用於治療及預防動物
及植物之蠕蟲及節肢動物感染。合成的衍生物是式 I：



英文發明摘要 (發明之名稱：14-SUBSTITUTED MARCFORTINES AND
DERIVATIVES USEFUL AS ANTIPARASITIC
AGENTS)

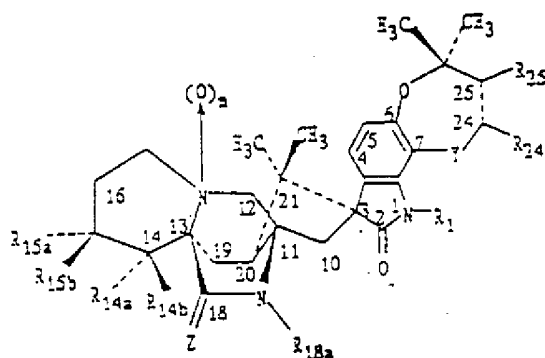
There are disclosed 14 α -hydroxymarcfortine derivatives of the natural products
marcfortine A; B, C, and D useful in the treatment and prevention of helminth and arthropod
infections of animals and plants. The synthetic derivatives are of Formula I:



410227

六、申請專利範圍

1. 一種式 I 化合物



或其藥學上可接受之鹽，或 12α -N-氧化物；

其中：

m 是 0 或 1；

Z 是 0；

Y 是氧原子 (-O-)；

R_1 是氫、或經 C_1 - C_{10} 烷基或嗎啉基取代之羰基
(-C(O)-)；

R_{24} 是氫；

R_{25} 是氫；

R_{18a} 是氫， C_1 - C_{10} 烷基，或經 C_1 - C_{10} 烷基或嗎啉基取代之羰基；

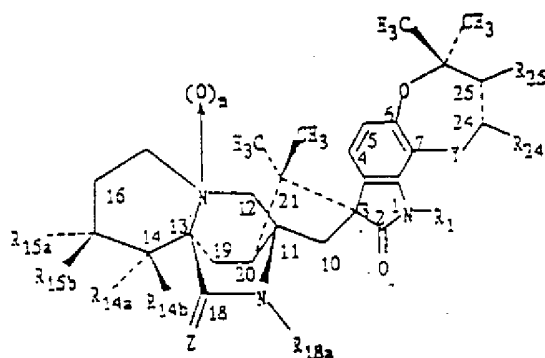
R_{14a} 及 R_{14b} 係獨立地選自羥基、氫、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基或經取代之羰基（其取代基係為 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_1 - C_{10} 烷氧基取代之醯胺基或嗎啉基）；

R_{15a} 及 R_{15b} 均為氫，限制條件為當 R_{14a} 及 R_{14b} 之一是羥基，另一者是氫或甲基， R_{15a} 及 R_{15b} 可為氫或甲基；介於碳 24 及 25 間之虛線代表雙鍵；且整體之限制條件為 R_{14a} 及 R_{14b} 不可均為氫。

410227

六、申請專利範圍

1. 一種式 I 化合物



或其藥學上可接受之鹽，或 12α -N-氧化物；

其中：

m 是 0 或 1；

Z 是 0；

Y 是氧原子 (-O-)；

R_1 是氫、或經 C_1 - C_{10} 烷基或嗎啉基取代之羰基
(-C(O)-)；

R_{24} 是氫；

R_{25} 是氫；

R_{18a} 是氫， C_1 - C_{10} 烷基，或經 C_1 - C_{10} 烷基或嗎啉基取代之羰基；

R_{14a} 及 R_{14b} 係獨立地選自羥基、氫、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基或經取代之羰基（其取代基係為 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_1 - C_{10} 烷氧基取代之醯胺基或嗎啉基）；

R_{15a} 及 R_{15b} 均為氫，限制條件為當 R_{14a} 及 R_{14b} 之一是羥基，另一者是氫或甲基， R_{15a} 及 R_{15b} 可為氫或甲基；介於碳 24 及 25 間之虛線代表雙鍵；且整體之限制條件為 R_{14a} 及 R_{14b} 不可均為氫。

六、申請專利範圍

2. 根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 m 是0。
3. 根據申請專利範圍第2項之化合物，其中 R_{24} 及 R_{25} 是氫； R_{18a} 是氫， C_1-C_6 烷基，或經 C_1-C_6 烷基或嗎啉基取代之羰基； Y 是 $-O-$ ；且虛線代表介於碳24及25間之雙鍵。
4. 根據申請專利範圍第1項之化合物，其係選自下列包括：
 - 14 α -乙醯氧基馬可福亭A；
 - 14 α -0-乙氧羰基胺基羰基馬可福亭A；
 - 14 α -羥基-N(1)-乙醯基馬可福亭A；
 - 14 α -0-(10-十一醯基)馬可福亭A；
 - 14 α -羥基-14 β -乙烯基馬可福亭A；
 - 14 α -0-嗎福啉基羰基-N(1)-嗎福啉基羰基馬可福亭A；
 - 14 α -羥基-14 β -甲基馬可福亭A N-氧化物；
 - 14 α -羥基-14 β -甲基-N(1)-乙烯基馬可福亭A；
 - 14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A；或
 - 14 α -羥基-14 β -甲基-15 α -甲基馬可福亭A。
5. 根據申請專利範圍第1項之化合物，即14 α -羥基-15 α -甲基馬可福亭A。
6. 一種可用於治療及預防飼養動物蠕虫或節肢動物感染之醫藥組成物，其中包括惰性或載劑及根據申請專利範圍第1項之化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂