

申請日期	80年11月29日
案號	80109410
類別	C07D 27/60, 413/64, 417/60, C07F 9/40 A61K 31/435, 31/435, 31/435, 31/435

Int. Cl⁶

A4
C4

公告本
311136

(以上各欄由本局填註)

發明
新型 專利說明書

一、發明 名稱	中文	新穎噁唑衍生物、噁唑衍生物及抑制活性氧用藥學組成物
	英文	新規チアゾール誘導體、オキサゾール誘導體及び活性酸素抑制剤用藥學組成物
二、發明 人	姓名	(1) 千尋正利 (2) 小松一 (3) 富永道明
	籍貫 (國籍)	(1) 日本 (2) 日本 (3) 日本 (1) 日本國德島縣鳴門市撫養町小桑島字前浜一八五
	住、居所	(2) 日本國德島縣板野郡北島町中村字本須四二一三 (3) 日本國德島縣板野郡上板町高磯三一〇一六
三、申請人	姓名 (名稱)	(1) 大塚製藥股份有限公司 大塚製藥株式会社
	籍貫 (國籍)	(1) 日本 (1) 日本國東京都千代田區神田司町二ノ九
	住、居所 (事務所)	
	代表人 姓名	(1) 大塚明彦

裝
訂

311136

82.3.26

申請日期	
索 號	
類 別	

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發明
新型 專利說明書

一、發明 名稱	中 文	
	英 文	
二、發明 創作人	姓 名	(4) 藪內洋一
	籍 貫 (國籍)	(4) 日本 (4) 日本國德島市川內町大松九〇-二五
	住、居所	
三、申請人	姓 名 (名稱)	
	籍 貫 (國籍)	
	住、居所 (事務所)	
	代 表 人 姓 名	

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

裝
訂

五、發明說明 (1)

本發明乃含有唑系衍生物為有效成分的活性氧抑制劑有關者。

已往在科技上認為嗜中性白細胞在生物體內，對於入侵的外敵以游走反應、貧食作用、產生活性氧 (O_2^-)，放出溶酶體 (lysosome) 酶來顯現其殺菌作用，擔任生物體防衛上重要功能。然而，最近發現上述生物體防衛反應之際，由組織或嗜中性白細胞所放出的活性氧在各組織的虛血以及繼起的血液的再灌流時，或急性炎症發生時，會破壞細胞而影響及組織機能 [參考 B. R. Lucchesi, Ann. Rev. Pharmacol. Toxicol., 26, 201 (1986) ; B. A. Freeman et al., Laboratory Investigation, 47, 412 (1982) ; E. Braunwald, R. A. Kloner, J. Clin. Invest. 76, 1713 (1985) ; J. L. Romson et al., Circulation, 67, 1016 (1983)]。

本發明有鑑及上述細胞障礙，特別是心臟、大腦、腎臟、肺臟、消化器官系統在虛血再灌流後所發生障礙的主因為嗜中性白細胞所放出的活性氧。因此，以提供能抑制上述活性氧的放出有用的新藥劑為其目的。

本發明研究者據上述目的積極努力研究結果，發現某種唑系衍生物具有非常強大的活性氧放出的抑制作用，更加詳細研究而完成本發明。

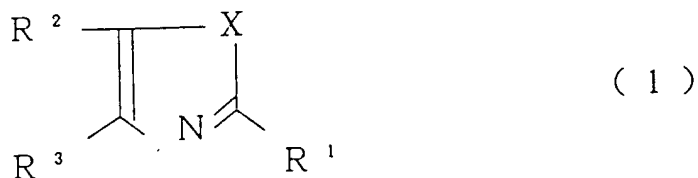
本發明乃含有以下列一般式 (1) 所示唑系衍生物之至少一種為有效成分的活性氧抑制劑有關者。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

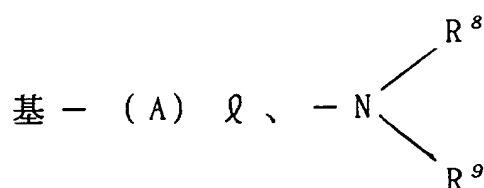
五、發明說明 (2)

一般化學式



所示唑系衍生物或其鹽類：

[上式中， R^1 和 R^3 可為相同或不同構造，示苯環上具有烷氧基、三低級烷基取代矽烷基氧基、低級烷基、羥基、低級烯基氧基、低級烷基硫基為取代基的苯基，噻唑基環上具有低級烷氧基取代基在苯環上的苯基的噻唑基，羧基以及羥基所構成群中選擇而做為其取代基的苯基，低級烷基亞磺醯基，低級烷基磺醯基，鹵素原子，硝基，



0

||

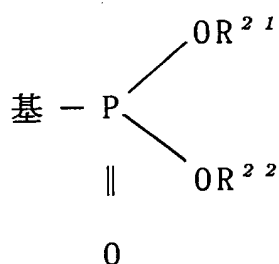
(上式中，A示低級伸烷基或基 $-\text{C}-$ 。 ϱ 示0或1。 R^8 和 R^9 可為相同或不同構造，示氫原子，低級烷基，低級烷醯基、具有低級烷基為取代基的胺基低級烷基或六氫吡啶基低級烷基。又 R^8 和 R^9 可介由氧原子或氮原子或

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (3)

不介由氧原子或氮原子，由本身所結合的氮原子互相結合而形成飽和或不飽和狀的5~6環構造的雜環。上述雜環上可具備低級烷醯基或低級烷基做為其取代基。) 低級烷醯基，低級烷醯氧基，烷氧基羰基，氟基，具備由羥基，低級烷氧基羰基，苯基低級烷氧基，羥基或低級烷醯氧基取代低級烷基以及低級烷醯氧基所構成群中選擇1~4個基為取代基的四氫吡喃基氧基，肟基，羥基磷基氧基，低級烷氧基羰基取代低級烷氧基，羧基取代低級烷氧基，氫硫基，低級烷氧基取代低級烷氧基，具有羥基的低級烷基，低級烯基，具有低級烷基為取代基的胺基硫基羰基氧基，具有低級烷基為取代基的胺基羰基硫基，低級烷醯基取代低級烷基，羧基，



(R²¹和R²²可為相同或不同構

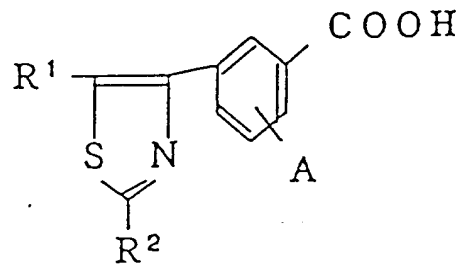
造，示氫原子或低級烷基。) ，苯基低級烷氧基羰基，環烷基，低級炔基，低級烷氧基羰基取代低級烷基，羧基取代低級烷基，低級烷氧基羰基取代低級烯基，羧基取代低級烯基，具有鹵素原子的低級烷基磷醯氧基以及低級烷氧基取代低級烷氧基羰基，具有鹵素原子的低級烯基，以及苯基低級烷氧基所構成群中選擇1~5個基為其取代基的

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (6)

下列一般化學式所示化合物在血纖維蛋白溶解作用 (Fibrinolysis) , 血小板粘性 (Platelet stickiness) , 潰瘍以及免疫學處理上具備有益的特性, 可提供預防和處理血栓症、動脈硬化症, 胃潰瘍以及分泌過多症等用途。



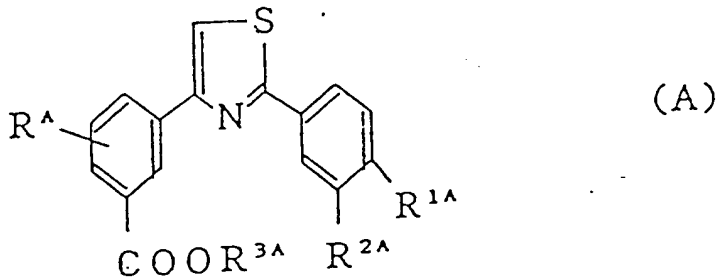
[上式中, R^1 示由氫原子以及具有 1 ~ 5 個碳原子的直鏈狀或歧鏈狀低級烷基所構成基群中選擇的基, R^2 示由具備 1 ~ 5 個碳原子的低級烷基, 可由具有 1 ~ 5 個碳原子的低級烷基或低級烷氧基或一個或以上的鹵素原子所取代的苯基烷基以及苯基所構成基群選擇的基, A 示由氫原子, 鹵素原子, 羥基以及具有 1 ~ 5 個碳原子的低級烷基或低級烷氧基所構成基群選擇的基。]

雖然本發明的化合物中, 具有下列一般式 (A) 所示噻唑衍生物以及其鹽類和上述已發明技術的化合物在化學構造上含有類似的化合物, 但未見有關本發明化合物的公告。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

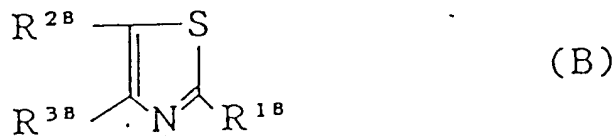
五、發明說明 (7)



[上式中， R^A 示氫原子或羟基。 R^{1A} 和 R^{2A} 分別示甲氧基或乙氧基。 R^{3A} 示氫原子或低級烷基。 R^A 的結合位置為苯環上的4位或6位。但 R^{1A} 和 R^{2A} 不可以同時為甲氧基。]

本發明的化合物和後述藥理試驗（參考表16）所示較之最類似的化合物而言，仍然顯示最強的活性氧放出抑制作用。

本發明的化合物中，以下列一般式（B）所示噻唑系衍生物和其鹽類，



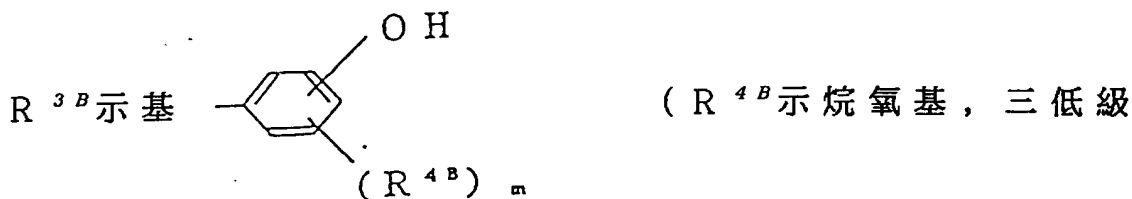
[上式中， R^{1B} 示苯環上具有1~3個低級烷氧基為其取代基的苯基，具有低級伸烷基二氧基的苯基，具有氧基的吡啶基，噻啶基，羟基喹啉基，吡啶基，吡咯基，氧基的喹啉基，或3,4-二羟基喹啉基。 R^{2B} 示氫原子。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

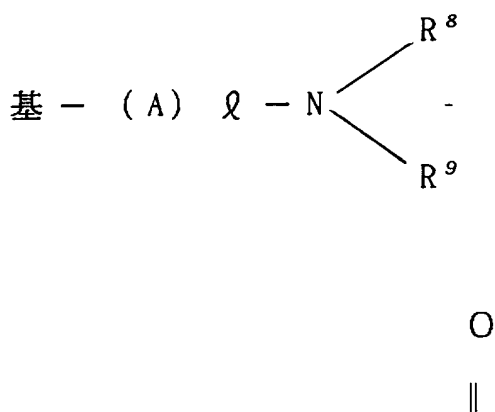
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (8)



烷基取代的烷基氧基，低級烷基，羥基，低級烯基氧基，低級烷基硫基，噻唑環上具有苯基為取代基，而該苯基上具有烷基氧基在其苯環上做為取代基的噻唑基，羧基以及羥基所構成基群中選擇基的苯基，低級烷基亞磺醯基，低級烷基磺醯基，鹵素原子，硝基，



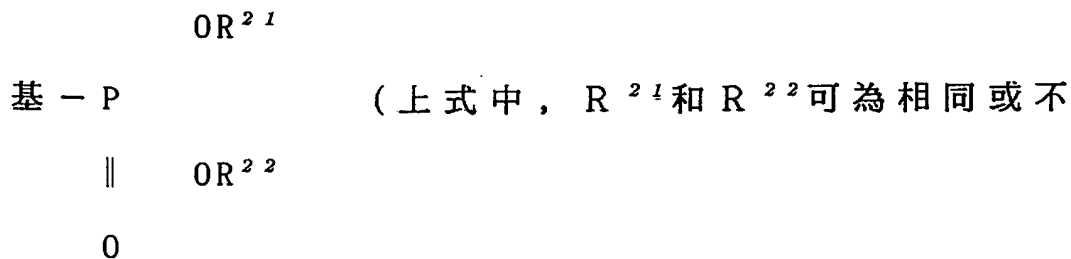
(上式中，A 示低級伸烷基或基 - C -。ϱ 示 0 或 1。R⁸ 和 R⁹ 可為相同或不同構造，示氫原子。低級烷基，低級烷醯基，可具有低級烷基為其取代基的胺基低級烷基或六氫吡啶基低級烷基。另外，R⁸ 和 R⁹ 可介由氮原子或氧原子或不介由氮原子或氧原子，再連同所結合的氮原子互相結合成為飽和或不飽和的 5 ~ 6 節雜環。該雜環上可具有低級烷醯基或低級烷基為其取代基。) ，低級烷醯基、低級烷醯氧基、烷基羧基、羧基，羥基為其取代基，低級烷基羧基，苯基低級烷基氧基，羥基，或低級烷醯氧基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (9)

取低級烷基以及低級烷醯氧基所構成基群中選擇的基 1 ~ 4 個為其取代基的四氫吡喃基氧基，脞基，羥基磺醯氧基，低級烷氧基羰基取代低級烷氧基，羧基取代低級烷氧基，氫硫基，低級烷氧基取代低級烷氧基，具有羥基的低級烷基，低級烯基，具有低級烷基為其取代基的胺基硫基羰基氧基，具有低級烷基為其取代基的胺基羰基硫基，低級烷醯基取代低級烷基，羧基，具有低級烷基為其取代基的胺基低級烷氧基羰基，



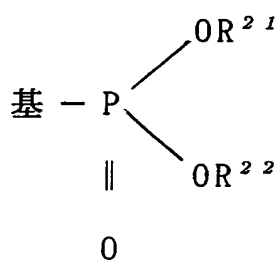
同構造，示氫原子或低級烷基。) ， 苯基低級烷氧基羰基，環烷基，低級炔基，低級烷氧基羰基取代低級烷基，羧基取代低級烷基，低級烷氧基羰基取代低級烯基，羧基取代低級烯基，具有鹵素原子的低級烷基磺醯氧基以及低級烷氧基取代低級烷氧基羰基，具有鹵素原子的低級烯基，以及苯基低級烷氧基。m 示 0，1 或 2。) 或苯環上具有低級烷醯氧基，羥基磺醯氧基，氰基，脞基，硝基，低級烷基硫基，低級烷基磺醯基為其取代基，由羥基、低級烷氧基羰基，苯基低級烷氧基，羥基或低級烷醯氧基取代低級烷基以及低級烷醯氧基所構成基群中選擇的基 1 ~ 4 個為其取代基的四氫吡喃基氧基、噻唑環上具有苯基為取代

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

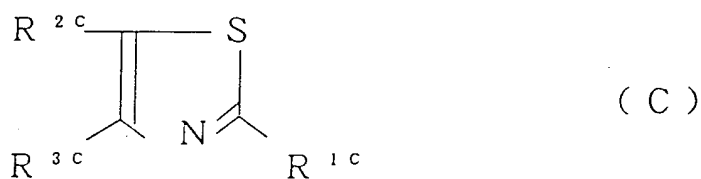
五、發明說明 (10)

基，且該苯基的苯環上具有低級烷氧基為取代基的噻唑基，羧基以及經基所構成基群中選擇其取代基的苯基，具有經基的低級烷基，



(上式中， R^{21} 和 R^{22} 所示如同前述。) 所構成基群中選擇的基 1 ~ 3 個為取代基的苯基，-具有低級伸烷基二氧基的苯基，低級烷基；低級烷氧基羰基低級烷基；低級烷氧基羰基；氮甲醯基低級烷基；具有氧基或 / 和經為取代基的 2, 3 - 二氫茛基；苯環上具有低級烷氧基而且低級烷基上具有經基為其取代基的苯基低級烷基；苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯甲醯基；苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯基低級烯基；六氫吡啶環上具有低級烷基的六氫吡啶基低級烷基或金鋼烷基。但 R^{4B} 為低級烷氧基羰基取代低級烷基或羧基取代低級烷基時，m 示 Z。]

和下列一般式 (C) 所示噻唑衍生物以及其鹽類：

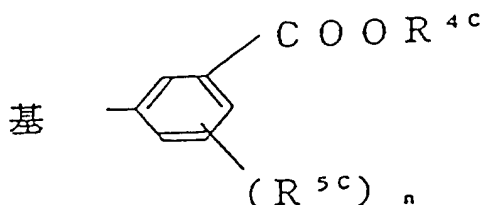


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (11)

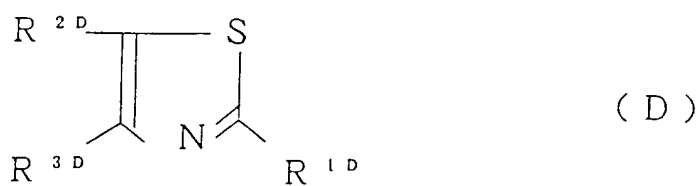
[上式中， R^{1c} 示苯環上具有1~3個低級烷氧基為其取代基的苯基。 R^{2c} 示氫原子。 R^{3c} 示



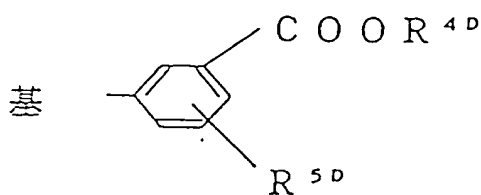
(上式中， R^{4c} 示氫原子，低級烷基，苯基低級烷基或低級烷氧基取代低級烷基。 R^{5c} 示胺基，低級烷氧基低級烷基，低級烷基，硝基，低級烯基，低級烷醯基，具有鹵素原子的低級烯基，苯基低級烷氧基，鹵素原子或羟基取代低級烷基。 n 示2。)]。

和下列一般式 (D) 所示噻唑衍生物以及其鹽類：

(D)



[上式中， R^{1D} 示苯環上具有低級烷氧基1~3個為其取代基的苯基。 R^{2D} 示氫原子。 R^{3D} 示



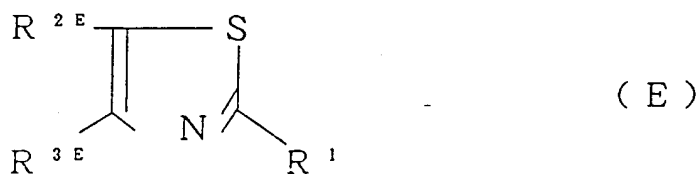
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

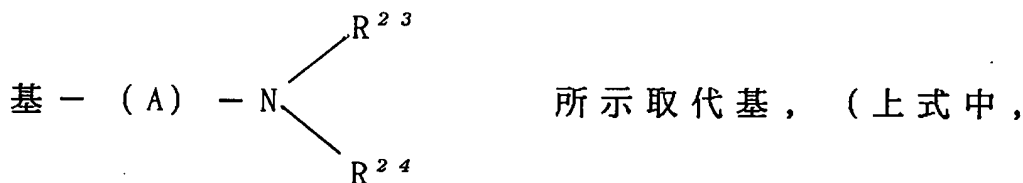
五、發明說明 (12)

(上式中， R^{4D} 示氫原子或低級烷基。 R^{5D} 示胺基。低級烷氧基羰基低級烷氧基，硝基，低級烯基氧基，低級烷氧基取代低級烷氧基或氫硫基，低級烷醯氧基，具有低級烷基為取代基的胺基羰基硫基，具有低級烷基為取代基的胺基硫基羰基氧基，羧基取代低級烷氧基，或具有鹵素原子的低級烷基磺醯氧基。)]。

和下列一般式 (E) 所示噻唑衍生物以及其鹽類：



[上式中， R^1 如同前述。 R^{2E} 示氫原子。 R^{3E} 示具有 1 ~ 2 個氮原子、氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環所構成單環、雙環或三環構造的雜環殘基 [該雜環基可具有氧基，烷基，苯甲醯基，低級烷醯基，羥基，羧基，低級烷氧基羰基，低級烷基硫基，



A 所示如同前述。 R^{23} 和 R^{24} 可為相同或不同構造，示氫

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

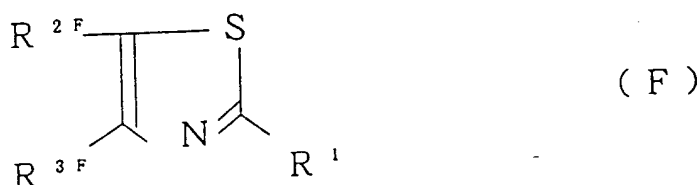
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

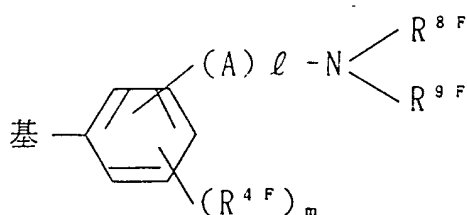
五、發明說明 (13)

原子或低級烷基。另外， R^{23} 和 R^{24} 可介由氮原子或氧原子，或不介由氮原子或氧原子，由其所結合的氮原子一起互相結合而形成飽和的5~6節環的雜環。該雜環上可具有低級烷基為其取代基。)，氰基，具有經基的低級烷基，苯基胺基硫基羰基以及具有低級烷基為其取代基的胺基低級烷氧基羰基所構成基群中選擇1~3個取代基。]

和以下列一般式 (F) 所示噻唑衍生物及其鹽類：



[上式中， R^1 如同前述。 R^{2F} 示氫原子。 R^{3F} 示



(上式中， A ， l ， m 所示如同前述。 R^{8F} 和 R^{9F} 可為相同或不同構造，示低級烷醯基，具有低級烷基為其取代基的胺基低級烷基或六氫吡啶基低級烷基。另外， R^{8F} 和 R^{9F} 和其所結合的氮原子一起，介由氮原子或氧原子或不介由氮原子或氧原子，互相結合而形成飽和或不飽和的5~6節環構造的雜環。該雜環可具有低級烷醯基或低級烷

(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 (14)

基為其取代基。R^{4F}除羥基以外和前述之R^{4B}所示者相同。

本發明的詳細說明中所示各基的具體例舉如下：

烷氧基的例舉如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、第三丁氧基、戊氧基、己氧基、庚氧基、辛氧基、壬氧基、癸氧基、十一烷氧基、十二烷氧基、十三烷氧基、十四烷氧基、十五烷氧基、十六烷氧基、十七烷氧基、十八烷氧基等碳原子數為1~18個的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基。

低級烷基的例舉如甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第三丁基、戊基、己基等碳原子數為1~6個的直鏈狀或枝鏈狀烷基。

低級烷基硫基的例舉如甲硫基，乙硫基，丙硫基，異丙硫基，丁硫基，第三丁硫基，戊硫基，己硫基等碳原子數為1~6個的直鏈狀或枝鏈狀烷硫基。

低級烷基磺醯基的例舉如甲磺醯基，乙磺醯基，異丙磺醯基，丁磺醯基，第三丁磺醯基，戊磺醯基，己磺醯基等碳原子數為1~6個的直鏈狀或枝鏈狀烷磺醯基。

鹵素原子的例舉如氟原子、氯原子、溴原子和碘原子。

低級烷醯基的例舉如甲醯基，乙醯基，丙醯基，丁醯基，異丁醯基，戊醯基，第三丁基羧基，己醯基等碳原子數為1~6個的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基。

低級烷氧基羧基的例舉如甲氧基羧基，乙氧基羧基，

（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 (15)

丙氧基羰基，異丙氧基羰基，丁氧基羰基，第三丁氧基羰基，戊氧基羰基，己氧基羰基等碳原子數為 1 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基。

低級伸烷基二氧基的例舉如伸甲基二氧基，伸乙基二氧基，伸丙基二氧基，伸丁基二氧基等碳原子數為 1 ~ 4 個的直鏈狀或枝鏈狀的伸烷基二氧基。

烷基的例舉如前述低級烷基之例舉外，尚加上庚基，辛基，壬基，癸基，十一烷基，十二烷基，十三烷基，十四烷基，十五烷基，十六烷基，十七烷基，十八烷基等碳原子數為 1 ~ 18 個的直鏈狀或枝鏈狀的烷基。

低級烷氧基羰基低級烷基的例舉如甲氧基羰基甲基，3-甲氧基羰基丙基，乙氧基羰基甲基，4-乙氧基羰基丁基，6-丙氧基羰基己基，5-異丙氧基羰基戊基，1, 1-二甲基-2-丁氧基羰基乙基，2-甲基-3-第三丁氧基羰基丙基，2-戊氧基羰基乙基，己氧基羰基甲基等烷基等部分的碳原子數為 1 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷基的碳原子數為 1 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基烷基。

氨基甲醯基低級烷基的例舉如氨基甲醯基甲基，2-氨基甲醯基乙基，1-氨基甲醯基乙基，3-氨基甲醯基丙基，4-氨基甲醯基丁基，5-氨基甲醯基戊基，6-氨基甲醯基己基，1, 1-二甲基-2-氨基甲醯基乙基，2-甲基-3-氨基甲醯基丙基等烷基部分的碳原子數為 1 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷基的氨基甲醯基烷基。

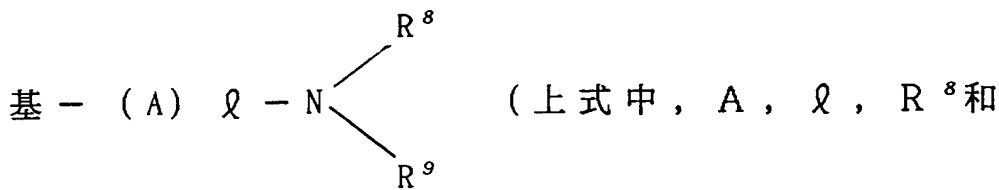
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (16)

具有氧基或 / 和羥基的 2, 3 - 二氫茛基的例舉如 1 - 氧基 - 7 - 羥基 - 2, 3 - 二氫茛基, 1 - 氧基 - 6 - 羥基 - 2, 3 - 二氫茛基, 1 - 氧基 - 5 - 羥基 - 2, 3 - 二氫茛基, 1 - 氧基 - 4 - 羥基 - 2, 3 - 二氫茛基, 1 - 氧基 - 2, 3 - 二氫茛基, 2 - 氧基 - 2, 3 - 二氫茛基, 2 - 氧基 - 7 - 羥基 - 2, 3 - 二氫茛基等。

苯環上的取代基的例舉如烷氧基, 三低級烷基取代砒烷基氧基, 低級烷基, 羥基, 低級烯基氧基, 低級烷硫基, 苯基, 低級烷磺醯, 低級烷基亞磺醯基, 鹵素原子, 硝基,



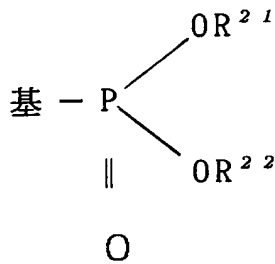
R^9 如同前述), 低級烷醯基, 低級烷醯基氧基, 烷氧基羰基, 氧基, 具有羥基, 低級烷氧基羰基, 苯基低級烷氧基或低級烷醯基氧基取代低級烷基以及低級烷醯基氧基所構成基群中選擇 1 ~ 4 個基為取代基的四氫吡喃基氧基, 脞基, 羥基磺醯基氧基, 低級烷氧基羰基取代低級烷氧基, 羧基取代低級烷氧基, 氫硫基, 低級烷氧基取代低級烷氧基, 具有羥基的低級烷基, 低級烯基, 具有低級烷基為其取代基的胺基硫基羰基氧基, 具有低級烷基為取代基的胺基羰基硫基, 低級烷醯基取代低級烷基以羧基,

(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 (17)



(上式中 R^{2'1}和 R^{2'2}可為相同或不同

構造，示氫原子或低級烷基。) ， 苯基低級烷氧基羰基，
環烷基，低級炔基，低級烷氧基羰基取代低級烷基，羧基
取代低級烷基，低級烷氧基羰基取代低級烯基，羧基取代低
級烯基，具有鹵素原子的低級烷基磺醯氧基及低級烷氧基
取代低級烷氧基羰基，具有鹵素原子的低級烯基以及苯基
低級烷氧基所構成基群中選擇 1 ~ 5 個基為其取代基的苯
基或具有低級伸烷基二氧基的苯基的例舉如苯基，2 - 甲
氧基苯基，3 - 甲氧基苯基，4 - 甲氧基苯基，2 - 乙氧
基苯基，3 - 乙氧基苯基，4 - 乙氧基苯基，4 - 異丙氧
基苯基，3 - 丁氧基苯基，4 - 戊氧基苯基，4 - 己氧基
苯基，3, 4 - 二甲氧基苯基，3 - 乙氧基 - 4 - 甲氧基
苯基，2, 3 - 二甲氧基苯基，3, 4 - 二乙氧基苯基，
3, 5 - 二甲氧基苯基，2, 5 - 二甲氧基苯基，2, 6
- 二甲氧基苯基，3, 4, 5 - 三甲氧基苯基，3, 4 -
二戊氧基苯基，2 - 甲基苯基，3 - 甲基苯基，4 - 甲基
苯基，2 - 乙基苯基，3 - 乙基苯基，4 - 乙基苯基，3
- 丁基苯基，4 - 異丙基苯基，4 - 戊基苯基，4 - 己基
苯基，3, 4 - 二甲基苯基，3, 4 - 二乙基苯基，2,
5 - 二甲基苯基，2, 6 - 二甲基苯基，3, 4, 5 - 三

(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 (18)

甲基苯基，2-羥基苯基，3-羥基苯基，4-羥基苯基，
 3,4-二羥基苯基，3,5-二羥基苯基，2,5-
 二羥基苯基，2,4-二羥基苯基，2,6-二羥基苯基，
 3,4,5-三羥基苯基，2-甲基硫基苯基，3-甲
 基硫基苯基，4-甲基硫基苯基，2-乙基硫基苯基，3
 -乙基硫基苯基，4-乙基硫基苯基，4-異丙基硫基苯
 基，4-戊基硫基苯基，4-己基硫基苯基，3,4-二
 甲基硫基苯基，3,4-二乙基硫基苯基，2,5-二甲
 基硫基苯基，2,6-二甲基硫基苯基，3,4,5-三
 甲基硫基苯基，2-苯基苯基，3-苯基苯基，4-苯基
 苯基，2-甲基磺醯基苯基，3-甲基磺醯基苯基，4-
 甲基磺醯基苯基，2-乙基磺醯基苯基，4-異丙基磺醯
 基苯基，4-戊基磺醯基苯基，4-己基磺醯基苯基，3
 ,4-二甲基磺醯基苯基，3,4-二乙基磺醯基苯基，
 2,5-二甲基磺醯基苯基，2,6-二甲基磺醯基苯基
 ,3,4,5-三甲基磺醯基苯基，2-氯苯基，3-氯
 苯基，4-氯苯基，2-氟苯基，3-氟苯基，4-氟苯
 基，2-溴苯基，3-溴苯基，4-溴苯基，2-碘苯基
 ,3-碘苯基，4-碘苯基，3,4-二氯苯基，3,5
 -二氯苯基，2,6-二氯苯基，2,3-二氯苯基，2
 ,4-二氯苯基，3,4-二氟苯基，3,5-二溴苯基
 ,3,4,5-三氯苯基，2,3,4,5,6-五氟苯
 基，2-硝基苯基，3-硝基苯基，4-硝基苯基，3,
 4-二硝基苯基，2,5-二硝基苯基，2,6-二硝基

(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 (19)

苯基，3，4，5-三硝基苯基，2-胺基苯基，3-胺基苯基，4-胺基苯基，2-甲基胺基苯基，3-乙基胺基苯基，4-丙基胺基苯基，2-異丙基胺基苯基，3-丁基胺基苯基，4-戊基胺基苯基，2-己基胺基苯基，4-二甲基胺基苯基，3-(N-甲基-N-乙基胺基)苯基，3-二己基胺基苯基，2-(N-甲基-N-乙醯胺基)苯基，4-(N-乙醯胺基)苯基，3-(N-乙醯胺基)苯基，4-(N-甲醯胺基)苯基，4-(N-異丁醯胺基)苯基，2-(N-戊醯胺基)苯基)，3，4-二(N-乙醯胺基)苯基，3，4-二胺基苯基，3，4，5-三胺基苯基，2，6-二胺基苯基，2，5-二胺基苯基，2-氨基甲醯基苯基，3-氨基甲醯基苯基，4-氨基甲醯基苯基，2-乙醯基苯基，3-乙醯基苯基，4-乙醯基苯基，2-甲醯基苯基，3-丙醯基苯基，4-異丁醯基苯基，2-戊醯基苯基，3-己醯基苯基，3，4-二乙醯基苯基，2，5-二乙醯基苯基，3，4，5-三乙醯基苯基，2-甲氧基羰基苯基，2-乙氧基羰基苯基，3-乙氧基羰基苯基，4-乙氧基羰基苯基，3-丙氧基羰基苯基，4-丁氧基羰基苯基，4-戊氧基羰基苯基，4-己氧基羰基苯基，3，4-二乙氧基羰基苯基，2，5-二乙氧基羰基苯基，2，6-二乙氧基羰基苯基，3，4，5-三乙氧基羰基苯基，2-羧基苯基，3-羧基苯基，4-羧基苯基，3，4-二羧基苯基，2，5-二羧基苯基，2，6-二羧基苯基，3，4，5-三羧

(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)

基苯基，3，4-伸甲基二氧基苯基，3，4-伸乙基二
 氧基苯基，2，3-伸丙基二氧基苯基，3，4-伸丁基
 二氧基苯基，3，5-二-第三丁基-4-羥基苯基，3
 -羥基-4-戊氧基苯基，2-羥基-5-第三丁基苯基
 ，3，5-二氯-4-胺基苯基，3-(N-乙醯胺基)
 -4-羥基苯基，3-胺基-4-羥基苯基，3-(N-
 甲基-N-乙醯胺基)-4-甲氧基苯基，3-硝基-4
 -(N-乙醯胺基)苯基，3-硝基-4-氯苯基，3-
 氯-4-甲基苯基，3-甲氧基-4-羥基苯基，3-羥
 基-4-甲氧基苯基，3-甲氧基-4-羥基-5-碘苯
 基，3，4-二甲氧基-5-溴苯基，3，5-二碘-4
 -羥基苯基，4-(二甲基，第三丁基矽烷氧基)苯基，
 3-(三-第三丁基矽烷氧基)苯基，2-(三甲基矽烷
 氧基)苯基，3-胺基-4-(二甲基，第三丁基矽烷氧
 基)苯基，4-丙烯基氧基苯基，2-乙烯基氧基苯基，
 3-(2-丁烯基氧基)苯基，2-(3-丁烯基氧基)
 苯基，3-(1-甲基丙烯基氧基)苯基，4-(2-戊
 烯基氧基)苯基，2-(2-己烯基氧基)苯基，3-甲
 基-4-丙烯基氧基苯基，3-甲氧基-4-十八烷基氧
 基苯基，4-二甲基醯胺基苯基，2-甲基醯胺基苯基，
 3-乙基醯胺基苯基，4-丙基醯胺基苯基，2-異丙基
 醯胺基苯基，3-丁基醯胺基苯基，4-戊基醯胺基苯基
 ，2-己基醯胺基苯基，3-二乙基醯胺基苯基，4-(
 N-甲基-N-丙基醯胺基)苯基，2-甲基亞磺醯基苯

(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)

基，3-甲基亞磺醯基苯基，4-甲基亞磺醯基苯基，2-乙基亞磺醯基苯基，3-乙基亞磺醯基苯基，4-乙基亞磺醯基苯基，4-異丙基亞磺醯基苯基，4-戊基亞磺醯基苯基，4-己基亞磺醯基苯基，3,4-二甲基亞磺醯基苯基，3,4-二乙基亞磺醯基苯基，2,5-二甲基亞磺醯基苯基，2,6-二甲基亞磺醯基苯基，3,4,5-三甲基亞磺醯基苯基，3-甲氧基-4-甲基亞磺醯基苯基，2-乙醯基氧基苯基，3-乙醯基氧基苯基，4-乙醯基氧基苯基，2-甲醯基氧基苯基，3-丙醯基氧基苯基，4-丁醯基氧基苯基，2-戊醯基氧基苯基，3-己醯基氧基苯基，3,4-二乙醯基氧基苯基，2,5-二乙醯基氧基苯基，3,4,5-三乙醯基氧基，3,5-雙(乙醯基胺基)苯基，2-脒基苯基，4-脒基苯基，3-脒基苯基，4-(4-甲基-1-六氫吡咩基)-3-硝基苯基，4-羥基磺醯基氧基苯基，3-羥基磺醯基氧基苯基，2-羥基磺醯基氧基苯基，4-羥基-3-乙醯基胺基苯基，4-(2,3,4,6-四-O-乙醯基-β-D-吡喃葡糖基氧基)苯基，4-(β-D-吡喃葡糖基氧基)苯基，4-(2,3,4,6-四-O-苯甲基-β-D-吡喃葡糖基氧基)苯基，3,5-雙(二甲基胺基)苯基，4-氯-3-硝基苯基，4-(4-甲基-1-六氫吡咩基)-3-硝基苯基，4-氰基苯基，3-乙醯基胺基-4-(4-甲基-1-六氫吡咩基)苯基，3-硝基-4-嗎福啉基苯基，4-(1-六

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝·····訂·····線

五、發明說明 (23)

- 胺基苯基, 3-羧基-5-胺基苯基, 5-甲氧基羰基
 - 3-溴-2-胺基苯基, 2-氰基苯基, 4-氰基苯基
 , 3-氰基苯基, 3-甲氧基羰基-4-羥基苯基, 3-
 羧基-4-羥基-5-(1, 1-二甲基-2-丙烯基)
 苯基, 2-羥基-3-羧基苯基, 3-羧基-4-羥基-
 5-(2-異丙烯基)苯基, 3-羧基-4-羥基-5-
 甲基苯基, 3-甲氧基羰基-4-甲氧基苯基, 3-甲氧
 基羰基-4-羥基-5-胺基苯基, 3-羧基-4-羥基
 -5-丙基苯基, 3-羧基-4-羥基-5-胺基苯基,
 3-羧基-4-羥基-5-氯苯基, 3-羧基-6-羥基
 苯基, 4-乙氧基苯基, 3, 4-二丁氧基苯基, 3, 4
 -二丙氧基苯基, 3-甲氧基-4-乙氧基苯基, 3-丙
 氧基-4-甲氧基苯基, 3-乙氧基-4-甲氧基苯基,
 3, 4-二癸氧基苯基, 2, 4-二乙氧基苯基, 3-乙
 氧基-4-丙氧基苯基, 3-羧基-4-羥基-5-異丁
 基苯基, 3-羧基-4-乙醯基胺基苯基, 3-羧基-4
 -羥基-5-(2-羥基乙基)苯基, 3-羧基-4-胺
 基-6-羥基苯基, 3-羧基-4-羥基-5-(2, 3-
 二羥基丙基)苯基, 3-羧基-4-胺基苯基, 3-羧基
 -4-乙醯基氧基苯基, 3-乙基-4-羥基苯基, 3-
 羧基-5-羥基苯基, 4-羧基-3, 5-二羥基苯基,
 3-羧基-4, 6-二羥基苯基, 5-甲氧基羰基-3-
 胺基-2-羥基苯基, 2-丙烯基氧基-5-甲氧基羰基
 苯基, 3-羧基-6-甲氧基苯基, 3-甲氧基羰基-6

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
 訂
 線

五、發明說明 (24)

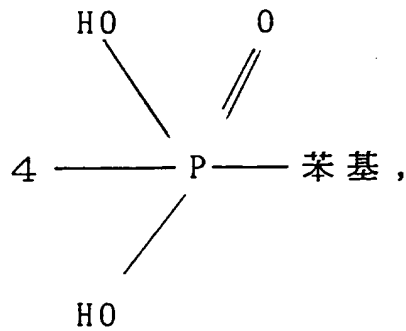
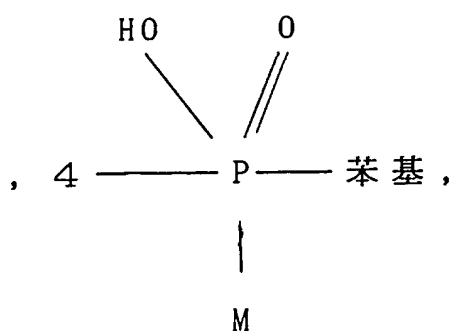
一 羥基苯基，3-羰基-6-丙烯基氧基苯基，3-羧基
 -5-硝基-6-羥基苯基，3-羧基-5-丙烯基-6
 -羥基苯基，3-羧基-6-羥基苯基，3-羧基-5-
 胺基-6-羥基苯基，3-甲氧基羰基-4-二甲基胺基
 硫基羰基氧基苯基，3-甲氧基羰基-4-二甲胺基羰基
 硫基苯基，3-甲氧基羰基-4-羥基-5-(2,3-
 二羥基丙基)苯基，3-甲氧基羰基-4-羥基-5-甲
 醯基甲基苯基，3-甲氧基羰基-4-羥基-5-(2-
 羥基乙基)苯基，3-乙氧基羰基-4-乙醯基胺基苯基
 ，3-甲氧基羰基-5-羥基苯基，3-甲氧基羰基-4
 -乙醯基胺基-6-羥基苯基，3-甲氧基羰基-6-甲
 氧基苯基，4-丙氧基-3-乙氧基苯基，3-甲氧基羰
 基-5-丙烯基-6-羥基苯基，3-甲氧基羰基-4-
 (2-丁烯基氧基)苯基，3-甲氧基羰基-4-羥基-
 5-(1-甲基-2-丙烯基)苯基，3-甲氧基羰基-
 4-(2-異戊烯基氧基)苯基，3-甲氧基羰基-4-
 羥基-5-(1,1-二甲基-2-丙烯基)苯，3-甲
 氧基羰基-4-(2-甲基-2-丙烯基氧基)苯基，3
 -甲氧基羰基-4-羥基-5-(2-甲基-2-丙烯基
)苯基，5-氯-4-羥基-3-甲氧基羰基苯基，3-
 甲氧基羰基-4-羥基-5-甲基苯基，3,5-二硝基
 -4-羥基苯基，4-羥基-3-壬基氧基羰基氧基，4
 -羥基-3-苯甲基氧基羰基苯基，4-羥基-3-(2
 -甲基-2-丙烯基)-5-苯甲基氧基羰基，4-羥基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
 訂
 線

五、發明說明 (25)

- 3 - (2 - 甲基 - 2 - 丙烯) - 5 - 壬基氧基羰基苯基



4 - [2 - (1 - 六氫吡咩基) 乙基胺基] - 3 - 羧基苯基, 4 - 甲氧基 - 3 - 羧基苯基, 2 - 甲基 - 4 - 羥基 - 5 - 羧基苯基, 3 - 乙基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 3 - (4 - 乙基 - 1 - 六氫吡咩基) - 4 - 羥基苯基, 4 - (2 - 羥基 - 3 - 羧基苯基) 苯基, 4 - [2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - 噁唑基] - 3 - 羥基 - 2 - 羧基苯基, 4 - 羥基 - 3 - 羥基甲基苯基, 4 - 乙氧基 - 3 - 羧基苯基, 4 - 正丁氧基 - 3 - 正丁氧基羰基苯基, 4 - 正丁氧基 - 3 - 羧基苯基, 3 - 乙醯基甲基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 3 - 正丁基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 3 - 丙烯基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 3 - 羥基甲基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 3 - 甲醯基 - 4 - 羥基 - 5 - 羧基苯基, 5 - (2 - 羧基乙基) - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - (2 - 甲氧基羧基乙基) - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 甲基胺基甲基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - (2 - 羧基乙烯基) - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - (

(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

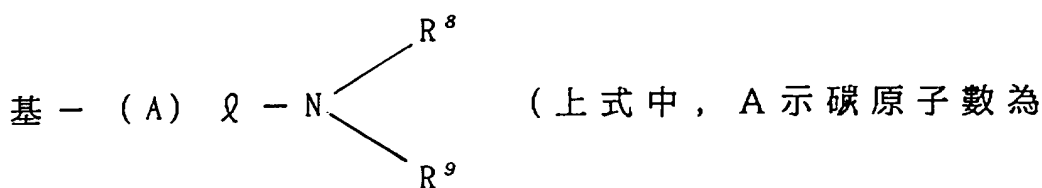
五、發明說明 (26)

2 - 甲氧基羧基乙烯基) - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 乙醯基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 苯基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 溴 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 氟基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 4, 5 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 甲氧基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 乙基胺基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 5 - 乙醯基胺基 - 4 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 3, 5 - 二羧基 - 4 - 羥基苯基, 4 - 甲氧基 - 3 - 羧基苯基, 4 - 乙氧基 - 3 - 羧基苯基, 4 - 正丁氧基 - 3 - 羧基苯基, 4 - 二甲基胺基 - 3 - 羥基苯基, 4 - 二甲基胺基 - 3 - 羥基甲基苯基, 4 - 二甲基胺基 - 3 - 甲氧基羧基苯基, 4 - 三氟甲基磺醯基氧基 - 3 - 甲氧基羧基苯基, 3 - 甲氧基甲氧基羧基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - (1 - 丙烯基) 苯基, 3 - 甲氧基甲氧基羧基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲醯苯基, 3 - 甲氧基甲氧基羧基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 乙醯基甲基苯基, 5 - (2 - 甲基 - 2 - 丙烯基) - 4 - 甲氧基甲氧基 - 3 - 甲氧基甲氧基羧基苯基等的苯環所具有取代基乃碳原子數為 1 ~ 18 的直鏈狀或歧鏈狀烷氧基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷基 3 個所取代的矽烷氧基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷基、羥基, 碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烯基氧基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷基硫基, 苯基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷基磺醯基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷基亞磺醯基, 鹵素原子, 硝基,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (27)



O

||

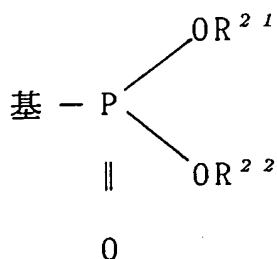
1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀伸烷基或基 - C - 。 ϱ 示 0 或 1 。 R^8 和 R^9 可為相同或不同構造, 示氫原子、碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基或含有碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基 1 ~ 2 個做為取代基的胺基在內的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基。另外, R^8 和 R^9 可以和其結合在一起的氮原子, 再介由氮原子或氧原子, 或不介由氮原子或氧原子而相互結合成為飽和或不飽和的 5 ~ 6 節環構造的雜環。該雜環上可具備的取代基有碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基或碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基。碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基, 氧基, 做為取代基具有羥基, 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基, 烷氧基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成苯基烷氧基, 羥基或具有 1 ~ 3 個由碳原子數為 2 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基所構成取鈦的碳原子數為 1 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷基以及碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基所構成基群

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (28)

所選出基 1 ~ 4 個做為其取代基的四氫嘧喃基氧基，脘基，羥基磺醯基氧基，烷氧基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基烷氧基，烷氧基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成羧基烷氧基，氫硫基，烷氧基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成的烷氧基烷氧基，具有 1 ~ 3 個羥基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基，碳原子數為 2 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烯基，其有 1 ~ 2 個碳原子數為 1 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷基做為取代基而且含有胺基的硫基羰基氧基，具有 1 ~ 2 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基為取代基而且含有胺基的羰基硫基，具有 1 ~ 3 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基以及羧基，



(上式中， R^{21} 和 R^{22} 可為相同

或不同構造，示氫原子或碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基。) 烷氧基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成苯基烷氧基，碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烯基，烷基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀

(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)

或枝鏈狀烷基所構成的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基烷基，烷基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基所構成的羧基烷基，烯基部分為碳原子數 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烯基所構成的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基烯基，烯基部分為碳原子數 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烯基所構成的羧基烯基，具有 1 ~ 3 個鹵素原子的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基磺醯基氧基，以及烷氧基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成的烷氧基烷氧基羰基，具有 1 ~ 3 個鹵素原子的碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烯基以及烷氧基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀苯基烷氧基所構成基群中選擇 1 ~ 5 個基為其取代基的苯基或具碳原子數為 1 ~ 4 個的直鏈狀或枝鏈狀伸烷基二氧基的苯基。

具有 1 ~ 2 個氮原子，氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基的例舉如吡咯烷基，六氫吡啶基，六氫吡嗪基，嗎啉基，吡啶基，1, 2, 5, 6 - 四氫吡啶基噻吩基，喹啉基，1, 4 - 二氫喹啉基，苯駢噻唑基，吡嗪基，嘧啶基，吡喇吡基噻吩基，吡咯基，羥基喹啉基，3, 4 - 二氫羥基喹啉基，1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉基，吡啶基，異吡啶基，吡啶基，苯駢咪唑基，苯駢噁唑基，咪唑烷基，異噻啉基，噻啉基，噻啉基，吡啶基，吡啶基，異吡啶基，異噻啉基，吡啶基，咪唑基，吡啶基，噻啉基，噻啉基

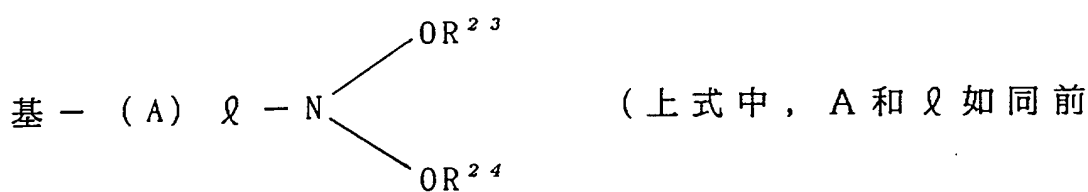
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (30)

基，苯駢呋喃基，2，3-二氫苯駢〔b〕呋喃基苯駢噻吩基，啡啶噻基，啡啶吡基，4H-吡啶基，1H-吡啶基，啡吡基，吡基，噻噁基，異吡啶噻基，2-咪啶噻基，2-吡咯噻基，呋喃基，噻啶基，異噻啶基，噻啶基，異噻啶基，吡喃基，吡啶噻基，2-吡啶噻基，噁啶基，1，4-苯駢噻吡基，3，4-二氫-2H-1，4-苯駢噻吡基，3，4-二氫-2H-1，4-苯駢噻吡基，1，4-苯駢噻吡基，1，2，3，4-四氫噻啶噻基，1，3-二噻基-2，4-二氫噻基，啡啶基，1，4-二噻基噻基，二苯駢〔b，e〕氮雜庚因，6，11-二氫-5H-二苯駢〔b，e〕氮雜庚因基等。

氧基，烷基，苯甲醯基，低級烷醯基，羥基，羧基，低級烷氧基羧基，低級烷基硫基，



述， R^{23} 和 R^{24} 可為相同或不同構造，示氫原子或低級烷基。 R^{23} 和 R^{24} 以及其所結合的氮原子一起，再介由或不介由氧原子或氮原子而互相結合成為飽和的5~6節環構造的雜環。該雜環上可具有低級烷基做為其取代基。) ， 氧基，具有羥基的低級烷基，苯基胺基硫基羧基以及具有低級烷基為其取代基所構成的胺基低級烷氧基羧基等所構

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (31)

成基群中選擇 1 ~ 3 個基做為取代基的上述雜環的具體例舉有二苯駢 [b , e] 氮雜庚因 - 3 - 基 - 6 - 酮 , 4 - 氧基 - 1 , 4 - 二氫喹啉基 , 1 - 氧基吡啶基 , 2 - 氧基吡啶基 , 1 - 甲基 - 3 , 4 - 二氫羥基喹啉基 , 1 - 乙基羥基喹啉基 , 1 - 丁基 - 3 , 4 - 二氫羥基喹啉基 , 1 - 己基羥基喹啉 , 1 - 十八烷基 - 3 , 4 - 二氫羥基喹啉基 , 3 - 氧基 - 4 - 甲基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻吡基 , 3 - 氧基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻吡基 , 1 - 苯甲醯基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氫喹啉基 , 1 - 十八烷基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氫喹啉基 , 1 - 苯甲醯基羥基喹啉基 , 4 - 苯甲醯基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻啞基 , 4 - 甲基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氫喹啉基 , 4 - 苯甲醯基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氫喹啉基 , 1 - 乙醯基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氫喹啉基 , 1 - 乙醯基 - 3 , 4 - 二氫羥基喹啉基 , 4 - 乙醯基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻啞基 , 4 - 苯甲醯基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻吡基 , 4 - 乙醯基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻吡基 , 4 - 乙醯基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氫喹啉基 , 1 - 甲基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氫喹啉基 , 7 - 羥基 - 3 , 4 - 二氫羥基喹啉 , 8 - 羥基 - 3 , 4 - 二氫羥基喹啉基 , 2 - 甲基硫基苯駢噻啞基 , 3 - 氧基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻吡基 , 1 - 乙醯基吡啶基 , 2 - 氧基苯駢咪啞基 , 4 - 甲基 - 3 , 4 - 二氫 - 2 H - 1 , 4 - 苯駢噻吡基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (32)

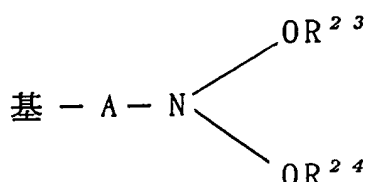
， 10 - 乙醯基啡噻吡基， 2 - 氧基苯駢噻唑基， 2 - 氧基苯駢噁唑基， 2 - 氧基 - 3 - 甲基苯駢噻唑基， 1, 3 - 二甲基 - 2 - 氧基苯駢咪唑基， 6 - 羥基 - 3, 4 - 二甲基喹啉基， 4 - 氧基吡啶基， 1 - 丙基 - 1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉基， 4 - 戊基 - 1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉基， 1 - 丙基 - 1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉基， 1 - 丁基 - 1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉基， 4 - 戊基 - 3, 4 - 二氫 - 2H - 1, 4 - 苯駢噻唑基， 4 - 己基 - 3, 4 - 二氫 - 2H - 1, 4 - 苯駢噁吡基， 2 - 乙基硫基苯駢噁唑基， 2 - 丙基硫代苯駢咪唑基， 2 - 丁基硫基苯駢噻唑基， 6 - 戊基羥基喹啉基， 7 - 己基硫基 - 3, 4 - 二氫羥基喹啉基， 2 - 羧基吡啶基， 2 - 羧基吡咯基， 2 - 乙氧基羰基吡啶基， 2 - 甲氧基羰基吡咯基， 1 - 甲基吡啶離子基， 1 - 甲基 - 1, 2, 5, 6 - 四氫吡啶基， 2 - 甲氧基羰基咪喃基， 2 - 羧基咪喃基， 2 - 二甲基胺基羰基吡啶基， 2 - 乙醯基吡咯基， 2 - 羥基甲基吡啶基， 2 - 乙氧基羰基 - 4 - 甲基吡啶基， 2 - 羧基 - 4 - 甲基吡啶， 2 - (4 - 甲基 - 1 - 六氫吡啶基) 羥基吡啶基， 2 - (2 - 二甲基胺基乙氧基羰基) 吡啶基， 2 - 二甲基胺基甲基吡啶基， 2 - 乙氧基羰基噻吩基， 2 - 甲基 - 7 - 羧基苯駢咪喃基， 2 - 羧基噻吩基， 4 - 乙氧基羰基噻唑基， 4 - 羧基噻唑基， 4 - 甲基 - 5 - 羧基噻唑基， 3 - 羧基吡啶基， 2, 2 - 二甲基 - 7 - 羧基 - 2, 3 - 二氫苯駢 [b] 咪喃基， 4 - 羧基吡啶基， 2 - 甲基 - 4 - 氨基甲醯基吡

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (33)

啶基，2，6-二甲基-3-氨基甲醯基吡啶基，2-苯基胺基硫基羰基吡啶基，2-甲基-3-羧基吡啶基，2，6-二甲基-3-羧基吡啶基等的氧基，碳原子數為1~18個的直鏈狀或枝鏈狀烷基，苯甲醯基，碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基，羥基，羧基，碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基以及碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基硫基、



(上式中，A和前述者相同。)

R²³和R²⁴可為相同或不同構造，示氫原子，或碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基。R²³和R²⁴可以和所結合的氮原子一起，再介由或不介由氮原子，氧原子而互相結合成為飽和的5~6節環構造的雜環。該雜環上可具有碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其取代基。) 羧基，具有1~3個羥基的碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基，苯基胺基硫基羰基以及具有1~2個碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其取代基且含有胺基的碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基所構成基群中選擇1~3個基的前述雜環例舉。

低級烯基氧基的例舉如乙烯基氧基，丙烯基氧基，2-丁烯基氧基，3-丁烯基氧基，1-甲基丙烯基氧基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (34)

2-戊烯基氧基，2-己烯基氧基等的碳原子數為2~6的直鏈狀或枝鏈狀烯基氧基。

低級烷基亞磺醯基的例舉如甲基亞磺醯基，乙基亞磺醯基，異丙基亞磺醯基，丁基亞磺醯基，第三丁基亞磺醯基，戊基亞磺醯基，己基亞磺醯基等碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基亞磺醯基。

低級烷醯基氧基的例舉如甲醯基氧基，乙醯基氧基，丙醯基氧基，丁醯基氧基，異丁醯基氧基，戊醯基氧基，第三丁基羧基氧基，己醯基氧基等碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基。

三低級烷基取代矽烷基氧基的例舉如三甲基矽烷基氧基，三乙基矽烷基氧基，三異丙基矽烷基氧基，三丁基矽烷基氧基，三第三丁基矽烷基氧基，三戊基矽烷基氧基，三己基矽烷基氧基，二甲基第三丁基矽烷基氧基等碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其3個取代基的矽烷基氧基。

苯環上具有低級烷氧基為其取代基，並且在低級烷基上具有羥基為其取代基的苯基低級烷基的例舉如苯甲基，2-苯基乙基，1-苯基乙基，3-苯基丙基，4-苯基丁基，1,1-二甲基-2-苯基乙基，5-苯基戊基，6-苯基己基，2-甲基-3-苯基丙基，2-甲氧基苯甲基，2-(3-甲氧基苯基)乙基，1-(4-甲氧基苯基)乙基，3-(2-乙氧基苯基)丙基，4-(3-乙氧基苯基)丁基，1,1-二甲基-2-(4-異丙氧

(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)

基苯基) 乙基, 5 - (4 - 戊基氧基苯基) 戊基, 6 - (4 - 己基氧基苯基) 己基, 3, 4 - 二甲氧基苯甲基, 2, 5 - 二甲氧基苯甲基, 2, 6 - 二甲氧基苯甲基, 3, 4, 5 - 三甲氧基苯甲基, 1 - 苯基 - 1 - 羥基甲基, 2 - 苯基 - 1 - 羥基乙基, 1 - 苯基 - 2 - 羥基乙基, 3 - 苯基 - 1 - 羥基丙基, 4 - 苯基 - 4 - 羥基丁基, 5 - 苯基 - 5 - 羥基戊基, 6 - 苯基 - 6 - 羥基己基, 2 - 甲基 - 3 - 苯基 - 3 - 羥基丙基, 1 - (2 - 甲氧基苯基) - 1 - 羥基甲基, 2 - (3 - 甲氧基苯基) - 1 - 羥基乙基, 3 - (2 - 乙氧基苯基) - 2 - 羥基丙基, 4 - (3 - 乙氧基苯基) - 3 - 羥基丁基, 5 - (4 - 戊基氧基苯基) - 4 - 羥基戊基, 6 - (4 - 己基氧基苯基) - 5 - 羥基己基, 6 - (4 - 己基氧基苯基) - 1 - 羥基己基, 1, 3, 4 - 二甲氧基苯基) - 1 - 羥基甲基, 1 - (3, 4, 5 - 三甲氧基苯基) - 1 - 羥基甲基等在苯環上具有 1 ~ 3 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷氧基為其取代基, 並且在其低級烷基上具有羥基的烷基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷基所構成的苯基烷基。

苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯甲醯基的例舉如苯甲醯基, 2 - 甲氧基苯甲醯基, 3 - 甲氧基苯甲醯基, 4 - 甲氧基苯甲醯基, 2 - 乙氧基苯甲醯基, 3 - 乙氧基苯甲醯基, 4 - 異丙氧基苯甲醯基, 4 - 戊氧基苯甲醯基, 4 - 己氧基苯甲醯基, 3, 4 - 二甲氧基苯甲醯基, 3 - 乙氧基 - 4 - 甲氧基苯甲醯基, 2, 3 - 二甲氧基苯

(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)

甲醯基，3，4-二乙氧基苯甲醯基，2，5-二甲氧基苯甲醯基，2，6-二甲氧基苯甲醯基，3，5-二甲氧基苯甲醯基，3，4-二戊氧基苯甲醯基，3，4，5-三甲氧基苯甲醯基等的苯環上具有1~3個碳原子數為1~6的直鏈狀或歧鏈狀烷氧基為其取代基的苯甲醯基。

苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯基低級烯基的例舉如苯丙烯基，苯乙烯基，4-苯基-3-丁烯基，4-苯基-2-丁烯基，5-苯基-4-戊烯基，5-苯基-3-戊烯基，5-苯基-2-戊烯基，6-苯基-5-己烯基，6-苯基-4-己烯基，6-苯基-3-己烯基，6-苯基-2-己烯基，2-甲基-4-苯基-3-丁烯基，2-甲基苯基丙烯基，1-甲基苯基丙烯基，2-甲氧基苯乙烯基，3-甲氧基苯丙烯基，4-甲氧基苯乙烯基，2-乙氧基苯丙烯基，3-乙氧基苯乙烯基，4-乙氧基苯乙烯基，2-丙氧基苯丙烯基，3-丙氧基苯乙烯基，4-丙氧基苯丙烯基，3-(第三丁氧基)苯乙烯基，4-戊氧基苯丙烯基，3-己氧基苯乙烯基，3，4-二甲氧基苯乙烯基，3，5-二甲氧基苯乙烯基，2，6-二甲氧基苯乙烯基，3，4-二乙氧基苯乙烯基，3，5-二乙氧基苯乙烯基，3，4，5-三甲氧基苯乙烯基，4-乙氧基苯基-3-丁烯基，4-(3-第三丁氧基苯基)-2-丁烯基，5-(4-己氧基苯基)-4-戊烯基，6-(3，4-二甲氧基苯基)-5-己烯基，6-(3，4，5-三乙氧基苯基)-3-己烯基等的苯

(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)

環上具有 1 ~ 3 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基為其取代基而且烯基部分為碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烯基所構成苯基烯基。

具有低級烷基為其取代基的烷基低級烷基的例舉如胺基甲基，2-胺基乙基，1-胺基乙基，3-胺基丙基，4-胺基丁基，5-胺基戊基，6-胺基己基，1,1-二甲基-2-胺基乙基，2-甲基-3-胺基丙基，甲基胺基甲基，1-乙基胺基乙基，2-丙基胺基乙基，3-異丙基胺基丙基，4-丁基胺基丁基，5-戊基胺基戊基，6-己基胺基己基，二甲基胺基甲基，(N-乙基-N-丙基胺基)甲基，2-(N-甲基-N-己基胺基)乙基等具有 1 ~ 2 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基為取代基而且含有胺基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基。

R⁸和 R⁹可和其所結合的氮原子一起，再介由或不介由氮原子或氧原子而互相結合所成飽和或不飽和的 5 ~ 6 節環構造的雜環的例舉如六氫吡啶基，吡咯烷基，嗎啉基，六氫吡啶基，吡咯基，咪唑基，吡啶基，2-吡咯啉基，2-咪唑啉基，咪唑烷基，2-吡啶啉基，吡啶啉基，1,2,5,6-四氫吡啶基等。

具有低級烷醯基或低級烷基為其取代基的上述雜環的例舉如 4-乙醯基六氫吡啶基，3-甲醯基吡咯烷基，2-丙醯基吡咯烷基，4-丁醯基六氫吡啶基，3-戊醯基六氫吡啶基，2-己醯基嗎啉基，4-甲基六氫吡啶基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (38)

4 - 乙基六氫吡啶基，3 - 乙基吡咯烷基，2 - 丙基吡咯烷基，4 - 丁基吡六氫吡啶基，3 - 戊基嗎啶基，2 - 己基六氫吡啶基，2 - 乙醯基吡咯基等的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基或碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基所取代的上述雜環。

苯基低級烷氧基的例舉如苯甲基氧基，2 - 苯基乙氧基，1 - 苯基乙氧基，3 - 苯基丙氧基，4 - 苯基丁氧基，1, 1 - 二甲基 - 2 - 苯基乙氧基，5 - 苯基戊基氧基，6 - 苯基己基氧基，2 - 甲基 - 3 - 苯基丙氧基等烷氧基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成苯基烷氧基。

羥基或低級烷醯基氧基取代低級烷基的例舉如羥基甲基，2 - 羥基乙基，1 - 羥基乙基，2 - 羥基丙基，2, 3 - 二羥基丙基，4 - 羥基丁基，1, 1 - 二甲基 - 2 - 羥基乙基，5, 5, 4 - 三羥基戊基，5 - 羥基戊基，6 - 羥基己基，1 - 羥基異丙基，2 - 甲基 - 3 - 羥基丙基，乙醯基氧基甲基，2 - 丙醯基氧基乙基，1 - 丁醯基氧基乙基，3 - 乙醯基氧基丙基，2, 3 - 二乙醯基氧基丙基，4 - 異丁醯基氧基丁基，5 - 戊醯基氧基戊基，6 - 第三丁基氧基羰基氧基己基，1, 1 - 二甲基 - 2 - 己醯基氧基乙基，1, 1 - 二甲基 - 2 - 己醯基氧基乙基，5, 5, 4 - 三乙醯基氧基戊基，2 - 甲基 - 3 - 乙醯基氧基丙基等的具有 1 ~ 3 個羥基或碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基所構成的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (39)

枝鏈狀烷基。

具有由羥基，低級烷氧基羰基，苯基低級烷氧基，羥基或低級烷醯基氧基取代低級烷基以及低級烷醯基氧基所構成基群中選擇 1 ~ 4 個基為其取代基的四氫吡喃基氧基的例舉如 (2 - , 3 - 或 4 -) 四氫吡喃基氧基，3, 4, 5 - 三羥基 - 6 - 甲氧基羰基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，3, 4, 5 - 三苯甲基氧基 - 6 - 羥甲基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，3, 4, 5 - 三乙醯基氧基 - 6 - 乙醯基氧基甲基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，3, 4, 5 - 三羥基 - 6 - 羥甲基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，3 - 羥基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，2, 4 - 二羥基 - 3 - 四氫吡喃基氧基，2, 3, 5 - 三羥基 - 4 - 四氫吡喃基氧基，3 - (2, 3 - 二羥基丙基) - 2 - 四氫吡喃基氧基，6 - 甲氧基羰基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，6 - (5, 5, 4 - 三羥基戊基) - 2 - 四氫吡喃基氧基，4 - 乙氧基羰基 - 3 - 四氫吡喃基氧基，4, 6 - 二甲氧基羰基 - 4 - 四氫吡喃基氧基，4, 5, 6 - 三甲氧基羰基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，2 - 丙氧基羰基 - 3 - 四氫吡喃基氧基，6 - 丁氧基羰基 - 4 - 四氫吡喃基氧基，6 - 戊基氧基羰基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，4 - 己基氧基羰基 - 3 - 四氫吡喃基氧基，3, 4, 5, 6 - 四羥基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，6 - 苯甲氧基 - 2 - 四氫吡喃基氧基，4 - (2 - 苯基乙氧基) - 3 - 四氫吡喃基氧基，4, 6 - 二苯甲基氧基 - 4 - 四氫吡喃基氧基，4, 5, 6 - 三苯甲基氧基 - 2 - 四氫吡喃基氧基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (40)

， 2 - (3 - 苯基丙氧基) - 3 - 四氫吡喃基氧基， 6 - (4 - 苯基丁氧基) - 4 - 四氫吡喃基氧基， 6 - (5 - 苯基戊基氧基) - 2 - 四氫吡喃基氧基， 4 - (6 - 苯基己基氧基) - 3 - 四氫吡喃基氧基， 3， 4， 5 - 三羥基 - 6 - 苯甲基氧基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 6 - 乙醯基氧基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 4 - 丙醯基氧基 - 3 - 四氫吡喃基氧基， 4， 6 - 二乙醯基氧基 - 4 - 四氫吡喃基氧基， 4， 5， 6 - 三乙醯基氧基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 2 - 丁醯基氧基 - 3 - 四氫吡喃基氧基， 6 - 戊醯基氧基 - 3 - 四氫吡喃基氧基， 4 - 己醯基氧基 - 3 - 四氫吡喃基氧基， 3， 4， 5 - 三羥基 - 6 - 乙醯基氧基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 6 - 羥甲基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 4 - (2 - 羥乙基) - 2 - 四氫吡喃基氧基， 4， 6 - 二羥甲基 - 4 - 四氫吡喃基氧基， 4， 5 - 二羥基甲基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 2 - (3 - 羥基丙基) - 3 - 四氫吡喃基氧基， 6 - 乙醯基氧基乙基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 4 - (2 - 乙醯基氧基乙基) - 2 - 四氫吡喃基氧基， 4， 6 - 二乙醯基氧基甲基 - 4 - 四氫吡喃基氧基， 4， 5， 6 - 三乙醯基氧基甲基 - 2 - 四氫吡喃基氧基， 2 - (3 - 丙醯基氧基丙基) - 3 - 四氫吡喃基氧基， 6 - (4 - 丁醯基氧基丁基) - 4 - 四氫吡喃基氧基， 6 - (5 - 羥基戊基) - 2 - 四氫吡喃基氧基， 4 - (6 - 己醯基氧基己基) - 3 - 四氫吡喃基氧基， 3， 4， 5 - 三羥基甲基 - 6 - 乙醯基氧基甲基四氫吡喃基氧基等具有羥基， 碳原子數

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (41)

為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基，烷氧基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成苯基烷氧基，具有 1 ~ 3 個羥基或碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基為其取代基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基，以及碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基所構成基群中選擇 1 ~ 4 個取代基的四氫吡喃基氧基。

六氫吡啶環上具有低級烷基為其取代基的六氫吡啶基低級烷基的例舉如 (1 - 六氫吡啶基) 甲基，2 - (1 - 六氫吡啶基) 乙基，1 - (1 - 六氫吡啶基) 乙基，3 - (1 - 六氫吡啶基) 丙基，4 - (1 - 六氫吡啶基) 丁基，5 - (1 - 六氫吡啶基) 戊基，6 - (1 - 六氫吡啶基) 己基，1, 1 二甲基 - 2 - (1 - 六氫吡啶基) 乙基，2 - 甲基 - 3 - (1 - 六氫吡啶基) 丙基，(4 - 甲基 - 1 - 六氫吡啶基) 甲基，2 - (4 - 乙基 - 1 - 六氫吡啶基) 乙基，1 - (4 - 丙基 - 1 - 六氫吡啶基) 乙基，3 - 4 - (丁基 - 1 - 六氫吡啶基) 丙基，4 - (4 - 戊基 - 1 - 六氫吡啶基) 丁基，5 - (4 - 己基 - 1 - 六氫吡啶基) 戊基，6 - (3, 4 - 二甲基 - 1 - 六氫吡啶基) 己基，1, 1 - 二甲基 - (3, 4, 5 - 三甲基 - 1 - 六氫吡啶基) 乙基等的在六氫吡啶環上具有 1 ~ 3 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其取代基而且低級烷基部分的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基所構成的六氫吡啶基烷基。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (43)

5, 4-三羥基戊基, 5-羥基戊基, 6-羥基己基, 1-羥基異丙基, 2-甲基-3-羥基丙基等的含有1~3個羥基的碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基。

低級烯基的例舉如乙烯基, 丙烯基, 2-丁烯基, 3-丁烯基, 1-甲基丙烯基, 2-戊烯基, 2-己烯基等的碳原子數為2~6的直鏈狀或枝鏈狀烯基。

具有低級烷基為其取代基的胺基硫基羰基氧基的例舉如胺硫甲醯基氧基, 甲胺硫甲醯基氧基, 乙胺硫甲醯基氧基, 丙胺硫甲醯基氧基, 異丙胺硫甲醯基氧基, 丁胺硫甲醯基氧基, 戊胺硫甲醯基氧基, 己胺硫甲醯基氧基, 二甲胺硫甲醯基氧基, (N-乙基-N-丙胺基) 硫甲醯基氧基, (N-甲基-N-己胺基) 硫甲醯基氧基等的具有1~2個碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其取代基而且含有胺基的硫基羰基氧基。

具有低級烷基為其取代基的胺基羰基硫基的例舉如胺基羰基硫基, 甲胺基羰基硫基, 乙胺基羰基硫基, 丙胺基羰基硫基, 3-異丙胺基羰基硫基, 丁胺基羰基硫基, 戊胺基羰基硫基, 己胺基羰基硫基, 二甲胺基羰基硫基, (N-乙基-N-丙胺基) 羰基硫基, (N-甲基-N-己胺基) 羰基硫基等的具有1~2個碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其取代基而且含有胺基的羰基硫基。

低級烷醯基取代低級烷基的例舉如甲醯基甲基, 乙醯基甲基, 2-丙醯基乙基, 1-丁醯基乙基, 3-乙醯基丙基, 2, 3-二乙醯基丙基, 4-異丁醯基丁基, 5-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (44)

戊醯基戊基，6-第三丁基羰基己基，1，1-二甲基-2-己醯基乙基，5，5，4-三乙醯基戊基，2-甲基-3-乙醯基丙基等的具有1~3個碳原子數為1~6的直鏈狀或歧鏈狀烷醯基為取代基的碳原子數為1~6的直鏈狀或歧鏈狀烷基。

苯環上具有1~3個低級烷氧基為取代基的苯基的例舉如苯基，2-甲氧基苯基，3-甲氧基苯基，4-甲氧基苯基，2-乙氧基苯基，3-乙氧基苯基，4-乙氧基苯基，4-異丙氧基苯基，4-戊氧基苯基，4-己氧基苯基，3，4-二甲氧基苯基，3-乙氧基-4-甲氧基苯基，2，3-二甲氧基苯基，3，4-二乙氧基苯基，2，5-二甲氧基苯基，2，6-二甲氧基苯基，3-丙氧基-4-甲氧基苯基，3，5-二甲氧基苯基，3，4-二戊基氧基苯基，3，4，5-三甲氧基苯基，3-甲氧基-4-乙氧基苯基等的苯環上具有1~3個碳原子數為1~6的直鏈狀或歧鏈狀烷氧基為取代基的苯基。

具有氧基的吡啶基的例舉如2-吡啶基，3-吡啶基，4-吡啶基，2-氧基-3-吡啶基，4-氧基-2-吡啶基，1-氧基-3-吡啶基，3-氧基-2-吡啶基等的具有氧基的吡啶基。

具有氧基的喹啉基的例舉如2-喹啉基，3-喹啉基，4-喹啉基，5-喹啉基，6-喹啉基，7-喹啉基，8-喹啉基，2-氧基-4-喹啉基，2-氧基-7-喹啉基，2-氧基-5-喹啉基，2-氧基-8-喹啉基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (45)

4 - 氧基 - 6 - 嗒啉基等具有氧基的嗒啉基。

苯環上具備有低級烷醯基氧基，經基磺醯基氧基，氧基，脞基，硝基，低級烷基磺醯基為取代基，以及具有由經基，低級烷氧基羰基，苯基低級烷氧基，低級烷醯基氧基取代低級烷基和低級烷醯基氧基所構成群中選擇 1 ~ 4 個基為其取代基的四氫吡喃基所構成基群中選擇 1 ~ 3 個基為其取代基的苯基的例舉如 2 - 乙醯基氧基苯基，3 - 乙醯基氧基苯基，4 - 乙醯基氧基苯基，2 - 甲醯基氧基苯基，3 - 丙醯基氧基苯基，4 - 異醯基氧基苯基，2 - 戊醯基氧基苯基，3 - 己醯基氧基苯基，3, 4 - 二乙醯基氧基苯基，2, 5 - 二乙醯基氧基苯基，3, 5 - 二乙醯基氧基苯基，3, 4, 5 - 三乙醯基氧基苯基，4 - 經基磺醯基氧基苯基，3 - 經基磺醯基氧基苯基，2 - 經基磺醯基氧基苯基，4 - 氧基苯基，3 - 氧基苯基，2 - 氧基苯基，4 - 脞基苯基，3 - 脞基苯基，2 - 脞基苯基，2 - 硝基苯基，3 - 硝基苯基，4 - 硝基苯基，3, 4 - 二硝基苯基，2, 5 - 二硝基苯基，2, 6 - 二硝基苯基，3, 4, 5 - 三硝基苯基，3, 5 - 二硝基 - 4 - 乙醯基氧基苯基，4 - 甲基磺醯基苯基，2 - 甲基磺醯基苯基，3 - 甲基磺醯基苯基，2 - 乙甲基磺醯基苯基，4 - 異丙基磺醯基苯基，4 - 戊基磺醯基苯基，4 - 己基磺醯基苯基，3, 4 - 二甲基磺醯基苯基，3, 4 - 二乙基磺醯基苯基，2, 5 - 二甲基磺醯基苯基，2, 6 - 二甲基磺醯基苯基，3, 4, 5 - 三甲基磺醯基苯基，4 - (2, 3

(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)

， 4， 6 - 四 - O - 乙醯基 - β - D - 葡糖吡喃糖基氧基) 苯基， 4 - (β - D - 葡糖吡喃糖基氧基) 苯基， 4 - (2， 3， 4， 6 - 四 - O - 苯甲基 - β - D - 葡糖吡喃糖基氧基) 苯基等的苯環上具有由碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基， 羥基磺醯基氧基， 氰基， 脞基， 硝基， 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基磺醯基以及具有羥基， 碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基， 烷氧基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基的苯基烷氧基， 碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基 1 ~ 3 個做為取代基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基以及碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基所構成基群中選擇 1 ~ 4 個為其取代基的四氫吡喃基氧基所構成基群中選擇 1 ~ 3 個為其取代基的苯基。

具有低級烷醯基的胺基的例舉如胺基， 甲醯基胺基， 乙醯基胺基， 丙醯基胺基， 丁醯基胺基， 異丁醯基胺基， 戊醯基胺基， 第三丁基羰基胺基， 己醯基胺基等的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基為其取代基的胺基。

噻唑基環上具有低級烷氧基在苯環上的苯基為其取代基的噻唑基， 羧基以及羥基所構成基群中選擇的基為取代基的苯基的例舉如苯基， 2 - (3， 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (噻唑基苯基， [2 - (4 - 甲氧基苯基) - 4 - 噻唑基] 苯基， [4 - (3， 4， 5 - 三甲氧基苯基) - 2 - 噻唑基] 苯基， [5 - (3 - 丙氧基苯基) - 2 - 噻

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (47)

啞基] 苯基, [2 - (2 - 丁氧基苯基) - 4 - 噁啞基] 苯基, 2 - 羥基 - 3 - 羧基苯基, 2 - 羥基苯基, 3 - 羥基苯基, 4 - 羥基苯基, 3, 4 - 二羥基苯基, 3, 5 - 二羥基苯基, 2, 5 - 二羥基苯基, 2, 4 - 二羥基苯基, 2, 6 - 二羥基苯基, 3, 4, 5 - 三羥基苯基, 2 - 羧基苯基, 3 - 羧基苯基, 4 - 羧基苯基, 3, 4 - 二羧基苯基, 2, 5 - 二羧基苯基, 2, 6 - 二羧基苯基, 3, 4, 5 - 三羧基苯基, 3 - 羧基 - 4 - 羥基苯基, 3 - 羧基 - 6 - 羥基苯基等的噁啞環上具有 1 ~ 3 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷氧基在苯環上的苯基為其取代基的噁啞基, 羧基以及羥基所構成基群中選擇 1 ~ 3 個基為其取代基的苯基。

六氫吡啶基低級烷基的例舉如 (1 - 六氫吡啶基) 甲基, 2 - (1 - 六氫吡啶基) 乙基, 1 - (1 - 六氫吡啶基) 乙基, 3 - (1 - 六氫吡啶基) 丙基, 4 - (1 - 六氫吡啶基) 丁基, 5 - (2 - 六氫吡啶基) 戊基, 6 - (3 - 六氫吡啶基) 己基, 1, 1 - 二甲基 - 2 - (4 - 六氫吡啶基) 乙基, 2 - 甲基 - 3 - (1 - 六氫吡啶基) 丙基等的烷基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或歧鏈狀烷基的六氫吡啶基烷基。

烷氧基羧基的例舉如前述低級烷氧基羧基之外, 再加庚氧基羧基, 己氧基羧基, 壬氧基羧基, 癸氧基羧基, 十一烷氧基羧基, 十二烷氧基羧基, 十三烷氧基羧基, 十四烷氧基羧基, 十五烷氧基羧基, 十六烷氧基羧基, 十七烷

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (48)

氧基羰基，十八烷氧基羰基等的碳原子數為 1 ~ 18 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基。

具有低級烷基為其取代基的胺基低級烷氧基羰基的例舉如胺基甲氧基羰基，2-胺基乙氧基羰基，1-胺基乙氧基羰基，3-胺基丙氧基羰基，4-胺基丁氧基羰基，5-胺基戊氧基羰基，6-胺基己氧基羰基，1,1-二甲基-2-胺基乙氧基羰基，2-甲基-3-胺基丙氧基羰基，甲胺基甲氧基羰基，1-乙胺基乙氧基羰基，2-丙胺基乙氧基羰基，3-異丙胺基丙氧基羰基，4-丁胺基丁氧基羰基，5-戊胺基戊氧基羰基，6-己胺基己氧基羰基，二甲胺基甲氧基羰基，2-二甲胺基乙氧基羰基，3-二甲胺基丙氧基羰基，(N-乙基-N-丙胺基)甲氧基羰基，2-(N-甲基-N-己胺基)乙氧基羰基等的具有 1 ~ 2 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其取代基且含有胺基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基。

苯基低級烷氧基羰基的例舉如苯甲基氧基羰基，2-苯基乙氧基羰基，1-苯基乙氧基羰基，3-苯基丙氧基羰基，4-苯基丁氧基羰基，1,1-二甲基-2-苯基乙氧基羰基，5-苯基戊氧基羰基，6-苯基己氧基羰基，2-甲基-3-苯基丙氧基羰基等的烷氧基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基的苯基烷氧基羰基。

低級炔基的例舉如乙炔基，2-丙炔基，2-丁炔基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (49)

， 3 - 丁炔基， 1 - 甲基 - 2 - 丙炔基， 2 - 戊炔基， 2 - 己炔基等的碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀炔基。

羧基取代低級烷基的例舉如羧基甲基， 2 - 羧基乙基， 1 - 羧基乙基， 3 - 羧基丙基， 4 - 羧基丁基， 5 - 羧基戊基， 6 - 羧基己基， 1, 1 - 二甲基 - 2 - 羧基乙基， 2 - 甲基 - 3 - 羧基丙基等的烷基部分為碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基的羧基烷基。

低級烷氧基羧基低級烯基的例舉如 2 - 甲氧基羧基乙烯基， 3 - 甲氧基羧基丙烯基， 2 - 乙氧基羧基乙烯基， 4 - 乙氧基羧基 - 2 - 丁烯基， 6 - 丙氧基羧基 - 3 - 己烯基， 5 - 異丙氧基羧基 - 1 - 戊烯基， 1, 1 - 二甲基 - 2 - 丁氧基羧基 - 2 - 丙烯基， 2 - 甲基 - 3 - 第三丁氧基羧基 - 1 - 丙烯基， 2 - 戊氧基羧基乙烯基， 4 - 己氧基羧基 - 1 - 丁烯基等的烯基部分為碳原子數 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烯基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羧基烯基。

羧基取代低級烯基的例舉如 2 - 羧基乙烯基， 3 - 羧基丙烯基， 4 - 羧基 - 2 - 丁烯基， 6 - 羧基 - 3 - 己烯基， 5 - 羧基 - 1 - 戊烯基， 1, 1 - 二甲基 - 2 - 羧基 - 2 - 丙烯基， 2 - 甲基 - 3 - 羧基 - 1 - 丙烯基， 5 - 羧基 - 4 - 戊烯基， 4 - 羧基 - 1 - 丁烯基等的烯基部分為碳原子數 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烯基的羧基烯基。

R^{23} 和 R^{24} 可以和所結合的氮原子一起，再介由或不介由氮原子或氧原子而互相結合所構成飽和的 5 ~ 6 節環

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (50)

構造的雜環的例舉如六氫吡啶基，吡咯烷基，嗎啉基，六氫吡啶基等。

具有低級烷基取代基的上述雜環的例舉如4-甲基六氫吡啶基，4-乙基六氫吡啶基，3-乙基吡咯烷基，2-丙基吡咯烷基，4-丁基六氫吡啶基，3-戊基嗎啉基，2-己基六氫吡啶基等具有碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基為其取代基的上述雜環。

具有鹵素原子的低級烷基磺醯基氧基的例舉如甲基磺醯基氧基，乙基磺醯基氧基，丙基磺醯基氧基，異丙基磺醯基氧基，第三丁基磺醯基氧基，戊基磺醯基氧基，己基磺醯基氧基，氯甲基磺醯基氧基，溴甲基磺醯基氧基，碘甲基磺醯基氧基，三氟甲基磺醯基氧基，2-氟乙基磺醯基氧基，2, 2-二氟乙基磺醯基氧基，2, 2, 2-三氟乙基磺醯基氧基，3-氟丙基磺醯基氧基，4-氟丁基磺醯基氧基，3, 4-二氟丁基磺醯基氧基，3-氟戊基磺醯基氧基，2, 3, 4-三氟戊基磺醯基氧基，2, 3-二氟己基磺醯基氧基，6, 6-二溴己基磺醯基氧基等的具有1~3個鹵素原子的碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基磺醯基氧基。

低級烷氧基取代低級烷氧基羰基的例舉如甲氧基甲氧基羰基，3-甲氧基丙氧基羰基，乙氧基甲氧基羰基，4-乙氧基丁氧基羰基，6-丙氧基己氧基羰基，5-異丙氧基戊氧基羰基，1, 1-二甲基-2-丁氧基乙氧基羰基，2-甲基-3-第三丁氧基丙氧基羰基，2-戊氧基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (51)

乙氧基羰基，己氧基甲氧基羰基等的烷氧基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基所構成碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基烷氧基羰基。

苯環上具有 1 ~ 3 個低級烷氧基為其取代基的苯基的例舉如苯基，2 - 甲氧基苯基，3 - 甲氧基苯基，4 - 甲氧基苯基，2 - 乙氧基苯基，3 - 乙氧基苯基，4 - 乙氧基苯基，4 - 異丙氧基苯基，3 - 丁氧基苯基，4 - 戊氧基苯基，4 - 己氧基苯基，3, 4 - 二甲氧基苯基，3 - 乙氧基 - 4 - 甲氧基苯基，2, 3 - 二甲氧基苯基，3, 4 - 二乙氧基苯基，3, 5 - 二甲氧基苯基，2, 5 - 二甲氧基苯基，2, 6 - 二甲氧基苯基，3, 4, 5 - 三甲氧基苯基，3, 4 - 二戊氧基苯基等的苯環上具有 1 ~ 3 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基為其取代基的苯基。

具有氧基的吡啶基的例舉如吡啶基，2 - 氧基吡啶基，3 - 氧基吡啶基，4 - 氧基吡啶基等具有氧基的吡啶基。

具有氧基的喹啉基的例舉如 2 - 氧基喹啉基，4 - 氧基喹啉基等。

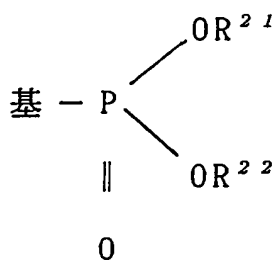
苯環上具有低級烷醯基氧基，羥基磺醯基氧基，氰基，磷基，硝基，低級烷基磺醯基為取代基，或具有由羥基，低級烷氧基羰基，苯基低級烷氧基，羥基或低級烷醯基氧基取代低級烷基以及低級烷醯基氧基等基群中選擇 1 ~ 4 個基為其取代基的四氫吡喃基氧基，噻唑環上具有苯環

(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)

上含有低級烷氧基的苯基為其取代基的噻唑基，羧基，以及經基所構成基群中選擇的基及其取代基的苯基，具有經基的低級烷基，以及



(上式中，R^{2'1}和R^{2'2}所示如同前

述) 所構成基群中選擇 1 ~ 3 個為其取代基的苯基的例舉如 2 - 甲基硫基苯基，3 - 甲基硫基苯基，4 - 甲基硫基苯基，2 - 乙基硫基苯基，3 - 乙基硫基苯基，4 - 乙基硫基苯基，4 - 異丙基硫基苯基，4 - 戊基硫基苯基，4 - 己基硫基苯基，3, 4 - 二甲基硫基苯基，3, 4 - 二乙基硫基苯基，2 - 乙醯基氧基苯基，3 - 乙醯基氧基苯基，4 - 乙醯基氧基苯基，2 - 甲醯基氧基苯基，3 - 丙醯基氧基苯基，4 - 異丁醯基氧基苯基，2 - 戊醯基氧基苯基，3 - 己醯基氧基苯基，3, 4 - 二乙醯基氧基苯基，3, 5 - 二乙醯基氧基苯基，2, 5 - 二乙醯基氧基苯基，3, 4, 5 - 三乙醯基氧基苯基 - 二甲基硫基苯基，2, 6 - 二甲基硫基苯基，3, 4, 5 - 三甲基硫基苯基，2 - 苯基苯基，3 - 苯基苯基，4 - 苯基苯基，2 - 甲基磺醯基苯基，3 - 甲基磺醯基苯基，4 - 甲基磺醯基苯基，2 - 乙基磺醯基苯基，4 - 異丙基磺醯基苯基，4 -

(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 (53)

戊基磺醯基苯基，4-己基磺醯基苯基，3,4-二甲基磺醯基苯基，2,5-二甲基磺醯基苯基，2,6-二甲基磺醯基苯基，3,4,5-三甲基磺醯基苯基，2-脞基苯基，4-脞基苯基，3-脞基苯基，3-硝基苯基，4-羥基磺醯基氧基苯基，3-羥基磺醯基氧基苯基，2-羥基磺醯基氧基苯基，4-(2,3,4,6-四-O-乙醯基-β-D-葡糖吡喃糖基氧基)苯基，4-(β-D-葡糖吡喃糖基氧基)苯基，4-(2,3,4,6-四-O-苯甲基-β-D-葡糖吡喃糖基氧基)苯基，3,5-雙(二甲胺基)苯基，2-硝基苯基，4-硝基苯基，3,4-二硝基苯基，3,4,5-三硝基苯基，3,5-二硝基苯基，2-氰基苯基，4-氰基苯基，3-氰基苯基，3-(2,3-二羥基丙基)苯基，3-(2-羥基乙基)苯基，4-(2-羥基-3-羧基苯基)苯基，4-[2-(3,4-二乙氧基苯基-4-噻唑基)]苯基，3-羥基甲基苯基，



等的苯環上具有碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基，羥基，磺醯基氧基，氰基，脞基，硝基，碳原子

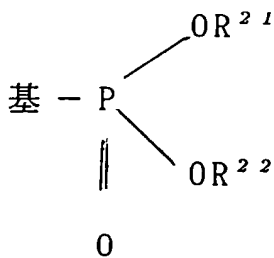
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (54)

數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基硫基，碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基磺基為取代基，或具有羥基，碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基羰基，烷氧基部分為碳原子數 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基的苯基烷氧基，羥基或碳原子數為 2 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基等 1 ~ 3 個為其取代基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基，以及碳原子數為 2 ~ 6 個的直鏈狀或枝鏈狀烷醯基氧基所構成基群中選擇 1 ~ 4 個基為取代基的四氫吡喃基氧基，噻唑環上具有苯基取代基而該苯環上具有 1 ~ 3 個碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基為其取代基所構成的噻唑基，羧基以及羥基所構成基群中選擇 1 ~ 3 個基為取代基的苯基，具有 1 ~ 3 個羥基為其取代基的碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基，以及



(上式中， R^{21} 和 R^{22} 可為相同或

不同構造。示氫原子或碳原子數為 1 ~ 6 的直鏈狀或枝鏈狀烷基。) 所構成基群中選擇 1 ~ 3 個基為取代基的苯基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (55)

。

低級烷氧基取代低級烷基的例舉如甲氧基甲基，3-甲氧基丙基，乙氧基甲基，4-乙氧基丁基，6-丙氧基己基，5-異丙氧基戊基，1, 1-二甲基-2-丁氧基乙基，2-甲基-3-第三丁氧基丙基，2-戊基氧基乙基，己基氧基甲基等的烷基部分為碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基的碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷氧基烷基。

具有鹵素原子的低級烯基的例舉如2, 2-二溴乙烯基，2-氯乙烯基，1-氯乙烯基，3-碘丙烯基，4, 4-二氯-2-丁烯基，4, 4, 3-三溴-3-丁烯基，3-氯-1-甲基丙烯基，5-溴-2-戊烯基，5, 6-二氟-2-己烯基等具有1~3個鹵素原子為其取代基的碳原子數為2~6的直鏈狀或枝鏈狀烯基。

苯基低級烷基的例舉如苯甲基，2-苯基乙基，1-苯基乙基，3-苯基丙基，4-苯基丁基，5-苯基戊基，6-苯基己基，1, 1-二甲基-2-苯基乙基，2-甲基-3-苯基丙基等的烷基部分的碳原子數為1~6的直鏈狀或枝鏈狀烷基所構成苯基烷基。

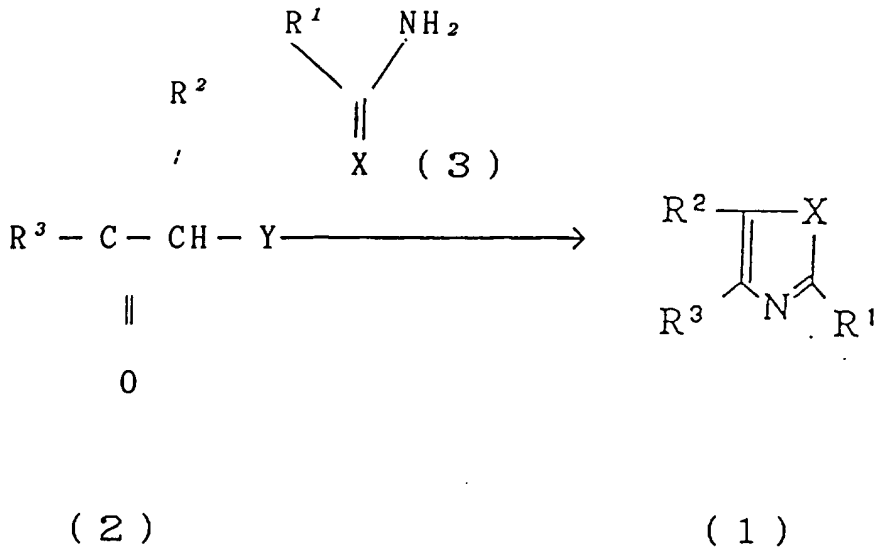
本發明中以一般式(1)所示本發明化合物，舉例之，可由下列方法製造之。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (56)

[反應式 - 1]



[上式中，Z，R¹，R²和R³所示意義如同前述。Y示鹵素原子。]

化合物(2)和化合物(3)的反應在適當溶劑中加熱而進行。上述所用溶劑的例舉如甲醇，乙醇，丙醇，丁醇，3-甲氧基-1-丁醇，乙基溶纖劑，甲基溶纖劑等的醇類，苯，甲苯，二甲苯，鄰-二氯苯等芳香族碳氫類，二乙醚，四氫呋喃，二噁烷，二乙二醇二甲醚(diglyme)，乙二醇二甲醚(monoglyme)等醚類，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳等鹵化碳氫類，二甲基甲醯胺，二甲基亞砷，六甲基磷酸三醯胺，乙腈等的極性溶劑等或上述溶劑的混合溶劑。上述反應通常在室溫~150℃下進行，其中在室溫~100℃左右範圍下進行1~15小時左右為宜。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

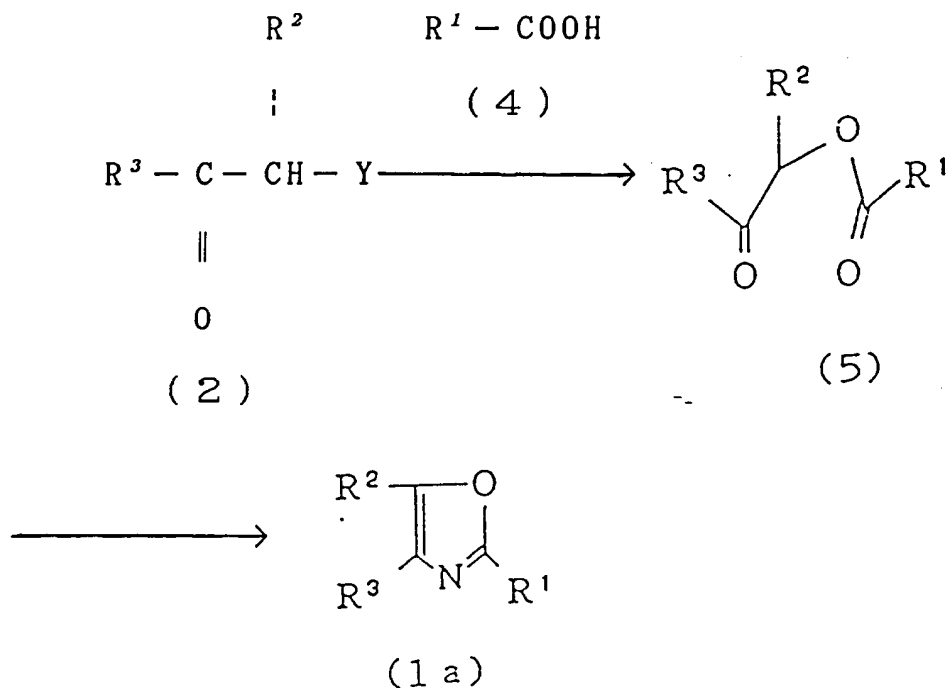
裝
訂
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (57)

化合物 (3) 的用量對化合物 (2) 而計，至少使用相等莫耳 ~ 1.5 倍莫耳左右為宜。

[反應式 - 2]



[上式中，R¹，R²，R³和Y所示意義如同前述。]

化合物 (2) 和化合物 (4) 的反應於適當溶劑中，鹼性化合物存在下進行。上述所使用溶劑的例舉如甲醇，乙醇，丙醇等低級醇類，二乙醚，四氫呋喃，二噁烷，乙二醇單甲基醚等醚類，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳等鹵化碳氫類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，乙酸甲酯，乙酸乙酯等酯類，丙酮、甲·乙基酮等酮類，乙腈，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺等極性溶劑

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (58)

或其混合溶劑等。所使用鹼性化合物的例舉如氫氧化鈉，氫氧化鉀，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鈉，碳酸氫鉀，氫化鈉等無機鹼性化合物，金屬鈉，金屬鉀等鹼金屬類，乙醇鈉，甲醇鈉等鹼金屬醇鹽類，三乙胺，吡啶，N，N-二甲基苯胺，N-甲基嗎啉，4-甲基胺基吡啶，雙環〔4，3，0〕壬烯-5（簡稱為DBN），1，8-重氮雙環〔5，4，0〕十一烯-7（簡稱為DBU），1，4-重氮雙環〔2，2，2〕辛烷（簡稱為DABCO）等有機鹼性化合物。

化合物（4）的使用量對化合物（2）而言，至少使用相等莫耳量，其中以使用相等莫耳~1.5倍莫耳量左右為較宜。

上述反應通常在室溫~200℃範圍進行，其中以室溫~150℃範圍進行1~5小時左右為理想。

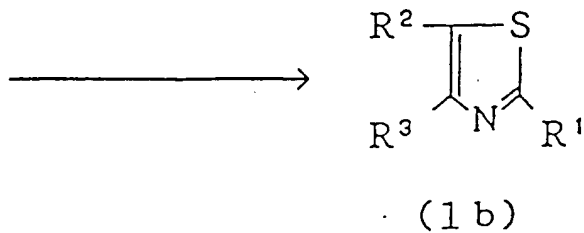
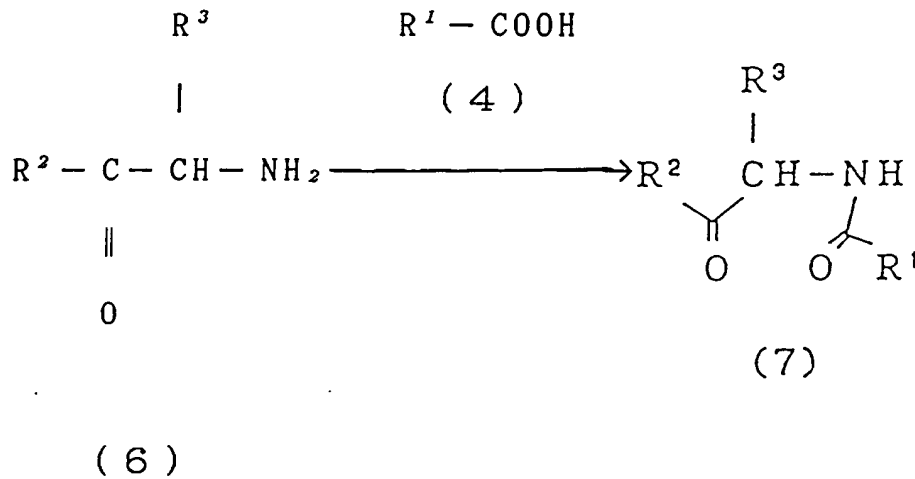
將化合物（5）變化為化合物（1a）的反應，可在適當溶劑中，氨水、乙酸銨、氯化銨、硫酸銨等銨鹽之存在下反應而達成。所使用溶劑如前述化合物（2）和化合物（4）的反應之際所利用溶劑皆可利用之外，乙酸等烷酸類也可使用。氨水或銨鹽的用量對化合物（5）而言，至少使用相等莫耳量，以使用相等莫耳~5倍莫耳量為宜。該反應適當在室溫~200℃範圍進中，尤以在室溫~150℃附近進行1~5小時左右為宜。

（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)

[反應式 - 3]



[上式中，R¹，R²和R³所示意義如同前述。]

化合物(6)和化合物(4)的反應利用一般醯胺結合生成反應方法而完成。

上述反應中，羧酸(4)可採用其活化衍生物。上述醯胺結合生成反應可利用一般常見的該反應的反應條件。

例如(甲)混合酞法，換言之，將羧酸(4)和鹵化羧酸烷酯反應製得混合酞類，再和化合物(6)反應的方法，

(乙)活化酯或活化醯胺法，易言之，將羧酸(4)和例如對-硝基苯基酯，N-羥基琥珀醯亞胺酯，1-羥基苯

(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 (60)

駢三唑酯等的活性酯類，或苯駢咪唑基-2-硫酮等製成為活化醯胺後，再和化合物(6)反應之方法，(丙)，碳化二亞胺法，改言之，將羧酸(4)和化合物(6)在例如二環己基碳化二醯胺，羧基二咪唑等脫水劑的存在下進行脫水反應而合成的方法，(丁)，酸醯鹵法，直言之，將羧酸(4)變化成醯鹵衍生物後和化合物(6)反應的方法，(戊)其他方法，例如利用乙酐等脫水劑將羧酸(4)變成羧酸酐後，再和化合物(6)反應的方法，或羧酸(4)和例如低級醇類所形成酯類化合物後在高溫高壓下和化合物(6)進行反應的方法。另外，先以三苯基磷或二乙基氫磷酸鹽等磷化物將羧酸(4)活化後，再和化合物(6)反應的方法也可供採用。

混合酐法中所使用鹵化羧酸烷酯的例舉如氯甲酸甲酯，溴甲酸甲酯，氯甲酸乙酯，溴甲酯乙酯，氯甲酸異丁酯等。混合酐通常依照蕭典-保曼反應而製造之。反應後通常不再分離反應生成物而直接和化合物(6)反應而製造化合物(7)。蕭典-保曼反應一般在鹼性化合物存在下進行之。所使用鹼性化合物為蕭典-保曼反應常用之化合物，舉例之，如三乙胺，三甲胺，吡啶，二甲基苯胺，N-甲基嗎啉，4-二甲基胺基吡啶，DBN，DBU，DABCO等的有機鹼性化合物，碳酸鉀，碳酸鈉，碳酸氫鉀，碳酸氫鈉等的無機鹼性化合物。上述反應通常在-20~100℃範圍下進行，其中以0~50℃下進行為宜。反應時間在5分鐘~10小時範圍，其中以5分鐘~

(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)

2 小時範圍為宜。所得混合酐和化合物 (6) 的反應在 $-20^{\circ} \sim 150^{\circ} \text{C}$ 下進行，其中以 $10 \sim 50^{\circ} \text{C}$ 下進行為宜。反應時間在 5 分鐘 \sim 10 小時範圍，尤以 5 分鐘 \sim 5 小時範圍為較宜。混合酐法不必特別使用溶劑，但通常還是在溶劑中進行反應。所用溶劑為混合酐法中常用之溶劑均可使用，具體言之，二氯甲烷，氯仿，二氯乙烷等鹵化碳氫類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，二乙醚，二異丙醚，四氫呋喃，二甲氧基乙烷等的醚類，乙酸甲酯，乙酸乙酯等酯類，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺等的非質子性極性溶劑等。該反應中羧酸 (4)，烷基鹵化羧酸以及化合物 (6) 的使用比率通常至少使用相等莫耳量，但以對羧酸 (4) 而計，分別使用烷基鹵化羧酸和化合物 (6) 1 \sim 2 倍莫耳量為較宜。

上述 (乙) 的活化酯法或活化醯胺法，以利用苯駢噁唑基 - 2 - 硫酮醯胺為例舉而言，使用不影響反應的適當溶劑，例如上述混合酐法所使用相同種類的溶劑之外，他如利用 1 - 甲基 - 2 - 吡咯酮等，在 $0 \sim 150^{\circ} \text{C}$ 下，其中尤宜在 $10 \sim 100^{\circ} \text{C}$ 下，進行 0.5 \sim 7.5 小時的反應而達成。化合物 (6) 和苯駢噁唑基 - 2 - 硫酮醯胺的使用比率，對前者而言，後者至少要用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳 \sim 2 倍莫耳量。另外，使用 N - 羥基琥珀酸亞醯胺酯為例舉而言，在適當鹼性化合物存在下，反應就能順利完成，上述鹼性化合物可採用後述羧酸醯鹵法中所使用相同種類者。

(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)

鹼氣，三溴氯化磷，五氯化磷，五溴化磷等。羧酸 (4) 和鹵化劑的使用比率並無特別限制，可適宜選用。但在無溶劑下進行反應時，對前者而言，通常使用大量後者，另外在溶劑中進行反應時，通常對前者而言，後者至少使用相等莫耳左右，尤宜採用 2 ~ 4 倍莫耳量。其反應溫度和時間也沒有特別限制。通常在室溫 ~ 100 °C 左右，尤宜在 50 ~ 80 °C 之下進行進行 30 分鐘 ~ 6 小時左右而完成。

使用三苯基磷或二乙基氯磷酸鹽，氰基磷酸二乙酯等磷化物將羧酸 (4) 活化後，再和化合物 (6) 反應的方法，可在適當溶劑中進行。上述溶劑祇要不影響反應的溶劑種類皆可使用。具體言之，例如二氯甲烷，氯仿，二氯乙烷等鹵化碳氫類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，二乙醚，四氫呋喃，二甲氧基乙烷等醚類，乙酸甲酯，乙酸乙酯等酯類，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺等的非質子性極性溶劑等。上述反應中，化合物 (6) 本身可兼有鹼性化合物的功能，因此較之理論量而言，使用過量時能促進反應之進行。但必要時，尚可添加其他的鹼性化合物，例如三乙胺，三甲胺，吡啶，二甲基胺基吡啶，DBN，DBU，DABCO 等的有機鹼性化合物，碳酸鉀，碳酸鈉，碳酸氫鉀，碳酸氫鈉等無機鹼性化合物皆可採用。上述反應大約在 0 ° ~ 150 °C 下進行，尤宜在大約 0 ° ~ 100 °C 下大約進行 1 ~ 30 小時而結束反應。對於化合物 (6) 的磷化物和羧酸 (4) 的使

(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)

用比率，通常分別使用至少在相等莫耳量，尤以採用 1 ~ 3 倍莫耳量為宜。

將化合物 (7) 衍化為化合物 (16) 的反應，可在 2, 4 - 雙 (4 - 甲氧基苯基) - 1, 3 - 二噁基 - 2, 4 - 二磷乙烷 - , 2, 4 - 二硫化物 [勞遜氏試劑 (Lawesson's reagent)]，五硫化磷等的硫化劑存在下，於適當溶劑中或無溶劑下反應而製造之。上述反應中所用溶劑例如前述反應式 - 2 的化合物 (2) 和化合物 (4) 的反應中所採用任意溶劑皆可使用。

硫化劑的使用量對化合物 (7) 而言，通常採用 0.5 ~ 2 倍莫耳量，尤宜採用 0.5 ~ 1.5 倍莫耳量。

上述反應通常在 50 ~ 300 °C 下進行，尤宜在 50 ~ 250 °C 附近進行 1 ~ 7 小時左右而完成。

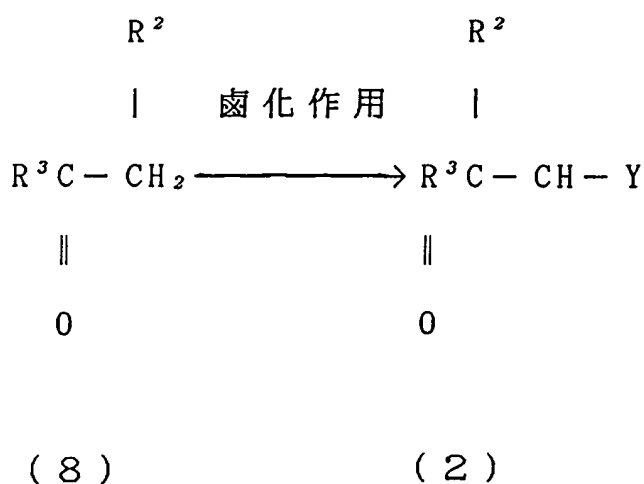
原料化合物 (2) 可按照下列反應式 4 或 5 的方法而製造之。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (65)

〔反應式 - 4〕



(上式中， R^2 ， R^3 和 Y 所示意義如同前述。)

化合物(8)的鹵化反應，在適當溶劑中鹵化劑的存在下進行。上述反應中所使用的鹵化劑，例如溴，氯等鹵素分子，氯化碘，磺醯氯，溴化亞銅等銅化物，N-溴化琥珀酸亞醯胺，N-氯化琥珀酸亞醯胺等N-鹵化琥珀酸亞醯胺皆可採用。所用溶劑例如二氯甲烷，二氯乙烷，氯仿，四氯化碳等鹵化碳氫類，乙酸，丙酸等脂肪酸類，二硫化碳等皆可採用。

鹵化劑的用量對化合物(8)而計，通常使用相等莫耳~10倍莫耳量，其中以採用相等莫耳~5倍莫耳量為較宜。

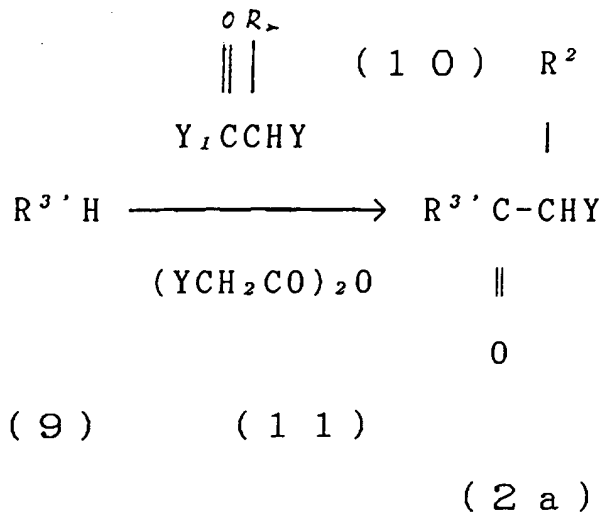
上述反應通常在 0°C ~溶劑沸點溫度範圍內進行。尤宜在 0°C ~ 100°C 左右下進行5分鐘~20小時而結束反應。

(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)

[反應式 - 5]



(上式中，R²和Y所示意義如同前述。Y₁示鹵素原子。R^{3'}示氫原子，低級烷基，低級烷氧基羰基低級烷基，低級烷氧基羰基，氨基甲醯基低級烷基，苯環上具有低級烷氧基而且低級烷基上具有羥基為其取代基的苯基低級烷基，苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯甲醯基，苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯基低級烯基以及金鋼烷基以外的前述R³所示者。]

化合物(9)和化合物(10)或化合物(11)的反應，一般按弗瑞迪-克來福特氏反應(Friedel-Crafts reaction)在適當溶劑中路易士酸的存在下進行。本反應中所使用路易士酸為諸反應中所使用任何路易士酸，例如鋁化氯，氯化鋅，氯化鐵，氯化錫，三溴化硼，三氟化硼，濃硫酸等均可使用。反應中所使用溶劑的例舉有二

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (68)

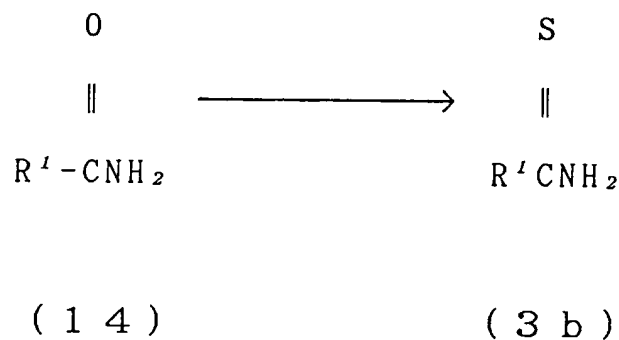
物 (2) 和化合物 (4) 的反應中所使用任何溶劑皆可採用。

上述反應中所用酸的種類，舉例之，如鹽酸，溴氫酸，硫酸等礦酸均可利用。

化合物 (13) 的使用量，對化合物 (12) 而計，通常使用相等莫耳量～5倍莫耳量，其中以採用相等莫耳～3倍莫耳量為宜。

上述反應通常在室溫～200℃下進行，尤宜在室溫～150℃附近下，進行1～1.5小時左右而完成。

[反應式 - 7]



[上式中，R¹所示意義如同前述。]

將化合物 (14) 衍化為化合物 (3b) 的反應，可在適當溶劑中，硫化劑的存在下進行而達成。

上述反應中所使用溶劑，祇要是前述反應式 - 2 中的化合物 (2) 和化合物 (4) 的反應所使用任何溶劑皆可使用。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (68)

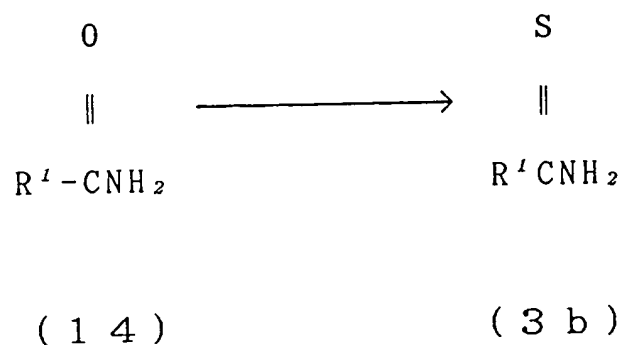
物 (2) 和化合物 (4) 的反應中所使用任何溶劑皆可採用。

上述反應中所用酸的種類，舉例之，如鹽酸，溴氫酸，硫酸等礦酸均可利用。

化合物 (13) 的使用量，對化合物 (12) 而計，通常使用相等莫耳量～5倍莫耳量，其中以採用相等莫耳～3倍莫耳量為宜。

上述反應通常在室溫～200℃下進行，尤宜在室溫～150℃附近下，進行1～1.5小時左右而完成。

[反應式 - 7]



[上式中，R¹所示意義如同前述。]

將化合物 (14) 衍化為化合物 (3b) 的反應，可在適當溶劑中，硫化劑的存在下進行而達成。

上述反應中所使用溶劑，祇要是前述反應式 - 2 中的化合物 (2) 和化合物 (4) 的反應所使用任何溶劑皆可使用。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (69)

上述反應中所使用硫化劑，例如五硫化磷，勞遜氏試劑 (Lawesson's reagent) 等。

硫化劑的使用比率，通常在 1 ~ 10 倍莫耳量，其中以採用 1 ~ 2 倍莫耳量為較宜。

上述反應通常在室溫 ~ 150 °C 下進行，尤宜在室溫 ~ 100 °C 左右下進行 10 分鐘 ~ 5 小時左右而結束反應。

一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 由至少一個第三級的氮原子所構成 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時，因氧化而該雜環殘基的至少一個氮原子會氧化 ($N \rightarrow O$) 而衍化成為氧化物。另外，一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為至少含一低級烷基硫基的苯基時，也在相同條件下因氧化而衍化成為至少含有一個低級烷基亞磺醯基或低級烷基磺醯基的苯基的衍生物。

另外，上述二種基群 (至少含有一個第三級氮原子的 5 ~ 15 節環構造的單環、雙環或三環構造的雜環雜基，或至少含有一個低級烷基硫基的苯基) 同時存在時，上述氧化條件下也可能同時氧化，但這些生成物容易分離而得其純品。

上述氧化反應可在適當溶劑中，氧化劑的存在下進行。上述反應中所使用溶劑的例舉如水，甲酸，乙酸，三氟乙酸等有機酸，甲醇，乙醇等醇類，氯仿，二氯甲烷等鹵化碳氫類或其混合溶劑等。所使用氧化劑的例舉如過甲酸，過乙酸，過三氟乙酸，過苯甲酸，間一氯過苯甲酸，

(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)

劑例如鈀、鈀黑、鈀碳、白金、氧化鉑、亞鉻酸銅，拉尼鎳等皆可採用。催化劑的用量對原料化合物而計，一般使用0.02~1倍量左右為宜。反應溫度通常在-20~100℃左右，尤宜在0~70℃附近，氫壓在1~10氣壓下，一般進行0.5~20小時左右而結束反應。本還原反應雖然利用上述催化劑加氫反應也可達成，但以藉氫化還原劑而進行還原為較宜。上述所用氫化還原劑的例舉如氫化鋁鋰，氫化硼鈉，乙硼烷等。其使用量對原料化合物而言，通常至少使用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳~15倍莫耳量範圍。上述還原反應通常在適當溶劑中，例如水，甲醇，乙醇，異丙醇等低級醇類，四氫呋喃，二乙醚，二異丙醚，二乙二醇二甲醚 (diglyme) 等的醚類或上述的混合溶劑中進行，反應溫度通常大約在-60~150℃範圍，其中以-30~100℃大約反應10分鐘~10小時左右為較宜。另外，利用氫化鋁鋰或乙硼烷之際，所用溶劑以二乙醚，二異丙醚，四氫呋喃，二乙二醇二甲醚的無水溶劑為較宜。

化合物(1)中， R^1 或 R^3 為至少含有一個低級烷氧基或低級烷氧基取代低級烷氧基為其取代基的苯基時，可藉脫烷基反應或脫烷氧基烷基反應而衍化得至少含有一個羥的苯基。

上述脫烷基反應可在適當溶劑中，鈀碳，鈀黑等接觸還原用催化劑的存在下，0~100℃左右，氫壓1~10氣壓下反應0.5~3小時左右而達成，上述反應中

(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)

所用溶劑，例如水，甲醇、乙醇、異丙醇等低級醇類，二噁烷，四氫呋喃等醚類，乙酸等或其混合溶劑皆可使用。另外，尚可在溴氫酸、鹽酸等酸和水、甲醇、乙醇、異丙醇等溶劑的混合物中，30~150℃下，尤宜在50~120℃下加熱處理而衍化成為R¹或R³係羟基的化合物(1)。另外，該化合物的加水分解也可以在適當溶劑中，酸或鹼性化合物的存在下進行。上述溶劑的例舉如水、乙醇、異丙醇等低級醇類，二噁烷，四氫呋喃等醚類，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳等鹵化碳氫化合物類，乙腈等極性溶劑，乙酸等脂肪酸，或上述之混合溶劑等皆可採用。上述所用的酸類，例如鹽酸、硫酸、溴氫酸等礦酸類，三氟乙酸等有機酸，三氟化硼，三溴化硼，氯化鋁等路易士酸，碘化鈉，碘化鉀等碘化物，上述路易士酸和碘化物的混合物等。另外，鹼性化合物的例舉如氫氧化鈉，氫氧化鉀，氫氧化鈣等金屬氫氧化物等。上述反應通常在室溫~200℃下進行，尤其在室溫~150℃下可得順利進行，一般反應0.5~50小時左右而完成。

化合物(1)中，R¹或R³為至少含有一個羟基的苯基時，可藉烷基化反應而衍化成為至少含有一個低級烷氧基或低級烷氧基取代低級烷氧基的苯基。上述烷基化反應例如在適當溶劑中，鹼性化合物的存在下，和硫酸二甲酯等硫酸二烷基酯或重氮甲烷，下列一般式所示化合物等烷基化劑等反應而達成。

(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)

對一羰基過苯甲酸等的過酸，過氧化氫，偏過碘酸鈉，重鉻酸，重鉻酸鈉，重鉻酸鉀等重鉻酸鹽，過錳酸，過錳酸鉀，過錳酸鈉等過錳酸鹽類等。

氧化劑的用量通常的原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，其中以使用相等莫耳 \sim 2倍莫耳量為較宜。上述反應通常在 $0^{\circ}\sim 40^{\circ}\text{C}$ 下進行，其中以在 $0^{\circ}\text{C}\sim$ 室溫附近範圍下進行1 \sim 15小時左右為宜。

上述一般式(1)中的 R^1 或 R^3 ，示至少含有一個N-氧化基的5 \sim 15節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時，可以在四氫化苯，二苯基醚，二乙二醇二甲醚，乙醚等高沸點溶劑中，通常以 $100\sim 250^{\circ}\text{C}$ ，尤宜在 $100\sim 200^{\circ}\text{C}$ 附近下反應1 \sim 10小時左右而衍化成為至少含有一個氧基的5 \sim 15節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基。

一般式(1)的 R^1 或 R^3 為鄰接於雜環上的氮原子至少具有一個氧基的5 \sim 15節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時，可藉還原反應而將其氧基的至少一個衍化成為亞甲基的衍生物。

上述還原反應的方法，例如在適當溶劑中催化劑的存在在下，利用加氫反應而達成。上述反應中所使用溶劑的例舉如水，乙酸，甲醇，乙醇，異丙醇等醇類，己烷，環己烷等碳化氫類，二乙二醇二甲醚，二噁烷，四氫呋喃，二乙醚等醚類，乙酸乙酯，乙酸甲酯等酯類，二甲基甲酰胺等非質子性極性溶劑或其混合溶劑等。又所使用的催化

(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)

R⁵Y

(15)

[上式中，R⁵示低級烷基或低級烷氧基取代低級烷基，Y示鹵素原子。]

上述反應中所採用溶劑的例舉如甲醇、乙醇、丙醇等低級醇類，二乙醚，四氫呋喃，二噁烷，乙二醇二甲醚等醚類，苯、甲苯、二甲苯等芳香族碳氫類，乙酸甲酯、乙酸乙酯等酯類，丙酮，甲、乙基酮等酮類，乙腈，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺等極性溶劑等或其混合溶劑等。所採用鹼性化合物的例舉如氫氧化鈉，氫氧化鉀，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鈉，碳酸氫鉀，氫化鈉等無機鹼性化合物，金屬鈉，金屬鉀等鹼金屬類，乙醇鈉，甲醇鈉等鹼金屬醇鹽類，三乙胺，吡啶，N，N-二甲基苯胺，N-甲基嗎啉，4-甲基胺基吡啶，DBN，DBU，以及DABC O等有機鹼性化合物等。

烷基化劑的用量對原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，尤宜使用相等莫耳~5倍莫耳量。

上述反應通常在0~150℃下，尤宜在室溫~100℃左右下反應0.5~20小時左右而結束。

化合物(1)中，R¹或R³為至少具有一個烷氧基羰基，低級烷氧基取代低級烷氧基羰基，或低級烷氧基羰基取代烯基或低級烷氧基羰基低級烷基為其取代基的苯基，或至少具有一個低級烷氧基羰基且含有1~2個氮原子，氧原子或硫原子所構成5~15節環的單環、雙環、三環

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (74)

等構造的雜環殘基時，可經由加水分解而衍化成為至少具有一個羧基、羧基取代低級烯基，或羧基取代低級烷基為其取代基的苯基，或至少具有一個羧基而含有 1 ~ 2 個氮原子，氧原子或硫原子所構成 5 ~ 15 節環的單環、雙環、三環等構造的雜環殘基。

上述加水分解反應可利用一般任何加水分解反應的條件而進行，具體言之，例如在碳酸鈉、碳酸鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀，氫氧化鋇等鹼性化合物，硫酸，鹽酸，硝酸等礦酸，乙酸，芳香族磺酸等有機酸等的存在下，水，甲醇、乙醇、異丙醇等醇類，丙酮，甲、乙基酮等酮類，二噁烷，乙二醇二甲醚等醚類、乙酸等溶劑或上述的混合溶劑中進行。上述反應通常在室溫 ~ 200 °C，尤宜在室溫 ~ 180 °C 左右下進行，通常反應 10 分鐘 ~ 30 小時左右而完成。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 係以含有一個低級烷基或低級烷醯基的胺基為其至少一個取代基的苯基，而 R^8 和 R^9 再和其結合的氮原子一起形成飽和的 5 ~ 6 節環構造的雜環而具有二級氮原子或至少具有一個二級的氮原子的 5 ~ 15 節環的單環、雙環、或三環構造的雜環殘基時，可藉烷基化反應而衍化作為含有 1 ~ 2 個低級烷基或低級烷基以及低級烷醯基的胺基為其至少一個取代基的苯基， R^8 和 R^9 以及其所結合的氮原子一起形成 5 ~ 6 節環的飽和雜環，氮原子上有低級烷基取代的雜環或至少具有一個含低級烷基取代基的氮原子的 5 ~ 15 節環所構成單環、

(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)

雙環或三環構造的雜環殘基。該反應中當上述二基（至少含有一個胺基的苯基，至少含有一個二級氮原子的 5 ~ 1 5 節環的單環、雙環、或三環構造的雜環殘基或胺基低級烷基）共存時，同時會烷基化，但這些合成生成物容易分離而得。

上述烷基化反應可在適當的不活性溶劑中，脫鹵化氫劑的存在下，和下列一般式 (15) 所示化合物反應而完成。



[上式中， R^5 和 Y 所示意義如同前述。]

上述不活性溶劑的例舉如二氯甲烷、氯仿等鹵化碳氫化合物類、四氫呋喃、二乙醚等醚類，苯、甲苯、二甲苯等芳香族碳氫類，乙酸甲酯，乙酸乙酯等酯類，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺，乙腈，丙酮，乙酸，吡啶，水等極性溶劑等。所使用脫鹵化氫劑的例舉如三乙胺、三甲胺，吡啶，二甲基苯胺，N-甲基嗎啉，4-二甲基胺基吡啶，4-(1-吡咯烷基)吡啶，1,5-重氮雙環[4,3,0]壬烯-5 (簡稱為DBN)，1,8-重氮雙環[5,4,0]十一烯-7 (簡稱為DBU)，1,4-重氮雙環[2,2,2]辛烷 (簡稱為DABCO)，乙酸鈉等有機鹼性化合物，氫化鈉，碳酸鉀，碳酸鈉，碳酸氫鉀，碳酸氫鈉，氫氧化鉀，氫氧化

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (76)

鈉等無機鹼性化合物。化合物 (15) 的用量對於原料化合物而計，通常至少為相等莫耳，尤宜採用相等莫耳~3倍莫耳量。上述反應通常在 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ 左右，尤宜在 $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 下進行。反應時間為5分鐘~15小時左右即可結束。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為含有一個低級烷基的胺基至少一個為其取代基的苯基，至少含有一個羥基為其取代基的苯基或至少含有一個二級氮原子的5~15節環所構成單環、雙環、或三環構造的雜環殘基， R^8 和 R^9 以及其所結合的氮原子一起形成飽和的5~6節環構造的雜環，而具有二級氮原子時，或至少具有一個四氫吡喃氧基為取代基且該基又至少要具有一個羥基或羥基取代低級烷基為其取代基所構成的苯基時，藉低級烷醯化反應而衍化變成為以含有一個低級烷醯基或低級烷醯基以及低級烷基的胺基至少一個為其取代基的苯基，至少含有一個低級烷醯基氧基為其取代基的苯基或氮原子上具有低級烷醯基取代基的氮原子至少一個的5~15節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基， R^8 和 R^9 以及其所結合的氮原子一起形成飽和的5~6節環構造的雜環，氮原子上有低級烷醯基取代的雜環或至少具有一個四氫吡喃基氧基且該基上至少又含有一個低級烷醯基氧基或低級烷醯基氧基取代低級烷基為其取代基所構成的苯基。該反應中上述三個基（至少具有一個胺基而胺基上含有一個低級烷基所構成的苯基，至少含有一個羥基的苯基，或至少含有一個二級氮原子的

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝·····訂·····線·····

五、發明說明 (77)

5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基) 共存時，同時可能被烷醯化，但這些合成混合物容易分離而得。

上述烷醯化反應以下列一般式 (16) 或 (17) 所示化合物等烷醯化劑在無溶劑下或適當的溶劑中，鹼性化合物的存在或不存在下進行，但以鹼性化合物共存中進行為較宜。



或



(上式中， R^6 示低級烷醯基。Y 所示如同前述。)

上述適當溶劑的例舉如前述芳香族碳化氫類，甲醇，乙醇，丙醇等的低級醇類，二甲基甲醯胺，二甲亞砷等之外，氯仿，二氯甲烷等鹵化碳氫化合物類，丙酮，吡啶等皆可使用。上述鹼性化合物的例舉如三乙胺，吡啶等第三級胺類，氫氧化鈉，氫氧化鉀，氫化鈉等。上述低級烷醯化劑的使用比率，對原料化合物而言，採用相等莫耳量以上，尤宜採用相等莫耳 ~ 10 倍莫耳量。反應通常在室溫 ~ 200 °C 下進行，尤宜在室溫 ~ 150 °C 下進行 0.5 ~ 1.5 小時左右而結束反應。

(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)

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為至少含有一個二級氮原子的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時，以下列一般式 (18) 所示化合物反應而衍化成為在氮原子上有苯甲醯基取代的氮原子至少一個的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基。



(上式中， R^1 示苯甲醯基。Y 示鹵素原子。)

上述反應可和前述烷化反應相同條件下進行。

化合物 (1) 的 R^1 或 R^3 為至少含有一個羧基的苯基或至少含有一個羧基的氮原子、氧原子或硫原子 1 ~ 2 個的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時，可藉酯化反應而衍化成為至少含有一個烷氧基羰基或苯基低級烷氧基羰基的苯基或至少含有一個苯基或低級烷氧基羰基的氮原子，氧原子或硫原子 1 ~ 2 個的 5 ~ 15 節環的單環、雙環、或三環構造的雜環殘基。

上述酯化反應可在鹽酸、硫酸等礦酸，亞硫醯氮，磷醯氮，五氯化磷，三氯化磷等鹵化劑的存在下，和甲醇，乙酯，異丙醇，苯甲醇等醇類反應而完成。反應溫度通常在 0 ~ 150 °C 下，尤宜在 50 ~ 100 °C 範圍進行 1 ~ 10 小時左右。

一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為具有鄰接結合的羥基和胺基所構成苯基時，可在適當溶劑中，鹼性化合物的存在

(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)

下，跟光氣反應而衍化成為一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯駢喹啉 - 2 - 酮的化合物。本反應中所使用鹼性化合物和溶劑，乃前述反應式 - 2 的化合物 (2) 和化合物 (4) 的反應中所採用任意的鹼性化合物和溶劑皆可行。

上述反應通常在 $0^\circ \sim 100^\circ\text{C}$ 下，尤宜在 $0 \sim 70^\circ\text{C}$ 左右進行 1 ~ 5 小時左右而終了。

一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為至少具有一個含低級烷基為取代基的醯胺基的苯基化合物，可藉前述反應式 - 3 中的醯胺結合生成反應相同條件下，由一般式 (1) 中 R^1 或 R^3 為至少具有一個羧基為取代基的苯基，以及具有低級烷基為取代基的胺類反應而製得。

一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯甲醯基化合物時，可藉前述一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為雜環的氮原子所鄰接處至少具有一個氧基的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基的還原反應中，利用氫化還原劑的還原方法所採用相同條件下還原，而得一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上具有低級烷氧基為取代基，或低級烷基上具有羥基為其取代基的苯基低級烷基化合物。

一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯甲基化合物時，藉前述一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為至少含有一個三級氮原子的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時的氧化反應條件中，除反應溫度改為通常在室溫 ~ 200°C 下，尤宜在室溫 ~

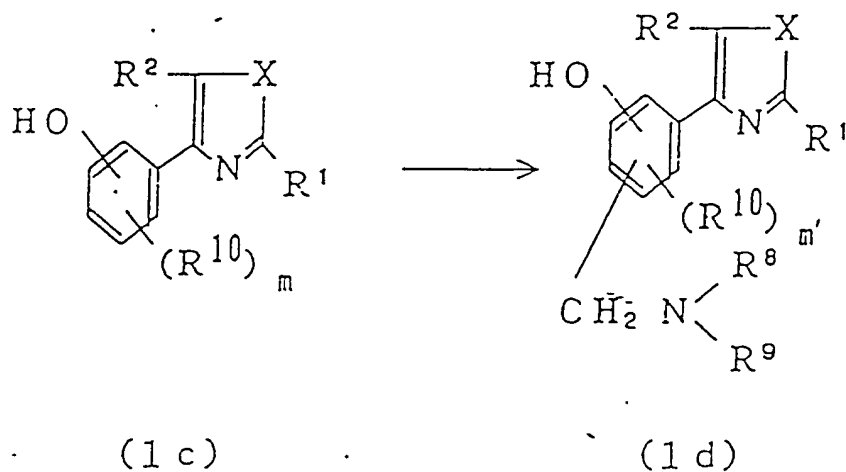
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (80)

150 °C 之外，依照相同條件下反應而衍化成為一般式 (1) 中，R¹ 或 R³ 為苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯甲醯基化合物。

[反應式 - 8]

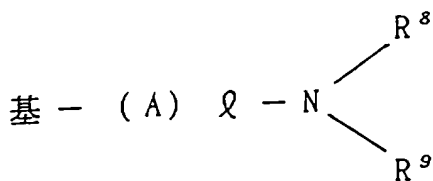


[上式中，R¹，R²以及X所示如同前述。R¹⁰示烷氧基，三低級烷基取代矽烷基氧基，低級烷基，羥基，低級烯基氧基，低級烷基硫基，噻唑環上具有苯基取代基而該苯環上具有低級烷氧基的噻唑基，羧基以及羥基所構成基群選擇基為取代基的苯基，低級烷基亞磺醯基，低級烷基磺醯基，鹵素原子，硝基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

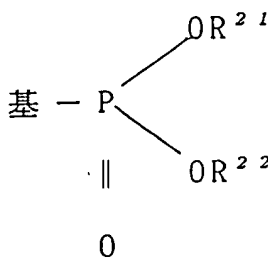
裝
訂
線

五、發明說明 (81)



(上式中, A, ϱ , R^8 和 R^9 所示如同前述。)

低級烷醯基, 低級烷醯基氧基, 烷氧基羰基, 氧基, 具有由羥基, 低級烷氧基羰基, 苯基低級烷氧基, 羥基或低級烷醯基氧基, 取代低級烷基以及低級烷醯基氧基所構成基群中選擇的基 1 ~ 4 個為其取代基的四氫吡喃基氧基, 脘基, 羥基磺醯基氧基, 低級烷氧基羰基取代低級烷氧基, 羧基取代低級烷氧基, 氫硫基, 低級烷氧基取代低級烷氧基, 具有羥基的低級烷基, 低級烯基, 具有低級烷基為取代基的胺基硫基羰基氧基, 具有低級烷基取代基的胺基羰基硫基, 低級烷醯基取代低級烷基, 羧基, 具有低級烷基取代基的胺基低級烷氧基羰基,



(上式中, R^{21} 和 R^{22} 可為相同或不同構造, 示氫原子或低級烷基。)

苯基低級烷氧基羰基, 環烷基, 低級烯基, 低級烷氧基羰

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

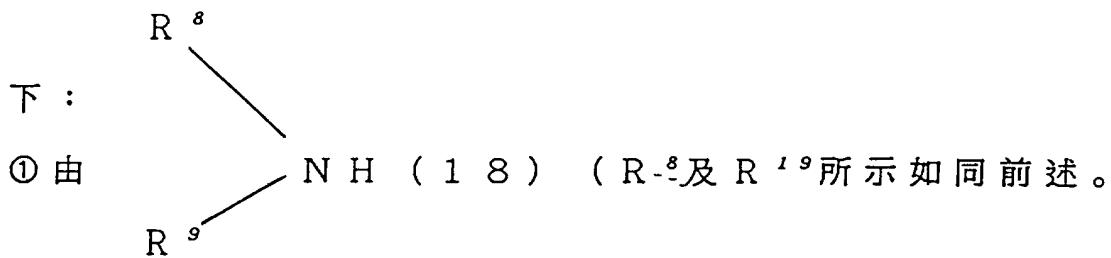
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

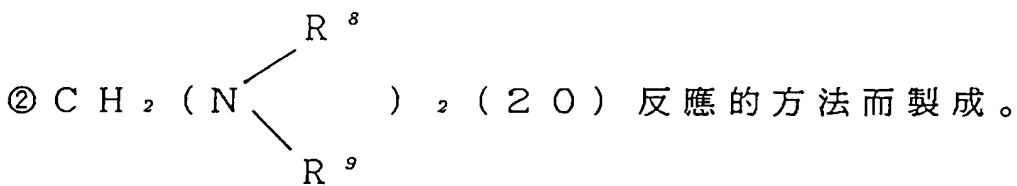
五、發明說明 (82)

基取代低級烷基，羧基取代低級烷基，低級烷氧基羰基取代低級烯基，羧基取代低級烯基，具有低級烷基為取代基的胺基低級烷氧基，具有低級烷基取代基的胺基低級烷氧基取代低級烷基，具有低級烷基取代基的胺基低級烷氧基羰基取代低級烷基，具有鹵素原子的低級烷基磺醯基氧基以及低級烷氧基取代低級烷氧基羰基。m 和 m' 示 0 或 1 ~ 3 的整數。]

化合物 (1 c) 和化合物 (1 9) 的反應，舉例之如下：



) 和甲醛反應的方法 [曼尼希氏反應 (Mannich reaction)]、



①項的方法係由一般式 (1 c) 的化合物，一般式 (1 9) 的化合物以及甲醛在酸的共存或不存在下，適當的溶劑中反應而完成。上述所用溶劑祇要是曼尼希氏反應中通常使用的任何溶劑皆可採用，例如水、甲醇、乙醇、異丙醇等醇類、乙酸、丙酸等烷酸類，乙醚等醚類，丙酮，二甲基甲醯胺等極性溶劑等或其混合溶劑等。所用酸的種

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

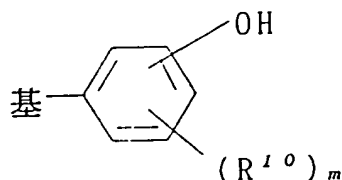
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (83)

類例如鹽酸，溴氫酸等礦酸，乙酸等有機酸等。甲醛可採用含有 20 ~ 40 重量% 的甲醛水溶液，三聚物，聚合物（多聚甲醛）等。一般式 (19) 的化合物之使用量對一般式 (1c) 所示化合物而計，通常至少使用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳 ~ 5 倍莫耳量。甲醛用量對於一般式 (1c) 所示化合物而計，至少使用相等莫耳量，通常使用過剩量為較宜。上述反應通常在 0 ~ 200 °C 下，尤宜在室溫 ~ 150 °C 左右下進行，作用 0.5 ~ 1.0 小時而結束反應。

②項的方法係在酸的共存下，適當溶劑中或無溶劑下反應而進行。上述所用的酸有鹽酸，溴氫酸，硫酸等礦酸，乙酸，乙酐等有機酸，其中以採用乙酐為理想。上述所用溶劑如前記①項的方法中所採用任意溶劑皆可採用。化合物 (20) 的用量對一般式 (1c) 所示化合物而計，通常至少使用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳 ~ 5 倍莫耳量。上述反應通常在 0 ~ 150 °C 下進行，其中以在室溫 ~ 100 °C 下進行 0.5 ~ 5 小時左右而結束為宜。

該反應中，R¹示



時，同時會

產生跟化合物 (19) 或化合物 (20) 反應的化合物，但容易分離而得。

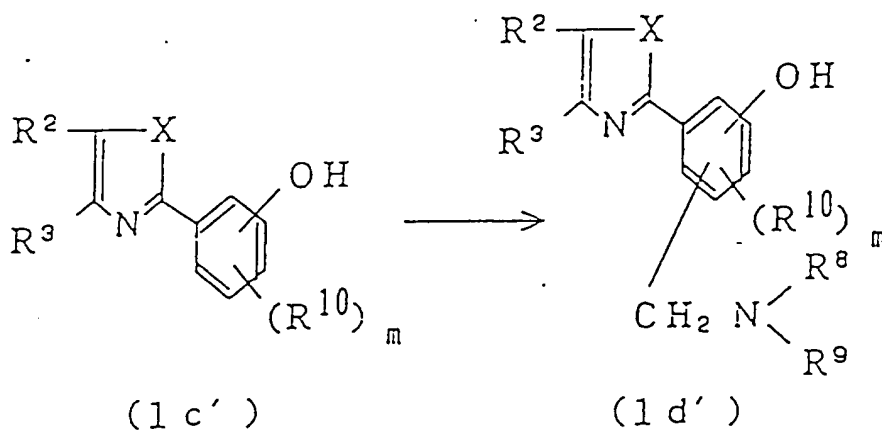
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

. 裝 訂 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

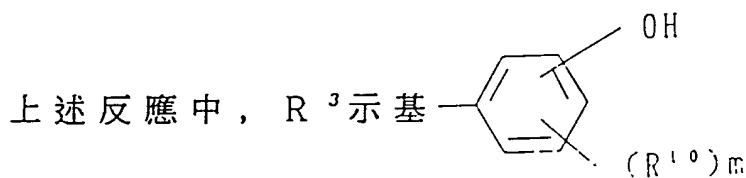
五、發明說明 (84)

[反應式 - 9]



[上式中，R²，R³，R⁸，R⁹，R¹⁰，m和X所示如同前述。]

將化合物(1c')衍化為化合物(1d')的反應可按照反應式-8中，由化合物(1c)變化為化合物(1d)所進行相同反應條件下進行。



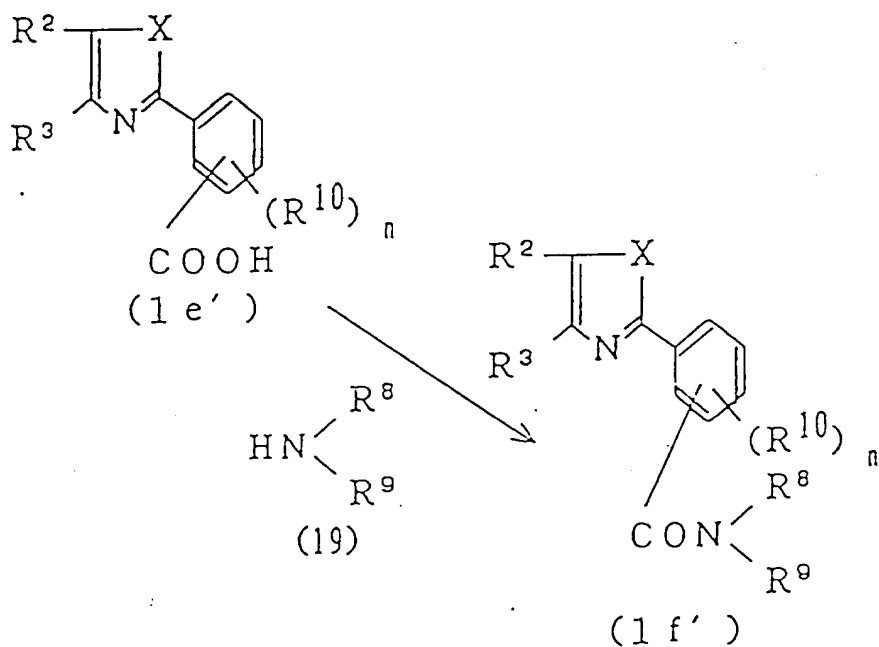
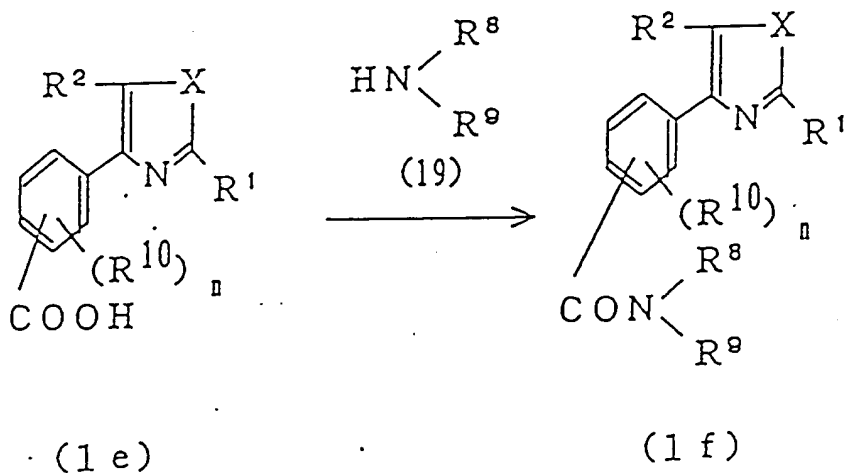
時，會產生同時和化合物(19)或化合物(20)反應生成的混合物，但這些混合物容易分離而得。

(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)

[反應式 - 10]



[上式中, R¹, R², R³, R⁸, R⁹, R¹⁰, m 和

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

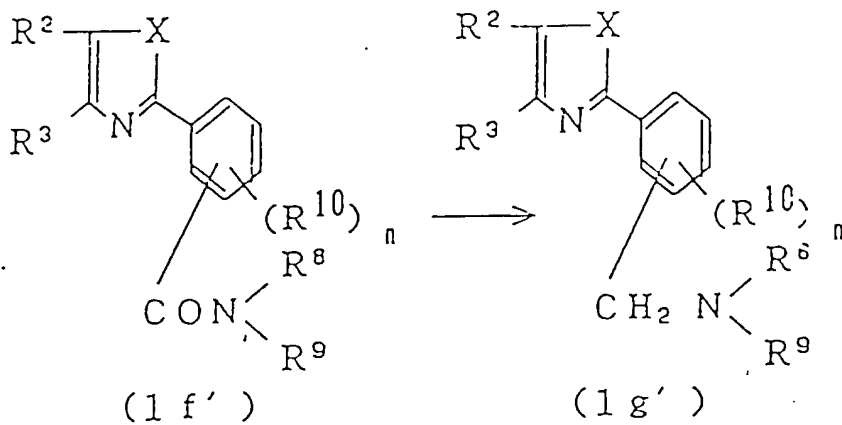
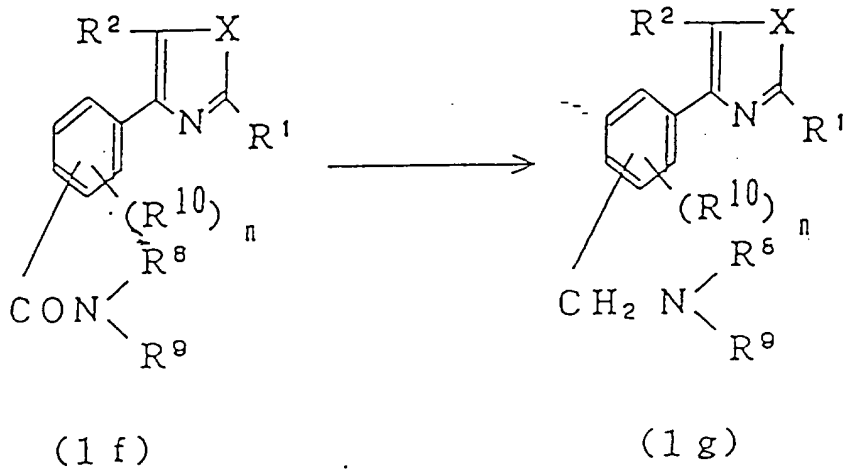
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (86)

X 所示如同前述。n 示 0 或 1 ~ 4 的整數。]

化合物 (1 e) 和化合物 (1 9) 間的反應以及化合物 (1 e') 和化合物 (1 9) 間的反應，可按照前述反應式 - 3 中的化合物 (6) 和化合物 (4) 間之相同反應條件進行。

[反應式 - 1 1]



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

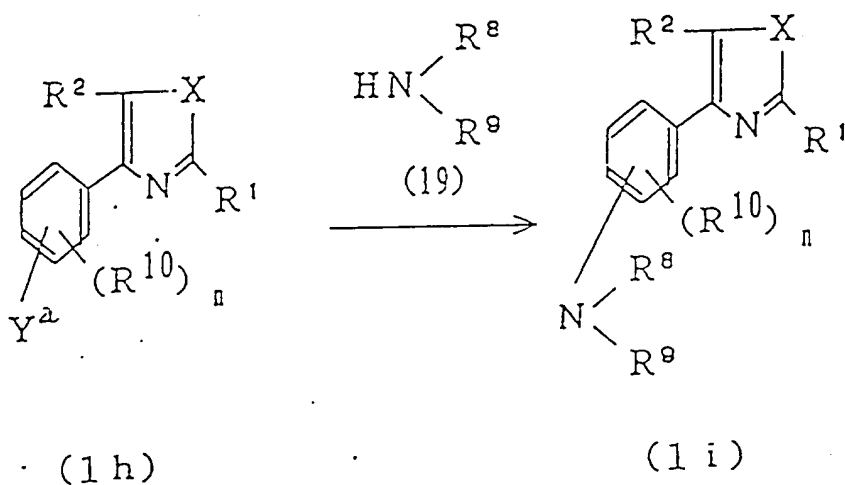
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (87)

[上式中， $R^1, R^2, R^3, R^6, R^9, R^{10}, n$ 和 X 所示如同前述。]

將化合物 (1 f) 衍化為化合物 (1 g) 的反應以及化合物 (1 f') 衍化為化合物 (1 g') 的反應，按照前述一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為至少具有一個氧基在鄰接於雜環的氮原子所構成 5 ~ 15 節環的單環、雙環、或三環構造的雜環殘基的還原反應相同條件下進行。

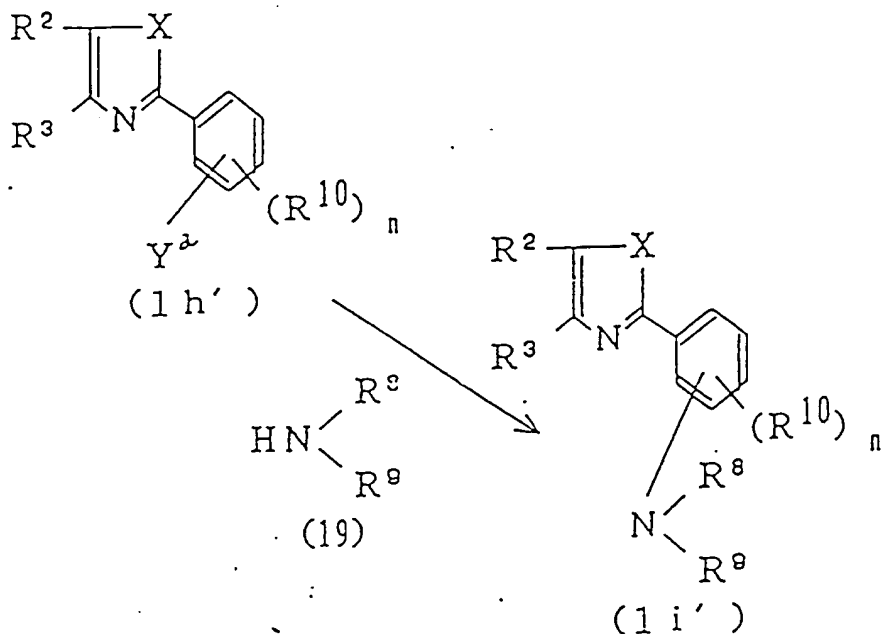
[反應式 - 12]



(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)



[上式中，R¹，R²，R⁸，R⁹，R¹⁰，X和n所示如同前述。Y^a示鹵素原子或具有鹵素原子的低級烷基磺醯基氧基。]

化合物(1 h)和化合物(19)間的反應以及化合物(1 h')和化合物(19)間的反應可在適當的不活性溶劑中，鹼性化合物的共存下或不存在下進行。上述所用不活性溶劑的例舉如二氯甲烷，氯仿等鹵化碳氫化合物，四氫呋喃，二乙醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，乙酸甲酯，乙酸乙酯等酯類，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺，乙腈，丙酮，乙酸，吡啶，水等極性溶劑。所用鹼性化合物的例舉如三乙胺，三甲胺，吡啶，二甲基苯胺，N-甲基嗎啉，4-二甲基胺基吡啶，4-(1-吡咯烷基)吡啶，1,5-重氮雙環[4,3,0]壬烯-5(DBN)，1,8-重氮雙環

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

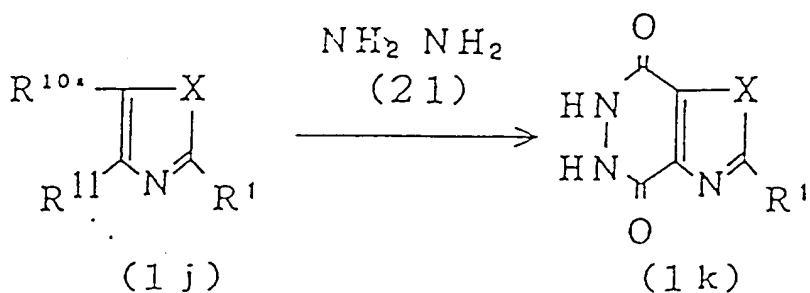
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (89)

[5, 4, 0] 十一烯-7 (DBU), 1, 4-重氮雙環[2, 2, 2]辛烷 (DABCO), 乙酸鈉等鹼性有機化合物, 氫化鈉, 碳酸鉀, 碳酸鈉, 碳酸氫鉀, 碳酸氫鈉, 氫氧化鉀, 氫氧化鈉等的無機鹼性化合物。化合物 (1 h) 或化合物 (1 h') 對於化合物 (19) 的用量, 通常至少使用相等莫耳量, 其中以相等莫耳~3倍莫耳量為較宜。上述反應通常在-20~180℃下進行, 尤宜在0°~150℃下進行。反應時間通常為5分鐘~15小時左右而結束反應。上述反應中, 利用銅粉等為催化劑時更可順利進行。

[反應式-13]



[上式中, R¹和X所示意義如同前述。R¹⁰和R¹¹分別示低級烷氧基羰基。]

化合物 (1 j) 和化合物 (21) 間的反應在密封管中適當溶劑存在下進行。上述所用溶劑乃前述反應式-1中, 化合物 (2) 和化合物 (3) 間的反應所使用任意溶

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

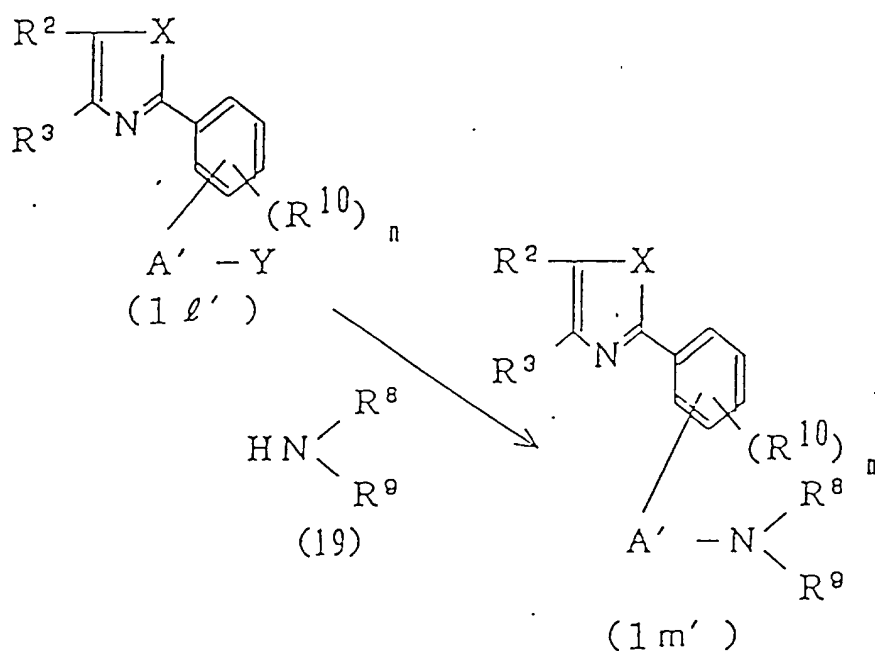
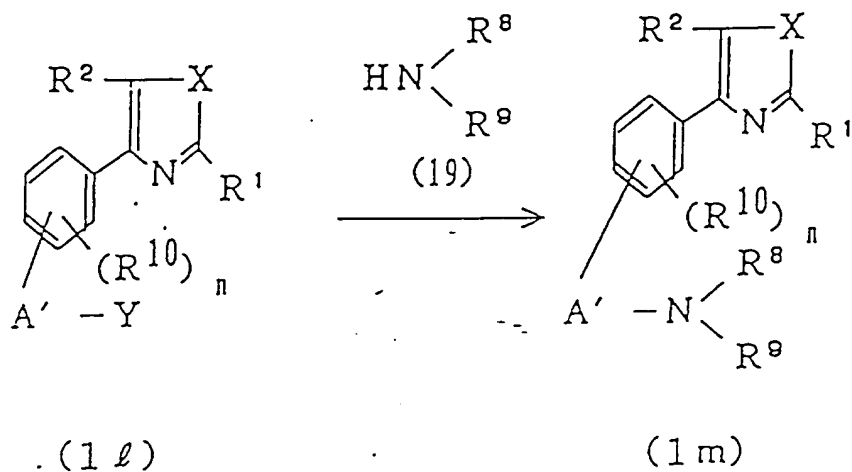
裝
訂
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (90)

劑皆可採用。化合物 (21) 的用量，對化合物 (1j) 而計，至少採用相等莫耳量，通常使用過剩量為宜。上述反應通常在 50~200℃ 下進行，尤宜在 50~150℃ 下反應 10~50 小時左右後結束作用。

[反應式 - 14]



(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)

[上式中, $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, X, n$ 和 Y 所示意義如同前述。A' 示低級伸烷基。]

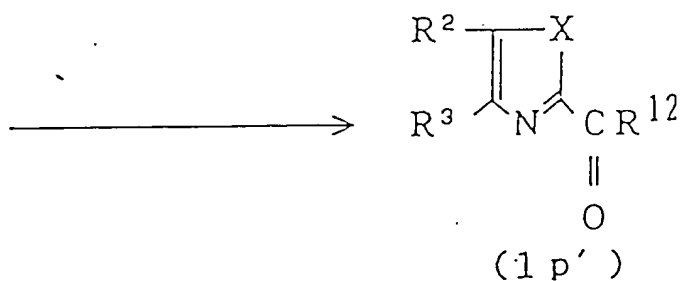
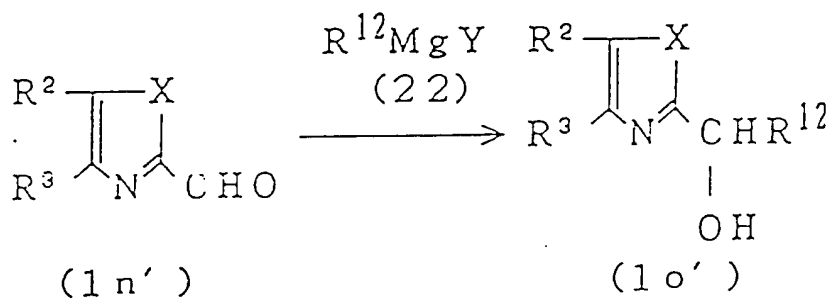
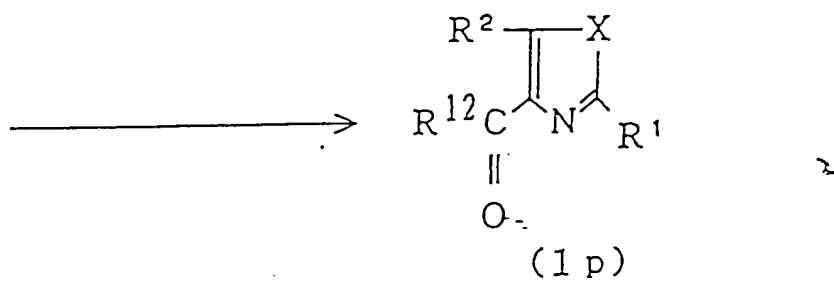
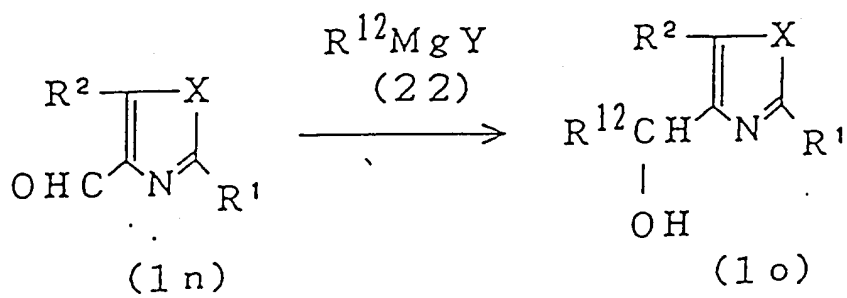
化合物 (18) 和化合物 (19) 間的反應以及化合物 (18') 和化合物 (19) 間的反應在適當不活性溶劑中, 脫鹵化氫劑的存在下進行。上述所用不活性溶劑的例舉有二氯甲烷, 氯仿等鹵化碳氫化合物, 四氫呋喃, 二乙醚等醚類, 苯, 甲苯, 二甲苯等芳香族碳氫類, 乙酸甲酯, 乙酸乙酯等酯類, 二甲基甲醯胺, 二甲亞砷, 六甲基磷酸三醯胺, 乙腈, 丙酮, 乙酸, 吡啶, 水等的極性溶劑或上述之混合溶劑等。上述所用脫鹵化氫劑的例舉如三乙胺, 三甲胺, 吡啶, 二甲基苯胺, N-甲基嗎啉, 4-二甲基胺基吡啶, 4-(1-吡咯烷基)吡啶, 1,5-重氮雙環[4,3,0]壬烯-5 (DBN), 1,8-重氮雙環[5,4,0]十一烯-7 (DBU), 1,4-重氮雙環[2,2,2]辛烷 (DABCO), 乙酸鈉等的有機鹼性化合物, 氫化鈉, 碳酸鉀, 碳酸鈉, 碳酸氫鉀, 碳酸氫鈉, 氫氧化鉀, 氫氧化鈉等無機鹼性化合物。化合物 (19) 的用量, 對化合物 (18) 或化合物 (18') 而計, 通常至少使用相等莫耳量, 尤宜採用相等莫耳~3倍莫耳量。上述反應通常在 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ 左右下進行, 尤宜在 $0 \sim 100^\circ\text{C}$ 下進行。反應時間為5分鐘~20小時左右。

(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)

[反應式 - 15]



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (93)

[上式中， R^1 ， R^2 ， R^3 ，X和Y所示如同前述。
 $R^{1'}$ 示苯環上具有低級烷氧基為其取代基的苯基。]

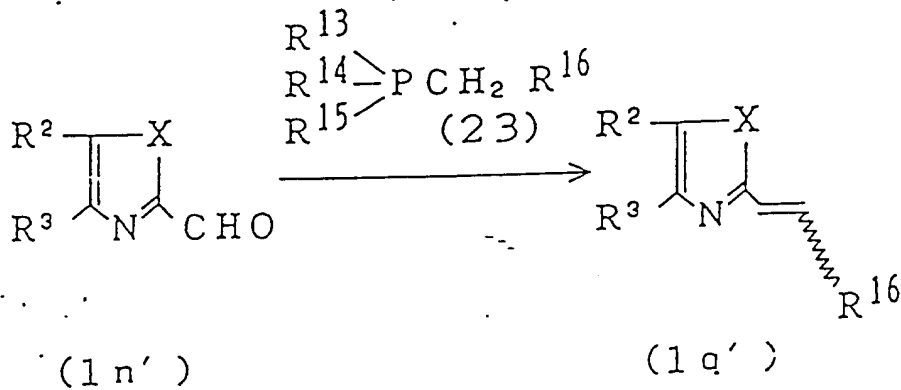
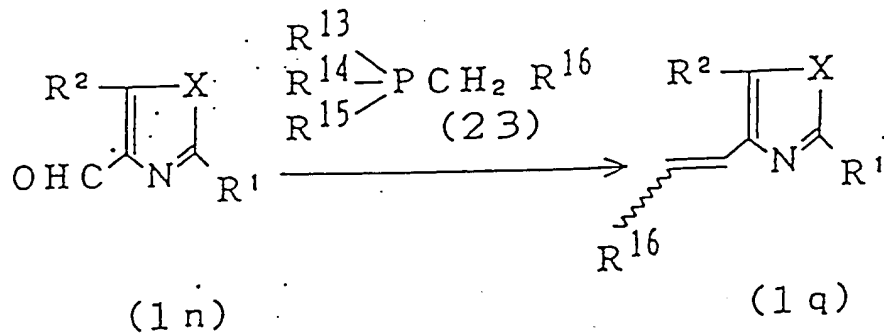
化合物(1 n)和化合物(2 2)間的反應以及化合物(1 n')和化合物(2 2)間的反應在適當溶劑中，通常在 -70°C ~室溫下進行。其中以在 -30°C ~室溫下作用1~6小時為宜。上述所用溶劑有如二乙醚，二噁烷，四氫呋喃等醚類，苯、甲苯等芳香族碳氫類，己烷、庚烷、戊烷、環己烷等飽和碳氫類。化合物(2 2)的用量，對化合物(1 n)或化合物(1 n')而計，至少採用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳~2倍莫耳量。將化合物(1 o)衍生成為化合物(1 p)的反應以及將化合物(1 o')變成化合物(1 p')的反應係在適當溶劑中，氧化劑的存在下進行。上述所用氧化劑的例舉如DDQ，氯鉻酸吡錠鹽，二氯鉻酸吡錠鹽等鉻酸吡錠鹽，二甲亞碲-草醯氯，重鉻酸，重鉻酸鈉，重鉻酸鉀等重鉻酸鹽，高錳酸，高錳酸鉀，高錳酸鈉等的高錳酸鹽。所用溶劑的例舉如水，甲酸，乙酸，三氟乙酸等有機酸，甲醇、乙醇等醇類，氯仿，二氯甲烷等鹵化碳氫化合物類，四氫呋喃，二乙醚，二噁烷等醚類，二甲亞碲，二甲基甲醯胺或其混合溶劑等。氧化劑的用量通常對原料化合物而言，通常使用大過剩量。反應通常在 $0\sim 150^{\circ}\text{C}$ 下進行，尤宜在 $0\sim 100^{\circ}\text{C}$ 下反應，大約進行1~7小時而終止反應。

(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)

[反應式 - 16]



[上式中，R¹，R²，R³和X所示意義如同前述。R¹³，R¹⁴和R¹⁵分別示苯基或低級烷基。R¹⁶示苯環上具有低級烷基為其取代基的苯基低級烷基。]

化合物(1n)和化合物(23)間的反應以及化合物(1n')和化合物(23)間的反應乃稱為威第氏反應(Wittig reaction)者。該反應在鹼性化合物共存下於溶劑中進行。上述所用鹼性化合物的例舉如金屬鈉，金屬鉀，氫化鈉，氨基化鈉，氫氧化鈉，氫氧化鉀，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鈉等無機鹼性化合物，第三丁醇鉀，甲醇鈉，乙醇鈉等金屬醇鹽類，甲基鋰，正丁基鋰，苯基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

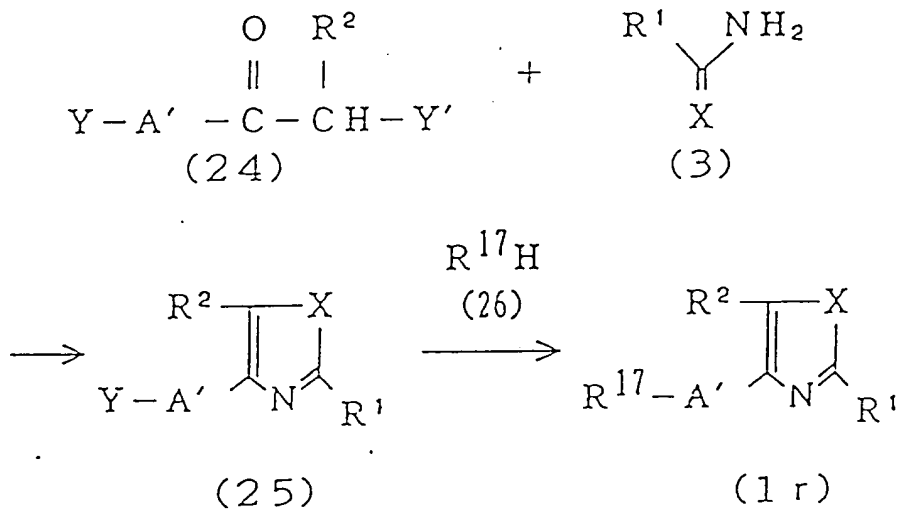
裝
訂
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (95)

鋰等鋰鹽，吡啶，六氫吡啶，喹啉，三乙胺，N，N-二甲基苯胺等有機鹼性化合物。所用溶劑祇要不影響及反應者任何溶劑均可採用，例如二乙醚，二噁烷，四氫呋喃，乙二醇二甲醚，二乙二醇二甲醚等醚，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，正己烷，戊烷，庚烷，環己烷等脂肪族碳氫類，吡啶，N，N-二甲基苯胺等胺類，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺等非質子性極性溶劑等。一般式(23)所示化合物的用量，通常對化合物(1n)或化合物(1n')而計，至少使用相等莫耳量左右，尤宜使用相等莫耳~5倍莫耳量左右。本反應的反應溫度通常在-70~150℃範圍，尤宜在-50~120℃左右進行，通常反應0.5~15小時左右而結束。

[反應式-17]



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

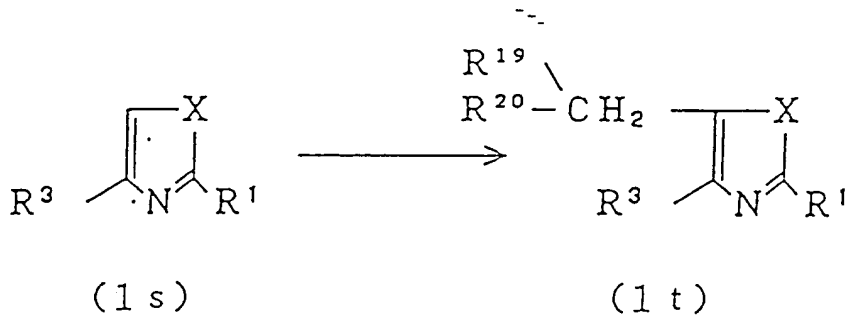
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (96)

[上式中，A'，Y，R¹，R²和X所示如同前述。Y'示鹵素原子。R^{1'}示六氫吡啶環上具有低級烷基為其取代基的六氫吡啶基。]

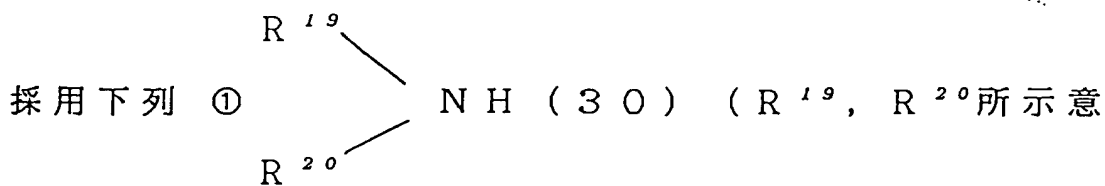
化合物(24)和化合物(3)間的反應，依照前述反應式-1中的化合物(2)和化合物(3)間的相同反應條件而進行。化合物(25)和化合物(26)間的反應，依照前述反應式-14中的化合物(19')和化合物(19)間的相同反應條件進行。

[反應式-18]



[上式中，R¹，R³和X所示如同前述。R¹⁹和R²⁰可為相同或不同構造，示氫原子或低級烷基。]

化合物(1s)和化合物(30)間的反應，例如可



義如同前述。)和甲醛反應的方法[曼尼希氏反應(Ma-

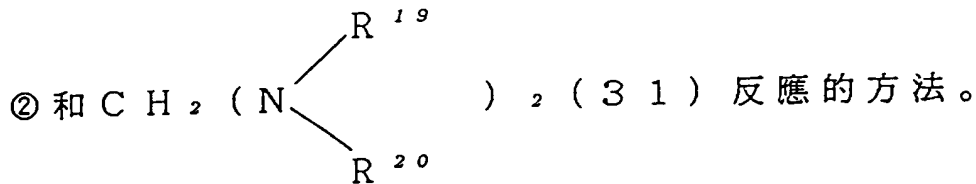
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (97)

nnich reaction)] ,



①項所示方法，由一般式(1s)的化合物和化合物(30)以及甲醛在酸的共存下或不存在下，於適當溶劑中反應而達成。上述所用溶劑的種類乃曼尼希氏反應中通常使用的任意溶劑皆可採用。例如水，甲醇，乙醇，異丙醇等醇類，乙酸，丙酸等烷酸類，乙醚等醚類，丙酮，二甲基甲醯胺等極性溶劑或上述的混合溶劑等。所用酸類的例舉有鹽酸，溴氫酸等礦酸，乙酸等有機酸類。所用甲醛為含有20~40重量甲醛的水溶液，三聚物，多聚物等。化合物(30)的用量，對化合物(1s)而計，通常至少採用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳~5倍莫耳量。甲醛的用量對化合物(1s)而計，至少使用相等莫耳量，通常以使用大過剩量為宜。上述反應通常在0~200℃下進行，尤在室溫~150℃左右下得順利反應，作用0.5~10小時左右而結束反應。

②項所示方法，乃於酸的共存下，適當溶劑中或無溶劑存在下反應而達成。上述所用酸類，例如鹽酸，溴氫酸，硫酸等礦酸，乙酸，乙醚等有機酸類。其中以採用乙醚為宜。上述所用溶劑種類，祇要是①項所用任何溶劑皆可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (98)

採行。化合物 (31) 的用量，對化合物 (1s) 而言，通常至少採用相等莫耳量，尤宜使用相等莫耳~5倍莫耳量。上述反應通常在 0~150℃ 下進行，尤宜在室溫~100℃ 左右進行 0.5~5 小時左右而結束反應。

一般式 (1) 中，R¹或 R³為苯環上至少具有一個硝基為其取代基的苯基時，藉還原反應而得一般式 (1) 中，R¹或 R²為苯環上至少具有一個胺基為其取代基的苯基化合物。上述還原反應可依照前述 R¹和 R³為鄰接雜環上的氮原子的氧基的還原反應中所採用接觸還原反應相同條件而進行。或採用下述還原劑而進行。上述還原劑的例舉如鐵，鋅，錫或氯化亞錫和乙酸，鹽酸，硫酸等酸類，或鐵，硫酸亞鐵，鋅或錫和氫氧化鈉等鹼金屬氫氧化物，硫化銻等硫化物，氨水，氯化銻等銻鹽間的混合物等。上述所用不活性溶劑的例舉有水，乙酸，甲醇，乙醇，二噁烷等。上述還原反應條件視所採用還原劑而選擇適當的溶劑，例如所用還原劑為氯化亞錫和鹽酸時，以 0℃~室溫附近下反應 0.5~10 小時左右為宜。還原劑的用量對原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，通常採用相等莫耳~10 倍莫耳量為宜。

化合物 (1) 中，R¹或 R³為苯環上至少含有一個羥基為其取代基的苯基時，藉和至少具有一個羥基為其取代基的四氫呋喃 (27) 反應而得 R¹或 R³的在苯環上不論有無取代基，但是至少具有一個四氫呋喃基氧基的苯基所構成化合物 (1)。上述反應在四氫呋喃，二乙醚，二噁

(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)

烷等醚類等適當溶劑中，三苯基磷等磷化物，二乙基偶氮基羧酸酯等的偶氮基化合物的存在下，通常在 $0 \sim 100$ ℃，尤宜在 $0 \sim 70$ ℃左右反應 $1 \sim 20$ 小時而完成。化合物(27)的用量，對原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，但以採用相等莫耳 ~ 2 倍莫耳量為宜。

化合物(1)中， R^1 或 R^2 為苯環上至少具有一個低級烷醯基氧基為其取代基的四氫呋喃基氧基至少一個基為其取代基的苯基時，可藉加水分解而得具有 R^1 或 R^2 為苯環上至少含有一個羥基為其取代基的四氫呋喃基氧基至少一個基為其取代基的苯基所構成化合物(1)。上述加水分解反應可在鹼性化合物的共存下，適當的溶劑中進行。所用鹼性化合物的例舉如碳酸鈉，碳酸鉀，氫氧化鈉，氫氧化鉀，氫氧化鋇，甲醇鈉，乙醇鈉等鹼金屬醇鹽類。所用溶劑的例舉有水，甲醇，乙醇，異丙醇等醇類，四氫呋喃，二噁烷，二甲氧基乙烷等醚類，氯仿，二氯甲烷，四氯化碳等鹵化碳氫化合物類，二甲基甲醯胺，二甲亞砷，六甲基磷酸三醯胺等或上述之混合溶劑等。上述反應通常在 $0 \sim 200$ ℃左右，尤宜在室溫 ~ 150 ℃左右下進行，一般作用 $0.5 \sim 1.5$ 小時左右而結束反應。

化合物(1)中， R^1 或 R^2 為苯環上至少具有一個羥基為其取代基的苯基時，藉和 YSO_3H (化合物28，Y所示意義如同前述。)反應而變成 R^1 或 R^2 為苯環上至少具有一個羥基磺醯基氧基為其取代基的苯基。上述反應可依照反應式-14中的化合物(18)和化合物(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 (100)

) 間的相同反應條件進行。但化合物 (28) 的用量, 對原料化合物而計, 通常採用大過剩量為宜。

化合物 (1) 中, R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個羥基為其取代基的苯基時, 可藉和 $R^{18}Y$ (化合物 29, R^{18} 示低級烷氧基羰基取代低級烷基, 低級烯基或具低級烷基為其取代基的胺硫甲醯基基。Y 所示意義如同前述。) 或和 $(R^{25}SO_2)_2O$ (化合物 30, R^{25} 示具有鹵素原子的低級烷基。) 反應而成 R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個基 $-OR^{18}$ (R^{18} 所示意義如同前述。) 或 $R^{25}SO_2-$ (R^{25} 所示意義如同前述。) 為其取代基的苯基。上述反應依照前述反應式 14 中的化合物 (18) 和化合物 (19) 間的相同反應條件下進行。

化合物 (1) 中, R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個低級烯基氧基為其取代基的苯基時, 可藉格來遜氏重排反應而成為 R^1 或 R^3 為苯環上至少具有二個羥基和低級烯基為其取代基的苯基。該反應在適當溶劑中加熱而完成。所用溶劑為二甲基甲醯胺, 四氫苯, 鄰-二氯苯, N, N-二甲基苯胺, N, N-二乙基苯胺, 二苯基醚等的高沸點溶劑。該反應通常在 $100 \sim 250^\circ C$ 下進行, 尤宜在 $150 \sim 250^\circ C$ 下作用 $1 \sim 30$ 小時左右而結束反應。

化合物 (1) 中, R^1 或 R^3 為苯環上具有低級烷基為其取代基的胺硫甲醯基氧基至少一個基的其取代基的苯基時, 藉加熱而成 R^1 或 R^3 為苯環上含有低級烷基為其取代基的胺基羰基硫基至少一個基為其取代基的苯基。上述反

(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)

應在無溶劑下，通常以 100 ~ 250 °C，尤宜在 150 ~ 250 °C 下反應 1 ~ 10 小時左右而結束。

化合物 (1) 中，R¹ 或 R³ 為苯環上含有低級烷基為其取代基的胺基羰基硫基至少一個基為其取代基的苯基時，藉前述化合物 (1) 中，R¹ 或 R³ 為至少含有一個低級烷氧基羰基為其取代基的苯基的加水分解反應同樣條件進行加水分解而成為 R¹ 或 R³ 為苯環上至少具有一個氫硫基為其取代基的苯基。

化合物 (1) 中，R¹ 或 R³ 為苯環上至少具有一個硝基為其取代基的苯基時，藉還原作用而成為 R¹ 或 R³ 係苯環上至少具有一個胺基為其取代基的苯基。

上述還原反應例如 ① 在適當溶劑中利用接觸還原用催化劑進行，或 ② 在適當不活性溶劑中，利用金屬或金屬鹽和酸，或金屬或金屬鹽和鹼金屬氫氧化物，硫化物，鉍鹽等的混合物等為還原劑而進行還原作用。

採用 ① 項的還原催化劑時，所用溶劑的種類有水，乙酸，甲醇，乙醇，異丙醇等醇類，二氯甲烷，氯仿，二氯乙烷等鹵化碳氫化合物類，己烷，環己烷等碳氫類。二噁烷，四氫呋喃，二乙醚，二乙二醇二甲醚等醚類，乙酸乙酯，乙酸甲酯等酯類，N, N-二甲基甲醯胺等非質子性極性溶劑等或上述之混合溶劑等。所用接觸還原用催化劑的例舉有鈀，鈀黑，鈀碳，白金，氧化鉑，亞鉻酸銅，拉尼鎳等。催化劑的用量對原料化合物而計，一般採用 0.02 ~ 1 倍量左右為宜。反應溫度通常為 -20 ~

(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)

150℃附近，尤宜在0~100℃下，氫壓為1~10氣壓，一般進行0.5~10小時左右而結束。又上述反應中也可添加鹽酸等酸類。

另外，採用②項的方法時，所用還原劑有鐵，鋅，錫或氯化亞錫和鹽酸，硫酸等礦酸，或鐵，硫酸亞鐵，鋅或錫和氫氧化鈉等鹼金屬氫氧化物，硫化銨等硫化物，氨水，氯化銨等銨鹽間的混合物。所用不活性溶劑的例舉如水，乙酸，甲醇，乙醇，二噁烷等。上述還原反應條件視所採用還原劑而選擇其適當條件，例如使用氯化亞錫和鹽酸為還原劑時，在0℃~室溫下反應0.5~70小時左右為較有利。還原劑的用量，對原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，通常使用相等莫耳~5倍莫耳量。

化合物(1)中，R¹或R³為苯環上至少具有一個低級烯基為其取代基的苯基時，藉氧化反應而成R¹或R³為苯環上含有二個羥基為其取代基的低級烷基至少一個為其取代基的苯基。

上述反應可在適當溶劑中，共氧化劑的存在下和氧化劑反應而進行。

和氧化劑反應時所用溶劑的例舉如二噁烷，四氫呋喃，二乙醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳化氫類，二氯甲烷，二氯乙烷，氯仿，四氯化碳等鹵化碳氫化合物類，乙酸乙酯等酯類，水，甲醇，乙醇，異丙醇，第三丁醇等醇類或上述之混合溶劑等。所用共氧化劑的例舉如吡啶N-氧化物，N-乙基二異丙胺N-氧化物，4-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 (103)

嗎啉 N - 氧化物，三甲胺 N - 氧化物，三乙胺 N - 氧化物等有機胺 N - 氧化物類。另外，氧化劑可用四氧化鐵等。氧化劑用量，對原料化合物而計，通常至少採用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳 ~ 5 倍莫耳量。上述反應在 - 20 ~ 150 °C 下進行，尤宜在室溫 ~ 100 °C 下，通常反應 1 ~ 15 小時左右而結束。

化合物 (1) 中，R¹ 或 R³ 為苯環上至少具有一個低級烯基為其取代基的苯基時，藉氧化反應而成為苯環上至少具有一個低級烷醯基取代低級烷基或低級烷醯基為其取代基的苯基。上述反應在氧化劑的共存下，適當溶劑中反應而進行。上述所用溶劑的例舉有二噁烷，四氫呋喃，二乙醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫化合物類，二氯甲烷，二氯乙烷，氯仿，四氯化碳等鹵化碳氫化合物類，乙酸乙酯等酯類，水，甲醇，乙醇，異丙醇，第三丁醇等醇類或上述之混合溶劑等。氧化劑的例舉有臭氧，四氧化鐵 - 偏碘酸鈉等。上述反應在 20 ~ 150 °C 下進行，尤宜在 0 °C ~ 100 °C 左右，一般反應 1 ~ 20 小時左右而結束。

化合物 (1) 中，R¹ 或 R³ 為苯環上至少具有一個甲醯基取代低級烷基為其取代基的苯基時，可藉還原反應而成為 R¹ 或 R³ 係苯環上含有羥基取代基的低級烷基至少一個做為其取代基的苯基。上述還原作用可利用前述化合物 (1) 中，R¹ 或 R³ 為具有至少一個氧基在雜環的氮原子所鄰接部分的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

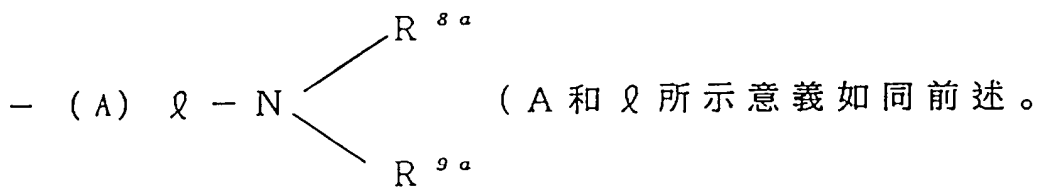
裝
訂
線

五、發明說明 (104)

環殘基所採用還原反應中，利用氫化劑的還原方法相同條件下進行。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個腓基或胺甲醯基為其取代基的苯基，或至少具有一個腓基或胺甲醯基為取代基的氮原子，氧原子或硫原子有 1 ~ 2 個在其架構中的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時，可藉加水分解作用而成為 R^1 或 R^3 係苯環上至少具有一個羧基為其取代基的苯基，或至少具有一個羧基為其取代基的氮原子，氧原子，或硫原子有 1 ~ 2 個在其架構中的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基。上述加水分解作用可依照前述化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為至少具有一個烷氧基羰基為其取代基的苯基時，所採用相同加水分解作用條件而進行。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個



R^{8a} 示低級烷醯基。 R^{9a} 示氫原子，低級烷基，具有低級烷基取代基在低級烷醯基構造上的胺基低級烷基或六氫吡啶基低級烷基。) 為其取代基的苯基時，可藉加水分解作用而衍化成為 R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個基 $-(A) \varrho - NH - R^{9a}$ (A ， ϱ 和 R^{9a} 所示意義如同前述。) 為其取

(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 (105)

代基的苯基。上述加水分解作用可依照前述化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個低級烷氧基羰基為其取代基的苯基時所採用加水分解相同條件下進行。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個低級烯基為其取代基的苯基時，可藉還原作用而成為 R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個低級烷基為其取代基的苯基。

上述還原作用可依照前述化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為至少具有一個氧基在雜環的氮原子鄰接處的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基時所採用還原條件中以接觸加氫還原方法相同條件下進行。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個羥基為其取代基的苯基時，可藉羧基反應而成為 R^1 或 R^3 係在苯環上至少具有羥基和羧基二個為其取代基的苯基。

上述羧基反應在碳酸氫鉀，碳酸鉀等鹼金屬碳酸鹽的共存下，於適當溶劑中或無溶劑下和二氧化碳反應而進行。上述所用溶劑的例舉有二噁烷，四氫呋喃，二乙醚等醚類，甲、乙基酮，丙酮等酮類，水，吡啶，甘油等。上述反應通常在 1 ~ 10 氣壓下，100 ~ 250 °C 範圍進行。尤宜在 100 ~ 200 °C 左右反應 1 ~ 20 小時而結束。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為有取代基苯基或無取代基苯基時，可藉硝基化作用而成為苯環上至少具有一個硝基為其取代基的苯基。

上硝基反應依照一般芳香族化合物的硝基反應條件

(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)

下，例如在沒有溶劑下或適當的不活性溶劑中利用硝基化劑而達成。上述不活性溶劑的例舉有乙酸，乙酐，濃硫酸等，另外硝基化劑的例舉如發煙硝基，濃硝酸，混合酸類（硫酸，發煙硫酸，磷酸或乙酐和硝酸的混合物），硝酸鉀，硝酸鈉等鹼金屬硝酸鹽和硫酸等。上述硝基化劑的用量，對原料化合物而計，採用相等莫耳量以上，通常使用過剩量即可，在 0°C ~ 室溫範圍下進行反應較為有利，通常作用 1 ~ 4 小時而結束。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個羧基為其取代基的苯基時，藉和 $R^{32}Y$ (化合物 32, R^{32} 示烷基苯基低級烷基，或低級烷氧基取代低級烷基。) 反應而成為 R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個基 $-\text{COOR}^{22}$ (R^{32} 所示意義如同前述。) 為其取代基的苯基。上述反應依照前述反應式 - 14 中的化合物 (18) 和化合物 (19) 間的反應所示相同條件進行。

化合物 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個含鹵素原子的低級烯基為其取代基的苯基時，可藉在適當的溶劑中，鹼性化合物的存在下反應而成為 R^1 或 R^2 係苯環上至少具有一個低級烯基為其取代基的苯基。

上述所用溶劑的例舉如二乙醚，二噁烷，四氫呋喃，乙二醇二甲醚，二乙二醇二甲醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，正己烷，庚烷，環己烷等脂肪族碳氫類。所用鹼性化合物的例舉如甲基鋰，正丁基鋰，苯基鋰，二異丙胺基鋰等烷基鋰，芳基鋰或胺基鋰類。

(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)

上述反應通常在 $-80 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 下進行，尤宜在 $-80 \sim 70^{\circ}\text{C}$ 下進行 0.5 ~ 1.5 小時而完成。

一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個甲醯基為其取代基的苯基時，可藉在適當溶劑中和羥基胺 $\text{O}-$ 磺酸反應而成為 R^1 或 R^3 係苯環上至少具有一個氨基為其取代基的苯基。上述溶劑種類如前述反應式 - 14 中化合物 (18) 和化合物 (19) 間的反應中所採用溶劑皆可使用。上述反應通常在 $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 下進行，尤宜在 $0 \sim 70^{\circ}\text{C}$ 下反應 1 ~ 10 小時左右而完成。羥基胺基 $\text{O}-$ 磺酸的使用量對原料化合物而計至少為相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳 ~ 2 倍莫耳量。

一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個鹵素原子為其取代基的苯基時，藉脫鹵素反應而成為 R^1 或 R^3 係苯環上至少具有一個羥基為其取代基的苯基。

上述反應在適當溶劑中，鹼性化合物的共存下，和六甲基二矽氧烷等低級烷基矽氧烷類反應而完成。

上述所用溶劑的例舉如二乙醚，二噁烷，四氫呋喃，乙二醇二甲醚，二乙二醇二甲醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，正己烷，庚烷，環己烷等脂肪族碳氫類。所用鹼性化合物的例舉如甲基鋰，正丁基鋰，苯基鋰，二異丙基醯胺鋰等烷基鋰和芳基鋰或或醯胺基鋰類。

上述反應在 $-80 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 下進行，尤宜在 $-80 \sim 70^{\circ}\text{C}$ 下反應 0.5 ~ 1.5 小時而結束。低級烷基矽氧

(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)

烷類的使用量對原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，尤其以採用相等莫耳～2倍莫耳量為宜。

一般式(1)中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個甲醯基為其取代基的苯基時，藉氧化反應而成為苯環上至少具有一個羧基的苯基。

上述反應在適當溶劑中，氧化劑的存在下進行。所用溶劑有如水，甲醇，乙醇，異丙醇等醇類，丙酮，甲、乙基酮等酮類，乙酸，丙酸等羧酸類，乙酸乙酯等酯類，苯，氯苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，六甲基磷酸三醯胺，二甲基甲醯胺，二甲亞碲，吡啶等或上述的混合溶劑等。氧化劑的例舉如過甲酸，過乙酸，過三氟乙酸，過苯甲酸，間-氯過苯甲酸，鄰-羧基過苯甲酸等過酸，過氧化氫，偏過碘酸鈉，重鉻酸，重鉻酸鈉，重鉻酸鉀等重鉻酸鹽，高錳酸，高錳酸鉀，高錳酸鈉等高錳酸鹽，四乙酸鉛等的鉛鹽，氧化銀等。氧化劑的用量，通常對原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，其中以使用相等莫耳～2倍莫耳量為較宜。

上述反應通常在 $-10 \sim 100^\circ\text{C}$ 下進行，尤宜在 $0 \sim 50^\circ\text{C}$ 左右反應30分鐘～24小時左右而結束。

一般式(1)中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個三低級烷基取代矽烷基氧基為其取代基的苯基時，可藉由 R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個羥基為其取基的苯基化合物和三低級烷基鹵化矽烷反應而製成。

上述反應在適當溶劑中，鹼性化合物的共存下進行。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

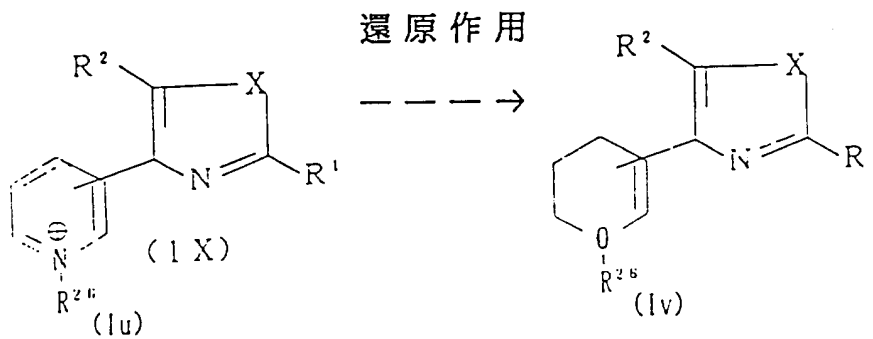
五、發明說明 (109)

所用上述溶劑乃前述反應式 - 14 中化合物 (18) 和化合物 (19) 間的反應中所採用任何溶劑皆行。

上述鹼性化合物的例舉如咪唑等有機鹼性化合物。上述反應通常在 -20 ~ 150 °C 下進行。尤宜在 0 ~ 100 °C 下反應 5 分鐘 ~ 10 小時左右而結束。

三低級烷基鹵化矽烷的用量對原料化合物而計，至少使用相等莫耳量，尤宜使用相等莫耳 ~ 3 倍莫耳量。

[反應式 - 19]



[上式中，R¹、R²和X所示意義如同前述。R²⁶示低級烷基。]

化合物 (1u) 的還原反應可利用氫化劑的還原方法而順利地達成。上述所用的氫化劑的例舉有氫化鋁鎂，氧化硼鈉，乙硼烷等。其用量對原料化合物而計，通常至少使用相等莫耳量，尤宜使用相等莫耳 ~ 15 倍莫耳範圍。上述還原作用通常在適當溶劑中進行。上述溶劑的例舉如

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

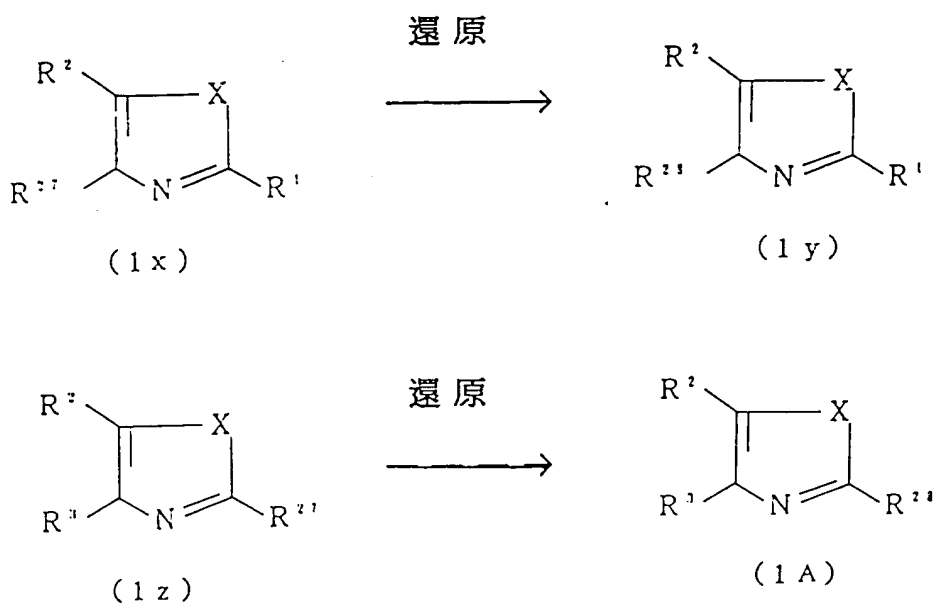
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (110)

水，甲醇，乙醇，異丙醇等的低級醇類，四氫呋喃，二乙醚，二異丙醚，二乙二醇二甲醚等醚類，或上述的混合溶劑等。上述反應通常在大約 $-60^{\circ} \sim 150^{\circ}\text{C}$ 進行，尤宜在 $-30^{\circ} \sim 100^{\circ}\text{C}$ 下反應大約 1 ~ 20 小時而結束。另外，使用氫化鋁鋰或乙硼烷為氫化劑反應時，以採用二乙醚，二異丙醚，四氫呋喃，二乙二醇二甲醚等的無水溶劑為理想。

[反應式 - 20]



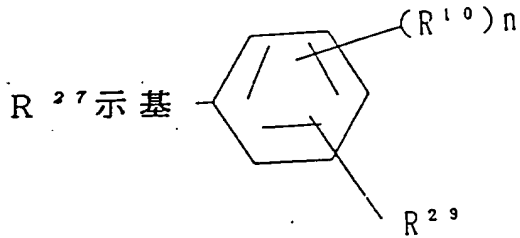
[上式中， R^1 ， R^2 ， R^3 和 X 所示意義如同前述。]

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

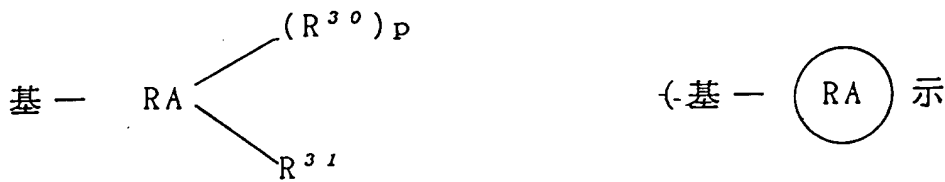
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

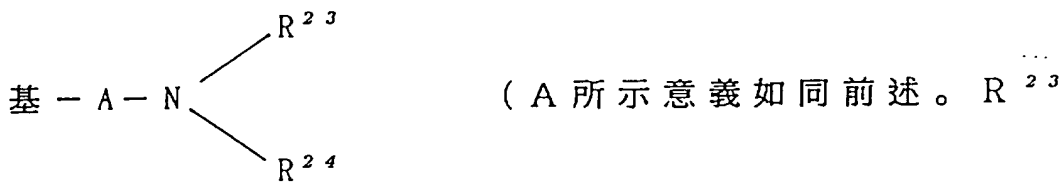
五、發明說明 (111)



(R^{10} 和 n 所示意義如同前述。 R^{29} 示甲醯基或烷氧基羰基。) , 或示



具有 ~ 2 個氮原子，氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基。 R^{30} 示可具有 1 ~ 3 個從氧基，烷基，苯甲醯基，低級烷醯基，經基，羧基，低級烷氧基羰基，低級烷基硫基，



和 R^{24} 可為相同或不同構造，示氫原子，或低級烷基。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

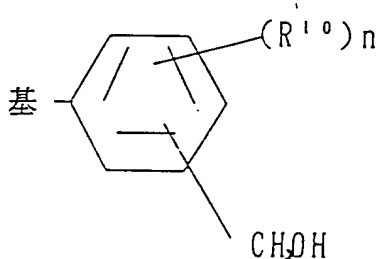
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

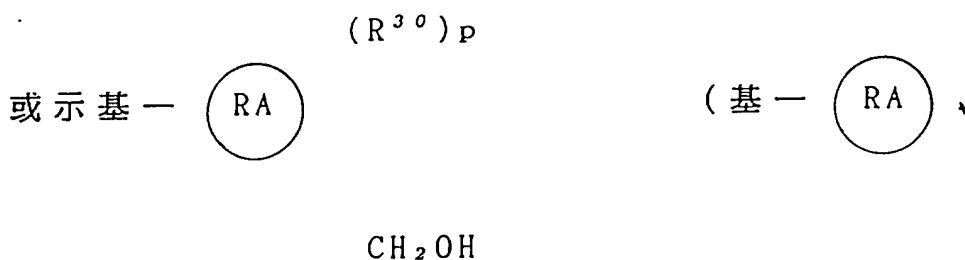
五、發明說明 (112)

R²³和 R²⁴可和其所結合的氮原子一起，或再介由或不介由氮原子或氧原子互相結合而成為飽和的 5 ~ 6 節環的雜環。該雜環可具備低級烷基為其取代基。)， 氧基，具有羥基的低級烷基，苯基胺基硫基羰基以及具有低級烷基取代基的胺基低級烷氧基羰基所構成基群中選擇而得取代基。)

R³¹示甲醯基或低級烷氧基羰基。p 示 0 或 1, 2 的整數。)。 R²⁸示



(R¹⁰和 n 所示意義如同前述。)



R³⁰和 p 所示意義如同前述。)]。

化合物 (1 x) 和化合物 (1 z) 的還原作用可按照前述一般式 (1) 中，R¹或 R³為至少具有一個氧基在雜環上氮原子的鄰接處的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

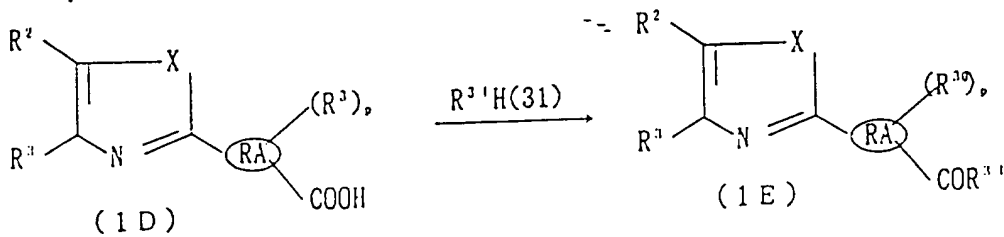
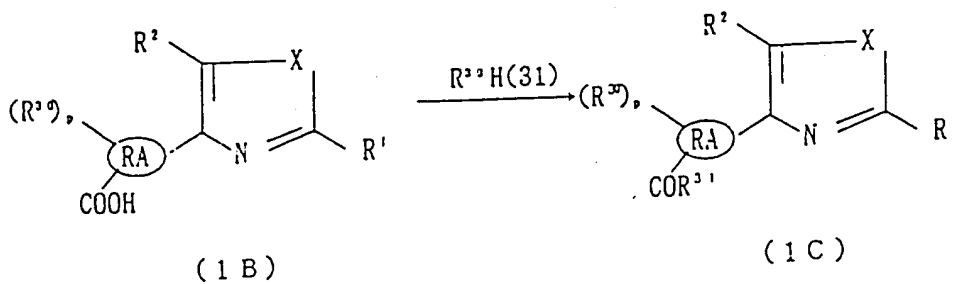
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (113)

構造的雜環殘基的還原反應中所採用氫化劑還原方法相同條件而進行。

[反應式 - 21]



[上式中, $R^1, R^2, R^3, X, R^{30}, p$ 和 RA

所示意義如同前述。 R^{31} 示基 $-N \begin{matrix} / & R^{23} \\ & \\ \backslash & R^{24} \end{matrix}$ ($R^{23},$

R^{24} 所示意義如同前述。) , 或具有低級烷基為其取代基的胺基低級烷氧基。]

化合物 (1 D) 和化合物 (31) 間的反應可依照前

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

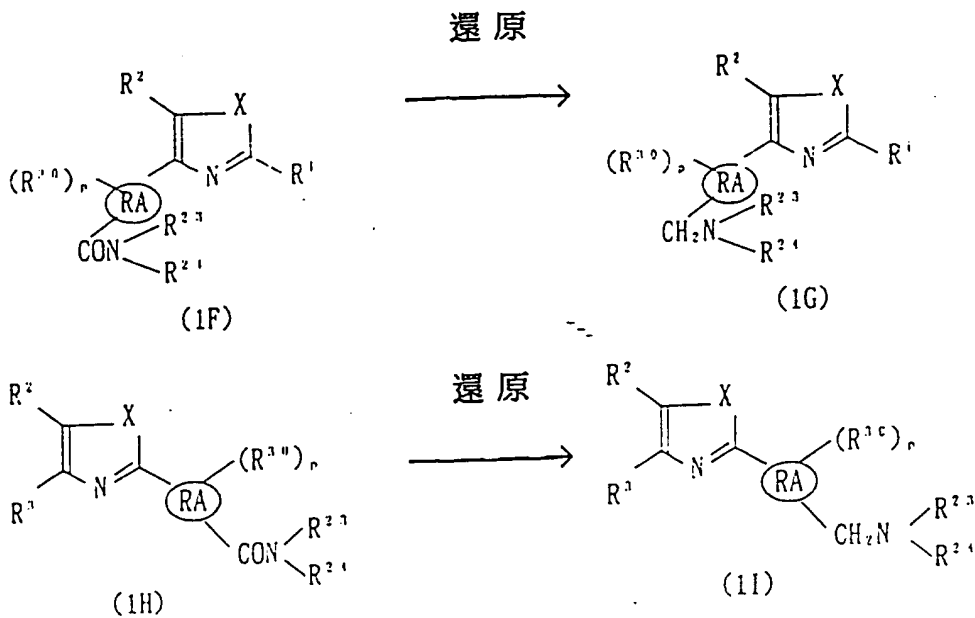
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (114)

述反應式 - 3 中，化合物 (6) 和化合物 (4) 間的相同反應條件而進行。

[反應式 - 22]



[上式中， R^1 ， R^2 ， X ， R^{30} ， p ， R^{23} ， R^{24} 和 RA 所示意義如同前述。]

化合物 (1F) 或化合物 (1H) 的還原作用可依照前述一般式 (1) 中， R^1 或 R^3 為苯環上至少具有一個氧基在雜環上氮原子的鄰接處的 5~15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘留基的還原反應所採用相同條件而進行。

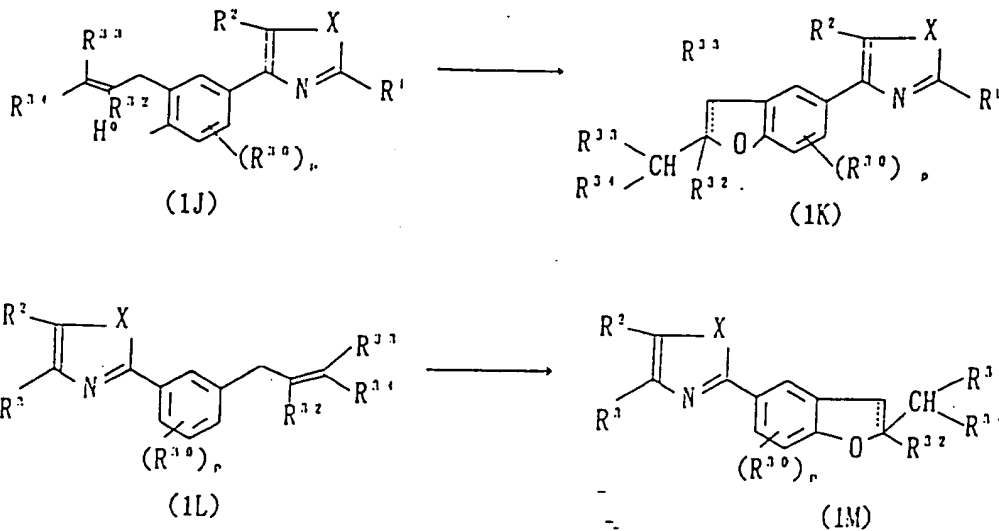
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (115)

[反應式 - 23]



[上式中， R^1 ， R^2 ， X ， p 和 R^{30} 所示意義如同前述。 R^{32} ， R^{33} ， R^{34} 分別示氫原子或低級烷基。化合物(1K)或化合物(1M)的2位和3位間的結合示單鍵或雙鍵結合。]

將化合物(1j)或化合物(1L)分別衍化成為化合物(1K)或化合物(1M)的反應在適當溶劑中，催化劑的共存下進行。上述溶劑可採用前述反應式-1中，化合物(2)和化合物(3)間的反應相同條件而進行。所用催化劑種類，例如 $Pd(OAc)_2 + Cu(OAc)_2 \cdot H_2O$ 等金屬化合物， $KI + I_2$ 等鹵化物。催化劑用量，當採用金屬化合物時，通常對化合物(1J

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

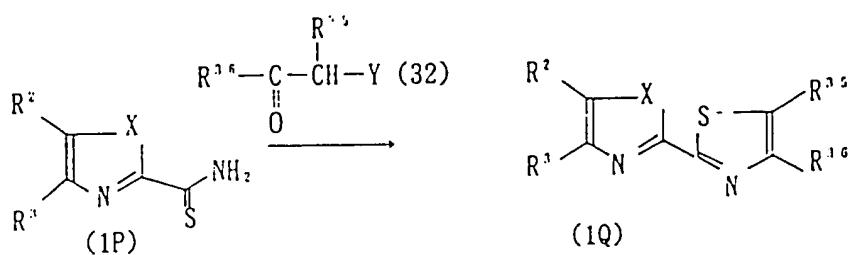
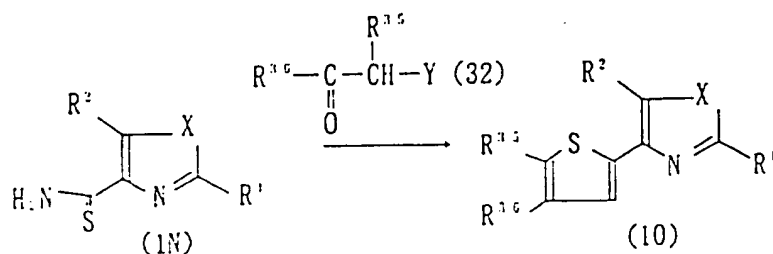
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (116)

) 或化合物 (1 L) 而計，使用 0.1 ~ 相等莫耳量為宜。採用鹵化物時，通常對化合物 (1 J) 或化合物 (1 L) 而計，採用 0.005 ~ 3 倍莫耳量為宜。上述反應通常在室溫 ~ 250 °C 下進行，尤宜在室溫 ~ 200 °C 下作用 5 ~ 40 小時左右而結束反應。使用金屬化合物為催化劑時，宜在氧氣環境下進行。R²³ 示低級烷基時，化合物 (1 K) 的 2 位和 3 位間的結合應示單鍵結合。

[反應式 - 24]



[上式中，R¹，R²，R³，X 和 Y 所示意義如同前述。R³⁵ 和 R³⁶ 分別示前述 R³⁰。]

化合物 (1 N) 和化合物 (3 2) 間的反應以及化合

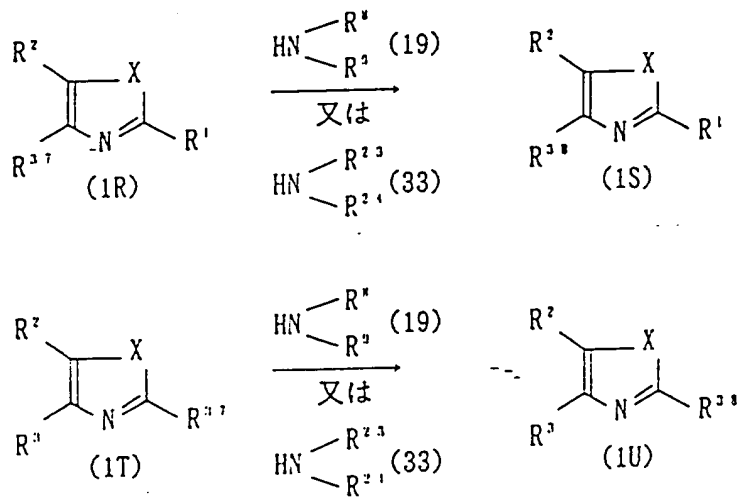
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

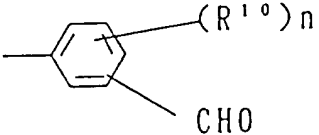
五、發明說明 (117)

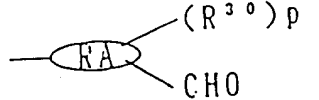
物 (1P) 和化合物 (32) 間的反應，依照前述反應式 - 1 中化合物 (2) 和化合物 (3) 間的反應所採用相同條件下進行。

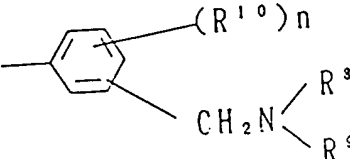
[反應式 - 25]



[上式中， R^1 ， R^2 ， R^3 ， X ， R^8 和 R^9 所示意義

如同前述。 R^{37} 示基  (R^{10} 和 n 所示意義

如同前述。) 或示基  (R^{30} 和 p

所示意義如同前述。) R^{38} 示基 

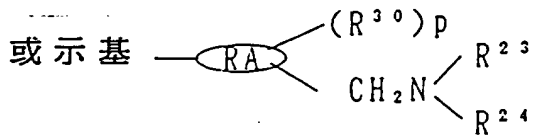
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

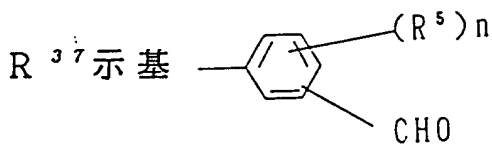
五、發明說明 (11B)

(R¹⁰、R⁸、R⁹和n所示意義如同前述。)

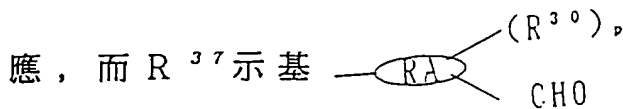


(R³⁰、R²³、R²⁴、和p所示意義如同前述。)

上述反應中，化合物(1R)或化合物(1T)的



時，跟化合物(19)反



時，和化合物(33)反應。

化合物(1R)或化合物(1T)和化合物(19)或化合物(33)間的反應，在無溶劑或適當溶劑中還原劑的共存下進行。上述所用溶劑種類例如水，甲醇，乙醇，異丙醇等醇類，乙酸，二噁烷，四氫呋喃，二乙醚，二乙二醇二甲醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類。還原方法有利用甲酸、氫化硼鈉，氫化氰基硼鈉，氫

(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 (119)

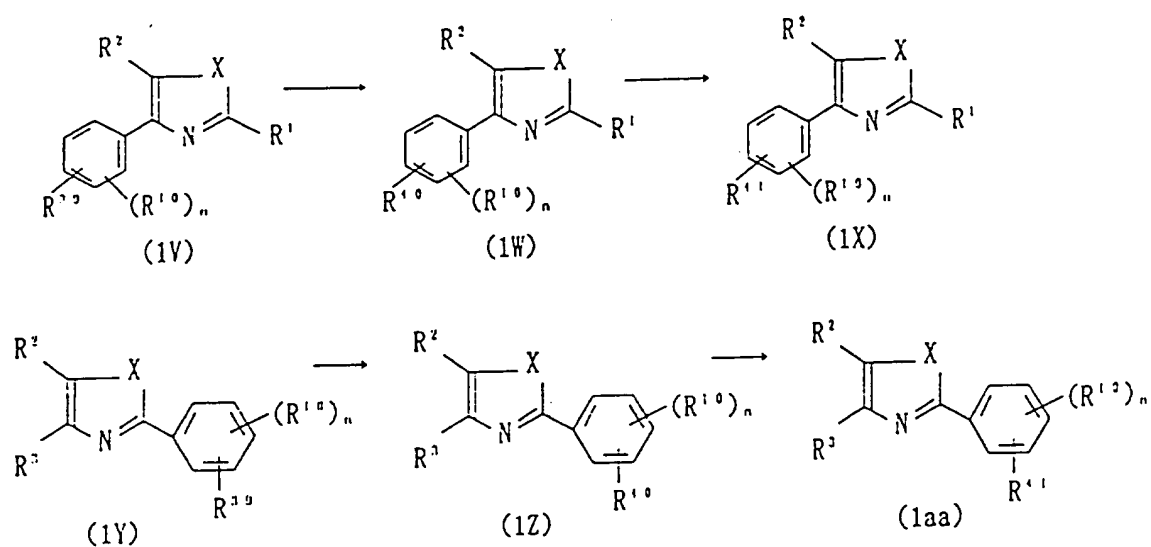
化鋁鋰等氫化劑的還原方法，利用鈮黑，鈮碳，氧化鉑，鉑黑，拉尼鎳等接觸還原催化劑的接觸還原方法等。當利用甲酸為還原劑時，反應溫度通常在室溫 $\sim 200^{\circ}\text{C}$ 下進行，尤宜在 $50\sim 150^{\circ}\text{C}$ 左右作用 $1\sim 10$ 小時而結束反應。甲酸的用量對一般式(1R)或(1T)所示化合物而計，採用大過剩量為宜。另外使用氫化劑還原時，反應通常在 $-30\sim 100^{\circ}\text{C}$ 下進行。尤宜在 $0\sim 70^{\circ}\text{C}$ 下作用 30 分鐘 ~ 20 小時而結束反應。還原劑的用量對一般式(1R)或(1T)所示化合物而計，通常採用相等莫耳 ~ 20 倍莫耳量，尤宜使用 $1\sim 15$ 倍莫耳量。特別是採用氫化鋁鋰為還原劑時，以使用二噁烷，四氫呋喃，二乙醚，二乙二醇二醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等的芳香族碳化氫類等溶劑為理想。採用接觸還原催化劑時，通常在常壓 ~ 20 氣壓下反應，尤宜在常壓 ~ 10 氣壓下的氫氣環境中， $-30\sim 100^{\circ}\text{C}$ 範圍溫度，尤宜在 $0\sim 60^{\circ}\text{C}$ 下進行。催化劑的用量對一般式(1R)或(1T)所示化合物而計，通常採用 $0.1\sim 40$ 重量%，其中以採用 $1\sim 20$ 重量%為較宜。另外，化合物(19)或化合物(33)的用量，對一般式(1R)或(1T)所示化合物而計。通常至少使用相等莫耳量，尤宜採用相等莫耳 \sim 大過剩量。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (120)

[反應式 - 26]



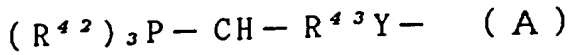
[上式中， R^1 ， R^2 ， R^3 ， $R^{1'0}$ ， n 和 X 所示意義如同前述。 $R^{3'}$ 示低級烷醯基。 $R^{4'0}$ 示低級烯基，低級烷氧基羰基取代低級烯基，羧基取代低級烯基或具有鹵素原子的低級烯基。 $R^{4'1}$ 示低級烷基，低級烷氧基羰基取代低級烷基或羧基取代低級烷基。]

將化合物 (1V) 或化合物 (1Y) 分別衍化為化合物 (1W) 或化合物 (1Z) 的反應在適當溶劑中，威第希氏試藥 (Wittig reagent) 和鹼性化合物的共存下進行。所用威第希氏試藥的例舉如下列一般式 (A) 所示磷化物，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

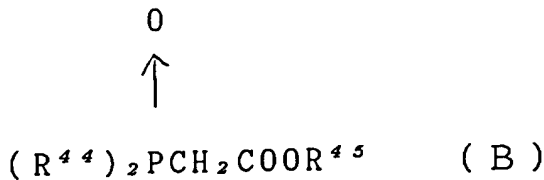
裝
訂
線

五、發明說明 (12)



[上式中， R^{42} 示苯基， R^{45} 示具有低級烷氧基羰基，羧基或鹵素原子為其取代基的低級烷基。Y所示意義如同前述。]

或下列一般式 (B) 所示磷化物，



[上式中， R^{44} 示低級烷氧基， R^{45} 示低級烷基。]

上述所用鹼性化合物的例舉如金屬鈉，金屬鉀，氫化鈉，胺基鈉，氫氧化鈉，氫氧化鉀，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鈉等的無機鹼性化合物，甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鉀等金屬醇鹽類，甲基鋰，正丁基鋰，苯基鋰，二異丙胺基鋰等烷基鋰，芳基鋰或胺基鋰類，吡啶，六氫吡啶，喹啉，三乙胺，N，N-二甲基苯胺等的有機鹼性化合物等。所用溶劑的種類祇要不影響反應的進行任何溶劑皆可採用，例如二乙醚，二噁烷，四氫呋喃，乙二醇二甲醚，二乙二醇二甲醚等醚類，苯，甲苯，二甲苯等芳香族碳氫類，正己烷，庚烷，環己烷等脂肪族碳氫類，吡啶，N，N-二甲基甲醯胺，二甲亞碸，六甲基磷酸三醯胺等非質子性極性溶劑，甲醇，乙醇，異丙醇等醇類。反應通常

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

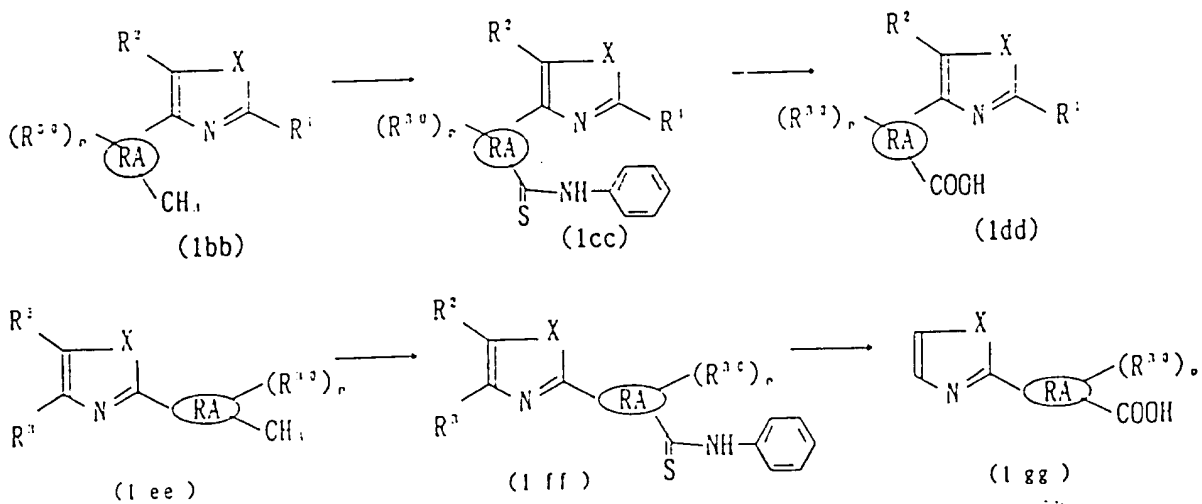
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (122)

在 - 80 ~ 150 °C 下進行，尤宜在 - 80 ~ 120 °C 下作用 0.5 ~ 1.5 小時左右而結束反應。

化合物 (1W) 或化合物 (1Z) 中，R⁴⁰ 示具有鹵素原子的低級烯基以外的基時，將化合物 (1W) 或化合物 (1Z) 分別衍化成為化合物 (1X) 或化合物 (1aa) 的反應，依照前述一般式 (1) 中，R¹ 或 R³ 為至少具有一個氧基在雜環上的氮原子鄰接處的 5 ~ 15 節環的單環、雙環或三環構造的雜環殘基的還原反應中所採用接觸加氫還原方法相同條件而進行。

[反應式 - 27]



[式中中，R¹，R²，R³，X，(RA)，R³⁰和 p 所
示意義如同前述。]

(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 (12B)

將化合物 (1 b b) 或化合物 (1 e e) 分別衍化成為化合物 (1 c c) 或化合物 (1 f f) 的反應在無溶劑下，和苯胺以及硫黃加熱而進行。

上述反應通常在 100 ~ 250 °C 下進行。尤宜在 100 ~ 200 °C 左右，作用 1 ~ 20 小時而結束反應。

苯胺和硫黃的用量對化合物 (1 b b) 或化合物 (1 e e) 而計，通常採用 1 ~ 10 倍莫耳量，尤宜使用 1 ~ 2 倍莫耳量。

將化合物 (1 c c) 或化合物 (1 f f) 分別衍化成為化合物 (1 d d) 或化合物 (1 g g) 的反應，依照前述化合物 (1) 中，R' 或 R³ 為至少具有一個烷氧基羰基的苯基所採用加水分解反應相同條件進行。

按照上述各種反應過程所得目的物質，可藉一般的分離方法易為分離並精製。上述分離方法包括溶劑萃取法，稀釋法，再結晶法，色層分離法，預製薄層分離法等。

本發明化合物包括其立體異構物，光學異構物在內不待說明。

本發明的一般式 (1) 所示噻唑或嘔唑衍生物，可藉由和醫藥上容許使用的酸類作用而容易製成其酸加成鹽。本發明也包括這種酸加成鹽在內。上述所採用酸類，例如鹽酸，硫酸，磷酸，溴氫酸等無機酸，乙酸，草酸，琥珀酸，馬來酸，富馬酸，蘋果酸，酒石酸，枸橼酸，丙二酸，甲烷磺酸，苯甲酸等有機酸。

另外，本發明的一般式 (1) 所示噻唑或嘔唑衍生物

(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)

中具有酸性基的化合物，可藉由和醫藥上容許使用的鹼性化合物作用而容易成為其鹽類。上述鹼性化合物的例舉有氫氧化鈉，氫氧化鉀，氫氧化鈣，碳酸鈉，碳酸氫鉀等。

本發明的化合物，通常以一般醫藥品製劑形態而利用。上述製劑可藉一般常用的填充劑，增量劑，結合劑，保濕劑，散解劑，表面活化劑，滑澤劑等稀釋劑或賦形劑而加調製之。上述製劑可視醫療目的而選擇其形態，其典型的劑形有錠劑、丸劑、散劑、液劑、懸濁劑、乳劑、顆粒劑、膠囊劑、坐劑、注射劑（包括液狀、懸濁狀），軟膏劑等。製成錠劑形態時，所用載劑包括已知各種載劑均可廣範採用，例如乳糖、白糖、氯化鈉、葡萄糖、尿素、澱粉、碳酸鈣、高嶺土、結晶狀纖維素、矽酸等賦形劑、水、乙醇、丙醇、糖漿、葡萄糖液、澱粉液、明膠液、羧甲基纖維素、蟲膠、甲基纖維素、磷酸鉀、聚乙烯吡咯烷酮等結合劑，乾燥澱粉，藻酸鈉，瓊脂粉，海帶（昆布）寡糖粉，碳酸氫鈉，碳酸鈣，聚氧化乙烯山梨糖醇脂肪酸酯類，月桂基硫酸鈉，硬脂酸單甘油酯，澱粉，乳糖等散解劑，白糖，硬脂精，可可脂，加氫油等散解抑制劑，第四級銨鹽，月桂基硫酸鈉等促進吸收劑，甘油，澱粉等保濕劑，澱粉，乳糖，高嶺土，膨潤土，膠狀矽酸等吸著劑，精製滑石，硬脂酸鹽，硼酸粉，聚乙二醇等滑澤劑等。另外錠劑視其需要尚可施加外衣處理，例如糖衣錠劑，腸溶性外衣錠劑，薄膜塗布錠劑，或雙層錠劑，多層錠劑等。製成丸劑形態時，也可採用該領域中廣範使用的已知載劑

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (125)

，例如葡萄糖，乳糖，澱粉，可可脂，硬化植物性油，高嶺土，滑石等賦形劑，阿拉伯膠粉，黃蓍膠粉，明膠，乙醇等結合劑，海帶寡糖，瓊脂等解散劑。製成坐劑形態時，也可廣範使用該領域中已知載劑，例如聚乙二醇，可可脂，高級醇類，高級醇類的酯類，明膠，半合成甘油酯等。調製成為注射劑時，所用液劑，乳劑和懸濁劑乃經過殺菌並製成和血液等滲壓為宜。製成上述液劑，乳劑和懸濁劑形態時，所有該領域中常用稀釋劑種類皆可使用，例如水，乳酸水溶液，乙醇，丙二醇，乙氧化異硬脂醇，聚氧化異硬脂醇，聚氧化乙烯山梨糖醇脂肪酸酯類等。另外，上述調製等滲壓溶液時，可在醫藥製劑中含有充分量的食鹽，葡萄糖或甘油，或添加一般補助溶解劑，緩衝劑，鎮痛劑等。必要時尚可在醫藥製劑中含有著色劑，保存劑，香料，風味劑，甘味劑等其他醫藥品。製成糊劑，乳劑，膠劑形態時，可廣範使用該領域中常用已知稀釋劑，例如白色凡士林，石臘，甘油，纖維素衍生物，聚乙二醇，矽，膨潤土等。

本發明以一般式(1)所示化合物或其鹽類在醫藥製劑中的含量並無特別限制，可在廣範圍內選擇使用。但通常占醫藥製劑中1~70重量%為較宜。

上述醫藥製劑的投藥方法並無特別限制，視各種製劑形態、患者年齡、性別或其他因素，病症輕重等而改變其投藥方法。例如採用錠劑、丸劑、液劑、懸濁劑、乳劑、顆粒劑和膠囊劑時可經口投與。採用注射劑時可單獨投與

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (125)

或混合葡萄糖，胺基酸等一般輔助液而行靜脈內投與，更有必要時可單獨在肌肉、皮內或皮上甚至腹腔內投與。採用坐劑時可直接施行直腸內投藥。

本發明的醫藥製劑，視患者年齡、性別或其他因素，病症輕重而可適當選擇其投藥量。一般以有效成分的一般式(1)所示化合物而言，每日體重1公斤計大約使用0.2~200mg為宜。

本發明藉參考例、實施例、製劑例以及藥理試驗例具體說明如下：

參考例 1

溶解3,4-二甲氧基苯基氰(25g)，硫代乙醯胺(23g)於10%鹽酸酸性二甲基甲醯胺(120ml)中，在90℃下加熱3小時。再於130℃下反應5小時後，蒸餾去除溶劑，用二乙醚(100ml)洗淨殘留物質二次。再用水(100ml)同樣洗滌後，濾取結晶並乾燥之。經由甲醇再結晶而得到3,4-二甲氧基硫代苯醯胺的淡褐色柱狀結晶18.7g

熔點：170~175℃(分解)

核磁氣共振譜(CDC ℓ_3) δ ：

3.94(3H, s)

3.95(3H, s)

6.83(1H, d, J=8.4Hz)、

7.15(1H, br s)、

(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)

- 7.38 (1 H, dd, $J = 2.2 \text{ Hz}$, 8.4 Hz)、
 7.52 (1 H, br s)、
 7.63 (1 H, d, $J = 2.2 \text{ Hz}$)。

參考例 2

懸濁 3, 4, 5-三甲氧基苯醯胺 (500 ml) 於苯 (15 ml) 中，加入五硫化磷 (5.26 mg)，加熱還流 30 分鐘。蒸餾去除溶劑，加入 10% 氫氧化鈉 (5 ml) 和水 (5 ml) 於殘留物質中，懸濁攪拌 30 分鐘。過濾反應溶液，所得固形物用少量的水，乙醇洗淨並乾燥而得 3, 4, 5-三甲氧基硫代苯醯胺的黃色粉末 330 mg。

熔點：182.5 ~ 184 °C

參考例 3

懸濁 3', 5'-二乙醯氧基乙醯苯 (4 g) 於二硫化碳 (75 ml) 中，在室溫下以大約 1 小時時間滴加含有溴 (0.90 ml) 的二硫化碳 (25 ml) 溶液。一面滴加，時而加熱至大約 50 °C，一開始反應就恢復至室溫並攪拌之。滴加完後在室溫下攪拌 1 小時。反應結束後蒸餾去除溶劑而得 3', 5'-二乙醯基氧基-2-溴化乙醯苯的褐色結晶 5.53 g。

熔點：61 ~ 62 °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 (12B)

參考例 4

溶解氯乙醯氯 (5.47 g) 於二氯甲烷 (20 ml) 中，冰冷下加入細碎過的氯化鋁 (6.46 g)。攪拌 30 分鐘後加入 3, 4-二氫-2H-1, 4-苯駢噁吡啶-3 (4H)-酮 (2 g)，冰冷下攪拌 4 小時，然後在室溫下攪拌一夜。反應混合物移入冰水中，濾取所析出結晶，水洗後乾燥而得 6- α -氯乙醯基-3, 4-二氫-2H-1, 4-苯駢噁吡啶-3-酮 (3.03 g)。

核磁氣共振譜 (DMSO- d_6) δ :

3.55 (2H, s)、

5.10 (2H, s)、

7.65-7.45 (3H, m)、

10.76 (1H, s)。

參考例 5

溶解 3, 4-二甲氧基苯甲酸 (2 g) 於甲醇 (80 ml) 中，加入甲醇鈉 (600 mg) 後攪拌 30 分鐘。蒸餾去除溶劑，溶解殘渣於二甲基甲醯胺 (50 ml) 中，再加入 6- α -氯乙醯基-3, 4-二氫羥基喹啉 (2.46 g)，於 140°C 下攪拌 2 小時。蒸餾去除溶劑，加水後濾取所析出結晶並乾燥而得 6-[2-(3, 4-二甲氧基苯甲醯氧基)乙醯基]-3, 4-二氫羥基喹啉的白色粉末 (4.8 g)。

熔點：215~216°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 (129)

參考例 6

懸濁 6- α -胺基乙醯基-3,4-二氫羥基喹啉-鹽酸鹽 (3 g) 於四氫呋喃 (60 ml) 中，加入三乙胺 (7 ml) 和 3,4-二甲氧基苯甲醯氯 (2.8 mg)，然後在室溫下攪拌之，3 小時後濾取所析出結晶，用甲醇洗淨並乾燥之。由甲醇中再結晶而得 6-[2-(3,4-二甲氧基苯甲醯胺基)乙醯基]-3,4-二氫羥基喹啉的白色針狀結晶 (2.6 g)。

熔點：246~247°C。

參考例 7-38

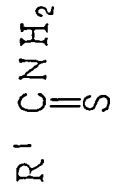
按照參例 1 或 2 相同方法，利用適當原料化合物製得第 1 表中所示化合物。

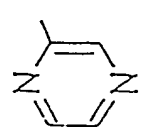
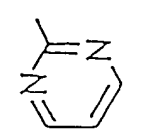
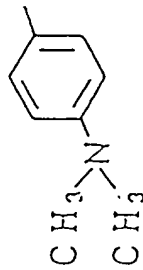
.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (130)

第 1 表

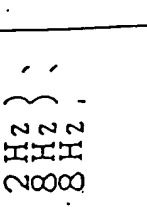
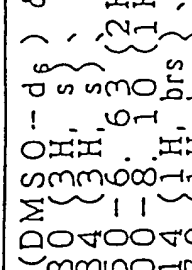
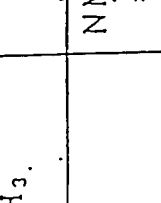
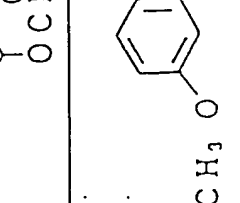


參考例	R ¹	物 性
7		NMR (DMSO-d ₆) δ: 6.7 (1H, m), 8.3 (1H, d), 8.5 (1H, d), 9.5 (1H, brs), 10.3 (1H, brs). J = 2.6 Hz, 4 Hz.
8		NMR (DMSO-d ₆) δ: 7.6 (1H, t), 8.0 (2H, d), 8.8 (1H, brs), 9.3 (1H, brs). J = 4.8 Hz.
9		結晶形: 淡褐色針狀 (從乙醇中再結晶) mp: 86-87°C (HCl 塩)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

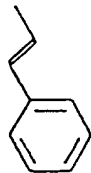
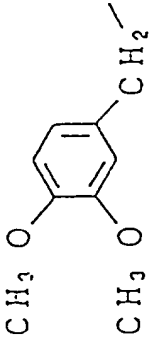
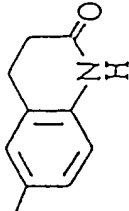
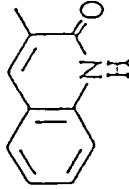
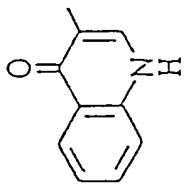
五、發明說明 (13)

參考例	R'	物 性
10		NMR (DMSO-d ₆) δ : 6.12 (2H, s) } 6.19 (1H, d) } = 8.2 Hz } 7.51 (1H, dd) } = 1.8 Hz } 7.59 (1H, dd, 2H) } 9.37 (1H, brs) } 9.73 (1H, brs) }
11		結晶形：黃色柱狀 (從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶) mp: 116-117°C
12		結晶形：黃色柱狀 (從乙酸乙酯中再結晶) mp: 130-131°C
13		NMR (DMSO-d ₆) δ : 3.80 (3H, s) } 3.85 (3H, s) } = 6.3 Hz } 6.00 (1H, brs) } 6.04 (1H, brs) } 9.17 (1H, brs) } 9.79 (1H, brs) }

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

..... 裝 訂 線

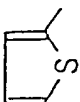
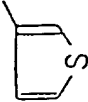
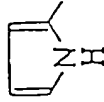
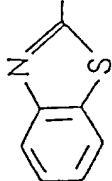
五、發明說明 (132)

參考例	R ¹	物 性
14		結晶形：褐色板狀（從甲醇中再結晶） mp：144-145°C
15		結晶形：淡褐色粉末狀（從乙醇中再結晶） mp：133-134°C
16		結晶形：褐色粉末狀（從二甲基醯胺和乙醇混液中再結晶） mp：243-246°C
17		結晶形：黃色鱗片狀（從二甲基醯胺和水混液中結晶） mp：281-282°C（分解）
18		NMR (DMSO-d ₆) δ： 12.96 (1H, brs) } } = 7 Hz 11.83 (1H, brs) } } = 8 Hz 9.29 (1H, d) } } = 7 Hz 8.77 (1H, d) } } = 8 Hz 7.64 (2H, m) 7.4 (1H, m)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

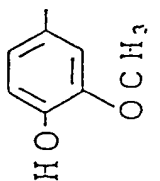
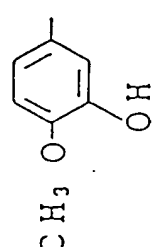
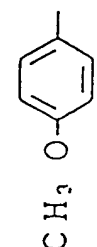
五、發明說明 (13B)

參考例	R'	物 性
19		NMR (CDCl ₃) δ : 7.57 (1H, dd, j = 5.1 Hz, 1.1 Hz) 7.50 (1H, dd, j = 3.9 Hz, 1.1 Hz) 7.09 (1H, dd, j = 5.0 Hz, 3.9 Hz) 7.6-6.9 (2H, br)
20		NMR (CDCl ₃) δ : 8.00 (1H, dd, j = 3.0 Hz, 4 Hz) 7.51 (1H, dd, j = 5.1 Hz, 4 Hz) 7.33 (1H, dd, j = 5.1 Hz, 3.0 Hz) 7.9-7.0 (2H, br)
21		NMR (CDCl ₃) δ : 10.0-9.3 (1H, br) 7.05 (1H, brs) 7.1-6.7 (2H, br) 6.3-5.6 (1H, brs) 6.3-6.25 (1H, m)
22		NMR (DMSO-d ₆) δ : 10.3-8.5 (1H, brs) 8.2-8.0 (1H, brs) 7.7-7.45 (2H, m)

(請先閱讀請背面之注意事項再填寫本頁)

..... 裝 訂 線

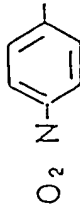

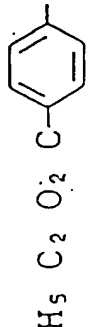
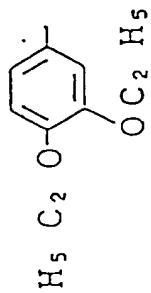
五、發明說明 (134)

參考例	R ¹	物 性
23		NMR (CDCl ₃) δ: j = 2. 1 Hz), 7. 71 (1H, d), 7. 66 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 32 (1H, dd, j = 8. 3 Hz), 7. 28 (2H, s), 6. 92 (1H, d), 6. 92 (1H, d), 6. 97 (3H, s)
24		NMR (CDCl ₃) δ: j = 8. 5 Hz), 7. 55 (1H, dd, j = 3 Hz), 7. 5 (1H, brs), 7. 45 (1H, d), 7. 15 (1H, brs), 7. 06 (1H, d), 6. 73 (3H, s), 6. 95 (3H, s)
25		NMR (CDCl ₃) δ: j = 2H, m), 8. 05 (2H, brs), 7. 15 (1H, brs), 7. 10 (1H, brs), 7. 06 (2H, m), 3. 86 (3H, s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

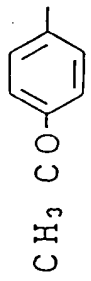
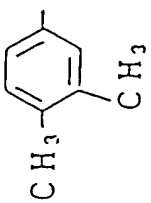
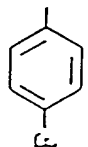
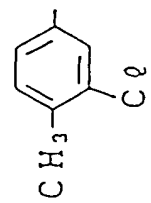
五、發明說明 (135)

參考例	R ¹	物 性
26		NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.22 (1H, brs), 9.81 (1H, brs), 8.24 (2H, d, J=8.6 Hz), 8.01 (2H, d, J=8.8 Hz)
27		NMR (DMSO-d ₆) δ: 9.55 (1H, brs), 9.55 (1H, brs), 7.55 (2H, m), 7.55 (2H, m)
28		NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.06 (1H, brs), 9.67 (1H, brs), 8.15 (4H, m, J=7.2 Hz), 4.33 (2H, dq, J=7.2 Hz), 1.31 (3H, t, J=7.2 Hz)
29		NMR (DMSO-d ₆) δ: 9.62 (1H, brs), 9.35 (1H, brs), 7.95 (2H, m), 7.65 (1H, d, J=9.1 Hz), 6.95 (1H, d, J=7.7 Hz), 6.07 (2H, q, J=7.7 Hz), 4.04 (2H, t, J=7.7 Hz), 1.33 (3H, t, J=7.7 Hz)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

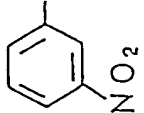
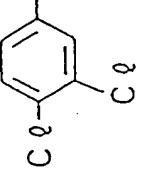
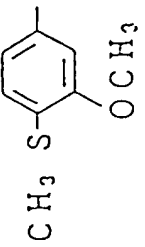
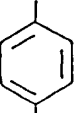
五、發明說明 (13b)

參考例	R ¹	物性
30		NMR (DMSO-d ₆) δ : 10.05 (1H, brs), 9.65 (1H, brs), 8.02-7.85 (4H, m), 2.60 (3H, s)
31		NMR (DMSO-d ₆) δ : 9.68 (1H, brs), 9.33 (1H, brs), 7.71 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.63 (1H, dd, J=7.8 Hz), 7.15 (1H, d, J=7.9 Hz), 2.24 (6H, s)
32		NMR (DMSO-d ₆) δ : 9.88 (1H, brs), 9.50 (1H, brs), 8.05-7.15 (2H, m)
33		NMR (DMSO-d ₆) δ : 9.34 (1H, brs), 9.59 (1H, brs), 7.77 (1H, dd, J=8.0 Hz), 7.39 (1H, d, J=8.0 Hz), 2.34 (3H, s)

(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)

參考例	R ¹	物 性
34		NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.21 (1H, brs), 9.85 (1H, brs), J = 2 Hz), 8.69 (1H, t, J = 2 Hz), 8.48 (2H, m), 7.71 (1H, t, J = 8 Hz)
35		NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.09 (1H, brs), 9.66 (1H, brs), J = 2 Hz), 8.08 (1H, d, J = 8 Hz), 7.86 (1H, dd, J = 8 Hz), 7.69 (1H, d, J = 8 Hz)
36		NMR (DMSO-d ₆) δ: 9.76 (1H, brs), J = 6 Hz), 9.43 (1H, brs), J = 6 Hz), 7.59 (1H, dd, J = 4 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1 Hz), 7.18 (3H, s), 7.41 (3H, s)
37		NMR (DMSO-d ₆) δ: 9.56 (1H, brs), 9.59 (1H, brs), 7.77 (2H, m), 7.75 (2H, m)

(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)

參考例	R ¹	物 性
38	$\text{CH}_2 = \text{CHCH}_2 \text{O} \begin{array}{c} \\ \text{C}_6\text{H}_4 \\ \\ \text{OCH}_3 \end{array}$	NMR (DMSO-d ₆) δ : 6.5 (1H, brs) } 7.3 (1H, brs) } 7.5 (2H, m) } 7.6 (1H, m) } 7.7 (1H, m) } 7.8 (1H, m) } 8.0 (2H, m) } 8.8 (3H, s) }

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (139)

參考例 39 ~ 60

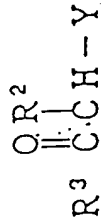
按照參考例 3 或 4 相同方法，利用適當原料化合物製得第 2 表中所示化合物。

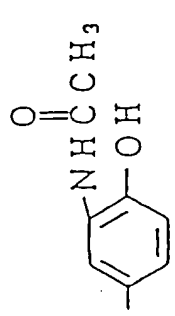
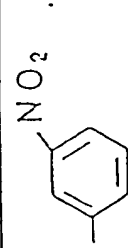
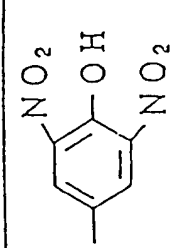
.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (140)

第 2 表

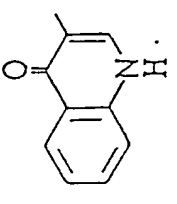
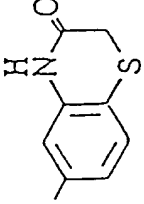
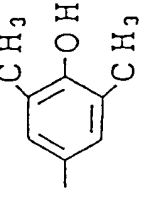
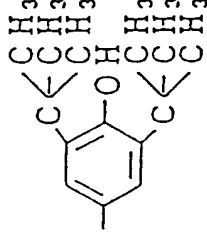


參考例	R ²	R ³	Y	物 性
39	H		Cl	結晶形：白色粉末狀（從丙酮中再結晶） mp：210-212°C（分解）
40	H		Br	結晶形：淡黃色 稜 狀（從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶） mp：85-86°C
41	H		Br	NMR (CDCl ₃) δ: 4.42 (2H, s), 8.93 (2H, s)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

..... 裝 訂 線

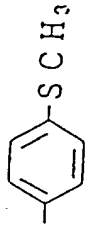
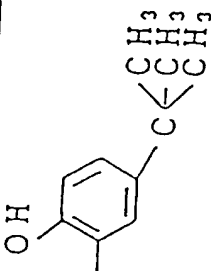
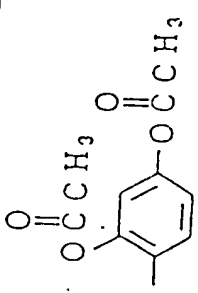
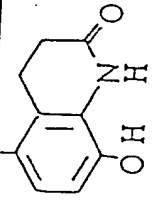
五、發明說明 (14)

參考例	R ²	R ³	Y	物 性
42	H		Br	NMR (DMSO-d ₆) δ: 1.2, 7.5 (1H, brs), J = 8 Hz } 8.6, 4.3 (1H, d, J = 8 Hz } 8.7, 3.6 (1H, d, J = 8 Hz } 7.5, 7.7 (2H, m) 4.9, 3.4 (2H, s)
43	H		C ₀	NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.7, 6.7 (1H, s) 7.5, 7.4 (3H, m) 3.1, 5.5 (2H, s)
44	H		C ₀	NMR (CDCl ₃) δ: 2.3, 3.0 (6H, s) 4.6, 6.5 (2H, s) 7.6, 6.4 (2H, s)
45	H		C ₀	NMR (CDCl ₃) δ: 1.3, 3.2 (9H, s) 4.7, 5.0 (2H, s) 7.5, 6.0 (1H, d, J = 2.4 Hz) 7.7, 5.0 (1H, d, J = 2.4 Hz)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

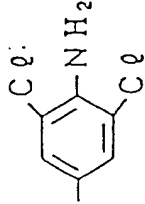
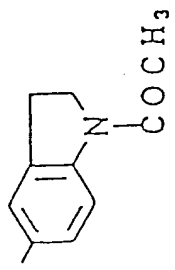
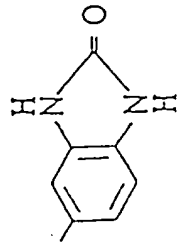
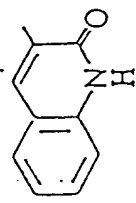
五、發明說明 (142)

參考例	R ²	R ³	Y	物 性
46	H		C ₀	NMR (CDCl ₃) δ: { 2.5 (3H, s), 7.2 (2H, s), 7.8 (1H, d), 7.8 (1H, d) } J = 8.8 Hz
47	H		C ₀	NMR (CDCl ₃) δ: { 1.3 (9H, s), 4.3 (1H, s), 4.6 (1H, s), 6.1 (1H, s), 7.3 (1H, s), 7.4 (1H, s), 7.5 (1H, s) }
48	H		B ₁	NMR (CDCl ₃) δ: { 7.8 (1H, d), 7.1 (1H, dd), 7.0 (2H, 3Hz), 4.0 (1H, d), 3.7 (2H, s), 2.3 (3H, s) } J = 8.6 Hz, J = 8.6 Hz, J = 2.2 Hz
49	H		C ₀	結晶形：白色粉末狀 mp: 189-191°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

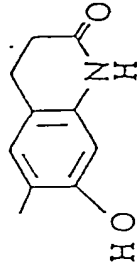
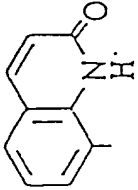
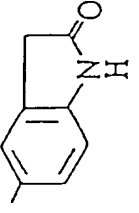
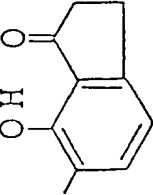
五、發明說明 (14B)

參考例	R ²	R ³	Y	物性
50	H		Br	結晶形：淡綠色針狀 (從甲醇中再結晶) mp: 151-153°C
51	H		Cl	結晶形：無色針狀 mp: 238-240°C
52	H		Cl	NMR (DMSO-d ₆) δ : 5.14 (2H, s) J = 8.2 Hz) 7.06 (1H, d) 7.52 (1H, s) 7.70 (1H, dd) J = 1.6 Hz, 10.97 (1H, s) 11.12 (1H, s)
53	H		Br	結晶形：白色粉末狀 mp: 201-210°C (分解)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

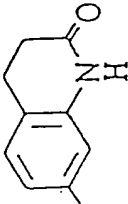
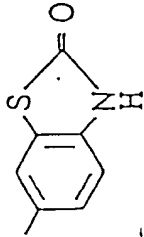
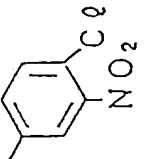
五、發明說明 (14)

參考例	R ²	R ³	Y	物性
54	H		C ₀	結晶形：無色板狀 mp: 210-215°C
55	H		C ₀	結晶形：淡黃色針狀 mp: 179-180°C
56	H		C ₀	結晶形：白色粉末狀 (從甲醇和氯仿混液中再結晶) mp: 246.5-247°C
57	H		C ₀	結晶形：白色粉末狀 mp: 146-148°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 (145)

參考例	R ²	R ³	Y	物性
58	H		Ce	NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.43-2.50 (2H, m), 2.49-2.53 (2H, m), 5.13 (1H, d), 5.35 (1H, d), 7.33 (1H, dd), 7.48 (1H, dd), 10.28 (1H, s) J = 6.4 Hz, J = 1.4 Hz, J = 1.4 Hz
59	H		Br	結晶形：白色粉末狀 NMR (DMSO-d ₆) δ: 4.82 (2H, s), 7.18 (1H, d), 7.90 (1H, d), 8.25 (1H, d) J = 8.4 Hz, J = 1.8 Hz, J = 1.8 Hz
60	H		Br	結晶形：黃色針狀 (從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶) mp: 83-84°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 (146)

參考例 6 1

懸濁 1, 3-二氯丙酮 (1.5 g) 和 3, 4-二甲氧基硫代苯醯胺 (2.3 g) 於乙醇 (100 ml) 中，並加熱反應 3 小時。蒸餾去除溶劑，所得殘渣經矽膠柱管層析法精製 (溶出液為二氯甲烷) 而得 2-(3, 4-二甲氧基苯基)-4-氯甲基噻唑 (1.86 g)。

無色粘稠性油狀物。

核磁氣共振譜 (CDC_l₂) δ :

3.94 (3H, s)、

3.99 (3H, s)、

4.74 (2H, s)、

6.90 (1H, d, $J = 8.3$ Hz)、

7.24 (1H, s)、

7.46 (1H, dd, $J = 2.1$ Hz,

8.3 Hz)、

7.53 (1H, d, $J = 2.1$ Hz)。

參考例 6 2 - 7 0

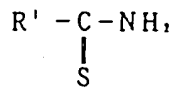
按照參考例 1 或 2 相同方法，利用適當原料化合物製得表 3 中所示化合物。

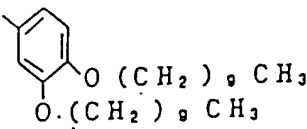
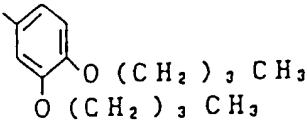
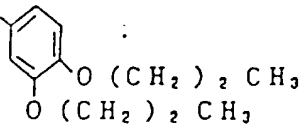
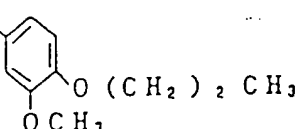
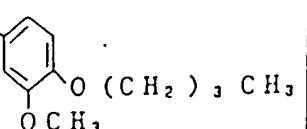
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (14)

第3表

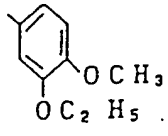
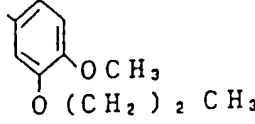
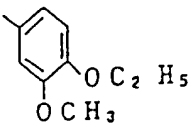
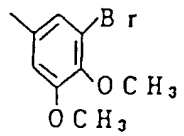


参考例	R'	物 性
62		NMR (DMSO-d ₆) δ : 0.84(6H, brs), 1.10-1.53(28H, m), 1.60-1.8 (4H, m), 3.85-4.15(4H, m), 6.94(1H, d, J=9.2Hz), 7.53-7.65(2H, m), 9.29(1H, brs), 9.61(1H, brs)
63		NMR (DMSO-d ₆) δ : 0.92(6H, t, J=7.2Hz), 1.30-1.55(4H, m), 1.55- 1.81(4H, m), 3.99(4H, q, J=6.2Hz), 6.96(1H, d, J= 9.1Hz), 7.50-7.65(1H, m), 9.30(1H, brs), 9.62 (1H, brs)
64		NMR (DMSO-d ₆) δ : 0.97(6H, t, J=7.4Hz), 1.58-1.85(4H, m), 3.95 (4H, q, J=6.4Hz), 6.96(1H, d, J=9.1Hz), 7.50- 7.62(2H, m), 9.30(1H, brs), 9.62(1H, brs)
65		NMR (DMSO-d ₆) δ : 0.96(3H, t, J=7.3Hz), 1.61-1.86(2H, m), 3.97 (3H, s), 3.96(2H, t, J=6.6Hz), 6.96(1H, d, J=9.2 Hz), 7.50-7.62(2H, m), 9.32(1H, brs), 9.63(1H, brs)
66		NMR (DMSO-d ₆) δ : 0.92(3H, t, J=7.2Hz), 1.30-1.55(2H, m), 1.55- 1.80(2H, m), 3.78(3H, s), 4.00(2H, t, J=6.5Hz), 6.96(1H, d, J=9.1Hz), 7.52-7.66(2H, m), 9.31 (1H, brs), 9.63(1H, brs)

(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)

參考例	R'	物 性
67		NMR (DMSO-d ₆) δ : 1.33(3H, t, J=6.9Hz), 3.80(3H, s), 4.04(2H, q, J=6.9Hz), 6.96(1H, d, J=8.2Hz), 7.50-7.66(2H, m), 9.31(1H, brs), 9.63(1H, brs)
68		NMR (DMSO-d ₆) δ : 0.97(3H, t, J=7.4Hz), 1.63-1.88(2H, m), 3.80(3H, s), 3.94(2H, t, J=6.6Hz), 6.96(1H, d, J=8.3Hz), 7.53-7.67(2H, m), 9.31(1H, brs), 9.63(1H, brs)
69		NMR (DMSO-d ₆) δ : 1.33(3H, t, J=7.0Hz), 3.78(3H, s), 4.05(2H, q, J=7.0Hz), 6.95(1H, d, J=9.1Hz), 7.51-7.66(2H, m), 9.31(1H, brs), 9.64(1H, brs)
70		NMR (DMSO-d ₆) δ : 3.77(3H, s), 3.87(3H, s), 7.58(1H, d, J=2.1Hz), 7.75(1H, d, J=2.1Hz), 9.52(1H, brs), 9.95(1H, brs)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (14)

參考例 7 1 ~ 7 4

按照參考例 3 或 4 相同方法，利用適當原料化合物製得表 4 中所示化合物。

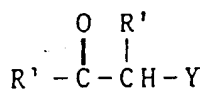
.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

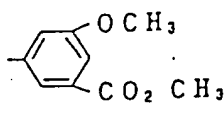
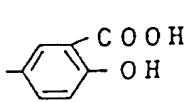
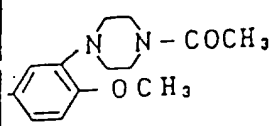
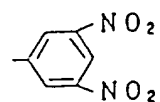
.....
裝.....
訂.....
線.....
.....

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (150)

第4表



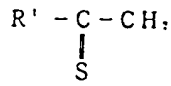
參考例	R ²	R ¹	Y	物 性
71	H		Br	NMR (CDC l ₃) δ : 3.91(3H, s), 3.96(3H, s), 4.49(2H, s), 7.66-7.75(1H, m), 7.75-7.86(1H, m), 8.19(1H, t, J=1.4Hz)
72	H		Br	NMR (DMSO-d ₆) δ : 4.90(2H, s), 7.10(1H, t, J=6.5Hz), 8.04-8.20(1H, m), 8.45(1H, d, J=1.7Hz)
73	H		Cl	淡桃色粉末狀 NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.05(3H, s), 2.84-3.10(4H, m), 3.52-3.67(4H, m), 3.92(3H, s), 5.13(2H, s), 7.12(1H, d, J=8.6Hz), 7.45(1H, d, J=2.0Hz), 7.73(1H, dd, J=2.0Hz, 8.6Hz)
74	H		Br	NMR (CDC l ₃) δ : 4.50(2H, s), 9.07-9.49(3H, m)

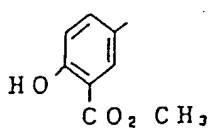
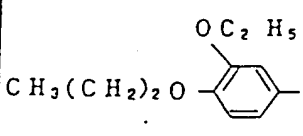
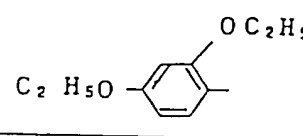
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (152)

第5表



參考例	R'	物 性
75		NMR (CDC l ₃) δ : 4.00(3H, s), 7.15(1H, d, J=8.8Hz), 7.15(1H, brs), 7.52(1H, brs), 8.08(1H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 8.46(1H, d, J=2.5Hz), 11.17(1H, s)
76		NMR (CDC l ₃) δ : 1.05(3H, t, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.0Hz), 1.79 -1.93(2H, m), 4.02(2H, t, J=6.8Hz), 4.13(2H, q, J =7.0Hz), 6.85(1H, d, J=8.4Hz), 7.16(1H, brs), 7.37(1H, dd, J=2.3Hz, 8.4Hz), 7.54(1H, brs), 7.60(1H, d, J=2.3Hz)
77		NMR (CDC l ₃) δ : 1.43(3H, t, J=7.0Hz), 1.50(3H, t, J=7.0Hz), 4.01 -4.23(4H, m), 6.43(1H, d, J=2.3Hz), 6.53(1H, dd, J=9.0Hz, 2.3Hz), 7.98(1H, brs), 8.69(1H, d, J= 9.0Hz), 9.23(1H, brs)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (15B)

參考例 78 ~ 97

按照參考例 3 或 4 相同方法，利用適當原料化合物製得表 6 中所示化合物。

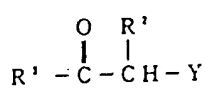
.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

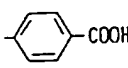
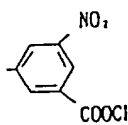
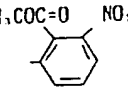
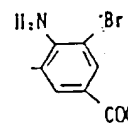
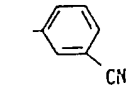
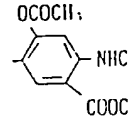
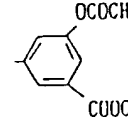
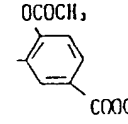
.....
裝.....訂.....線.....
.....

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (154)

第 6 表



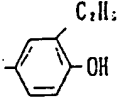
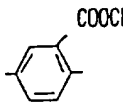
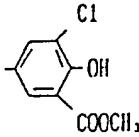
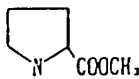
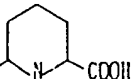
參考例	R'	R ²	Y	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點 (°C) (塩的形態)
78	H		Br		NMR ¹¹ (-)
79	"		"		NMR ¹¹ (-)
80	"		"		NMR ¹¹
81	"		"		NMR ¹¹ (-)
82	"		"		NMR ¹¹ (-)
83	"		"		NMR ¹¹ (-)
84	"		"		NMR ¹¹ (-)
85	"		"		NMR ¹¹ (-)

(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 (15%)

參考例	R ¹	R ²	Y	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點 (°C) (晶的形態)
93	H		Cl		NMR ¹¹¹ (-)
94	CH ₃		Br	白色粉末狀晶 (正己烷 - 二氯甲烷)	102-103 (-)
95	H		Cl	白色粉末狀晶 (乙酸乙酯 - 正己烷)	121-122 (-)
96	"		"		NMR ¹¹¹ (-)
97	"		Br		NMR ¹¹¹ (-)

(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 (157)

核磁氣共振譜資料：

N M R ¹⁾ 參考例 78 的化合物N M R (C D C ℓ_3) δ p p m ;

2.65 (3 H, s)

4.65 (2 H, s)

7.98 - 8.16 (5 H, m)

N M R ²⁾ 參考例 79 的化合物N M R (C D C ℓ_3) δ p p m ;

4.06 (3 H, s)

4.57 (2 H, s)

8.91 (1 H, t, J = 1.9 H z)

8.98 (1 H, t, J = 1.9 H z)

9.05 (1 H, t, J = 1.9 H z)

N M R ³⁾ 參考例 80 的化合物N M R (C D C ℓ_3) δ p p m ;

4.00 (3 H, s)

4.42 (2 H, s)

7.76 (1 H, t, J = 8.0 H z)

8.11 (1 H, d d, J = 1.1 H z,

J = 8.0 H z)

8.32 (1 H, d d, J = 1.1 H z,

J = 8.0 H z)

N M R ⁴⁾ 參考例 81 的化合物N M R (C D C ℓ_3) δ p p m ;

(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)

3. 88 (3 H, s)

4. 52 (2 H, s)

5. 62 (2 H, b r s)

8. 40 (1 H, d, J = 1. 8 H z)

8. 42 (1 H, d, J = 1. 8 H z)

N M R ⁵⁾ 參考例 8 2 的化合物N M R (C D C l₃) δ p p m ;

4. 45 (2 H, s)

7. 65 (1 H, m)

7. 67 (1 H, m)

8. 21 (1 H, m)

8. 28 (1 H, m)

N M R ⁶⁾ 參考例 8 3 的化合物N M R (C D C l₃) δ p p m ;

2. 27 (3 H, s)

2. 62 (3 H, s)

3. 94 (3 H, s)

4. 43 (2 H, s)

8. 30 (1 H, s)

8. 48 (1 H, s)

N M R ⁷⁾ 參考例 8 4 的化合物N M R (C D C l₃) δ p p m ;

2. 34 (3 H, s)

3. 94 (3 H, s)

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁).....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (15)

4 . 5 2 (2 H , s)

7 . 8 9 (1 H , m)

7 . 9 7 (1 H , m)

8 . 4 3 (1 H , m)

N M R ⁸⁾ 參考例 8 5 的化合物N M R (C D C l ₃) δ p p m ;

2 . 3 9 (3 H , s)

3 . 9 6 (3 H , s)

4 . 4 6 (2 H , s)

7 . 2 1 (1 H , d , J = 8 . 6 H z)

8 . 2 9 (1 H , d d , J = 2 . 0 H z)

J = 8 . 6 H z)

8 . 5 8 (1 H , d , J = 2 . 0 H z)

N M R ⁹⁾ 參考例 8 6 的化合物N M R (C D C l ₃) δ p p m ;

3 . 9 4 (3 H , s)

4 . 5 4 (2 H , s)

7 . 0 9 (2 H , d , J = 8 . 7 H z)

8 . 1 5 (1 H , d d , J = 2 . 0 H z ,

J = 8 . 7 H z)

1 2 . 1 1 (1 H , s)

N M R ¹⁰⁾ 參考例 8 7 的化合物N M R (C D C l ₃) δ p p m ;

4 . 0 0 (3 H , s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

. 裝 訂 線

五、發明說明 (160)

4. 64 (2 H, s)

8. 76 (2 H, d, J = 2. 2 Hz)

8. 85 (1 H, d, J = 2. 2 Hz)

12. 50 (1 H, b r s)

NMR ¹¹⁾ 參考例 93 的化合物

NMR (CDCl₃) δ ppm ;

1. 27 (3 H, t, J = 7. 5 Hz)

2. 68 (2 H, t, J = 7. 5 Hz)

4. 67 (3 H, s)

5. 73 (1 H, s)

6. 85 (1 H, d, J = 8. 4 Hz)

7. 75 (1 H, dd, J = 2. 3 Hz ,

8. 4 Hz)

7. 82 (1 H, d, J = 2. 3 Hz)

NMR ¹²⁾ 參考例 96 的化合物

NMR (CDCl₃) δ ppm ;

3. 91 (3 H, s)

4. 48 (2 H, s)

7. 35 (1 H, m)

7. 71 (1 H, m)

10. 48 (1 H, b r s)

NMR ¹³⁾ 參考例 97 的化合物

NMR (DMSO-d₆) δ ppm ;

5. 04 (2 H, s)

.....
(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)

7. 56 (1 H, b r s)

8. 10 - 8. 39 (3 H, m)

參考例 98 ~ 116

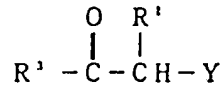
按照參考例 3 或 4 相同方法，利用適宜原料化合物製
得表 7 中所示化合物

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....
.....

五、發明說明 (162)

第7表



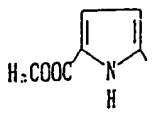
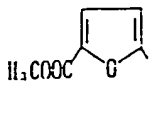
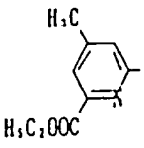
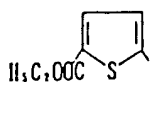
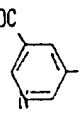
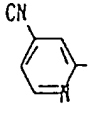
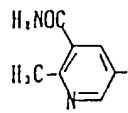
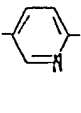
參考例	R ²	R ¹	Y	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
98	H		Cl		NMR ¹¹¹ (-)
99	"		"		NMR ¹¹¹
100	"		"	褐色固体	NMR ¹¹¹ (-)
101	"		"		NMR ¹¹¹ (-)
102	"		"	白色針狀晶	NMR ¹¹¹ (-)
103	"		"	白色針狀晶 (乙醇)	107-108 (-)

(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



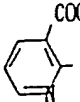
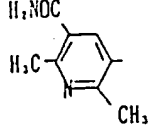
五、發明說明 (16)

參考例	R ¹	R ²	Y	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (塊的形態)
104	H		Br		NMR ²¹¹ (-)
105	"		"		NMR ²¹¹ (-)
106	"		"		NMR ²¹¹ (-)
107	"		"		NMR ²¹¹ (-)
108	"		"		NMR ²¹¹ (HBr)
109	"		"		NMR ²¹¹ (HBr)
110	"		"		NMR ²¹¹ (-)
111	"		"		NMR ²¹¹

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (164)

參考例	R ²	R ¹	Y	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (塩的形態)
112	H	H ₃ COOC 	Br		NMR ²¹¹ (-)
113	"	H ₃ COOC 	"		NMR ²¹¹ (-)
114	"	 COCCH ₃	"		NMR ²¹¹ (-)
115	"	 H ₃ C H ₃ C H ₃ NOC	"	- 2	NMR ²¹¹ (HBr)

(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 (165)

參考例 98 ~ 102, 105 ~ 113 和 115 ~ 11
的化合物的核磁氣共振譜資料：

NMR ¹⁴⁾ : 參考例 98 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 2.59 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.64 (2H, s), 6.90 (1H, s), 8.25 (1H, s), 11.12 (1H, s)

NMR ¹⁵⁾ : 參考例 99 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 2.33 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.62 (2H, s), 6.79 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.80 (1H, d, J = 8.1 Hz), 11.40 (1H, s)

NMR ¹⁶⁾ : 參考例 100 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.25 (3H, t, J = 7.5 Hz), 2.73 (2H, q, J = 7.5 Hz), 4.00 (3H, s), 4.67 (2H, s), 7.98 (1H, d, J = 1.71 Hz), 8.35 (1H, d, J = 1.7 Hz), 11.66 (1H, s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (165)

NMR ¹⁷⁾ : 參考例 101 的化合物

¹H-NMR(CDC1₃) δ : 4.06 (3H, s), 4.68 (2H, s), 4.75 (2H, s), 7.74 (1H, dd, J = 2.01 Hz, 6.7 Hz), 8.06 (1H, dd, J = 2.0 Hz, 6.7 Hz), 8.19 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.55 (1H, d, J = 2.3 Hz), 12.04 (1H, s)

NMR ¹⁸⁾ : 參考例 102 的化合物

¹H-NMR(CDC1₃) δ : 3.99 (3H, s), 4.75 (2H, s), 7.00 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.56 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.99 (1H, dd, J = 1.8 Hz, 7.8 Hz), 8.03 (2H, d, J = 8.5 Hz), 1.43 (1H, s), 7.74 (2H, d, J = 8.5 Hz)

NMR ¹⁹⁾ : 參考例 104 的化合物

¹H-NMR(CDC1₃) δ : 3.92 (3H, s), 4.28 (2H, s), 6.90 (1H, dd, J = 2.1 Hz, 3.3 Hz),

(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)

6.95 (1 H, dd, J =
2.1 Hz, 3.3 Hz),
9.90 (1 H, br s)

NMR²⁰⁾: 參考例 105 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 3.95 (3 H, s), 4.42 (2 H, s), 7.26 (1 H, d, J = 3.76 Hz), 7.34 (1 H, d, J = 3.7 Hz)

NMR²¹⁾: 參考例 106 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.47 (3 H, t, J = 7.1 Hz), 2.61 (3 H, s), 4.46 (2 H, q, J = 7.1 Hz), 5.00 (2 H, s), 8.21 (2 H, m)

NMR²²⁾: 參考例 107 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.40 (3 H, t, J = 7.1 Hz), 4.36 (2 H, s), 4.38 (2 H, q, J = 7.1 Hz), 7.74 (1 H, d, J = 4.0 Hz), 7.78 (1 H, d, J = 4.0 Hz)

NMR²³⁾: 參考例 108 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 4.10 (3 H, s), 4.92 (2 H, s), 9.41 - 10.01

(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)

(3 H, m), d, J = 4.0 Hz
) , 7.78 (1 H, d, J =
4.0 Hz)

NMR²⁴⁾ : 參考例 109 的化合物

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ : 5.05 (2 H, s), 8.20
(1 Hz, dd, J = 1.6 Hz
, 5.0 Hz), 8.42 (1 H
, dd, J = 0.9 Hz, 1.6
Hz), 9.01 (1 H, dd,
J = 0.9 Hz, 5.0 Hz)

NMR²⁵⁾ : 參考例 110 的化合物

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ : 2.73 (3 H, s) 5.03 (
2 H, s), 8.17 (1 H,
brs), 8.26 (1 H,
drs), 8.44 (1 H, d,
J = 2.1 Hz), 8.54 (
1 H, d, J = 2.1 Hz)

NMR²⁶⁾ : 參考例 111 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 4.01 (3 H, s), 4.88 (
2 H, s), 8.15 (1 H, dd
, J = 0.76 Hz, 8.1 Hz)
, 8.45 (1 H, dd, J =
2.1 Hz, 8.1 Hz),
9.13 (1 H, m)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (16D)

NMR ²⁷⁾ : 參考例 1 1 2 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.45 (3 H, t, J = 7.1 Hz), 4.52 (2 H, q, J = 7.1 Hz), 4.78 (2 H, s), 8.49 (1 H, d, J = 8.1 Hz), 8.96 (1 H, dd, J = 1.9 Hz, 8.1 Hz), 9.55 (1 H, d, J = 1.9 Hz)

NMR ²⁸⁾ : 參考例 1 1 3 的化合物

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ : 2.77 (3 H, s), 5.08 (2 H, s), 8.11 (1 H, d, J = 5.7 Hz), 8.25 (1 H, s), 8.96 (1 H, d, J = 5.7 Hz)

NMR ²⁹⁾ : 參考例 1 1 4 的化合物

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 4.11 (3 H, s), 4.76 (2 H, s), 7.60 (1 H, dd, J = 4.8 Hz, 7.9 Hz), 8.12 (1 H, dd, J = 1.5 Hz, 7.9 Hz), 8.76 (1 H, dd, J = 1.5 Hz, 4.8 Hz)

NMR ³⁰⁾ : 參考例 1 1 5 的化合物

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (17D)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 2.82 (3H, s), 2.87 (3H, s), 5.20 (1H, s), 8.09 (1H, brs), 8.42 (1H (1H, brs), 9.01 (1H, s)

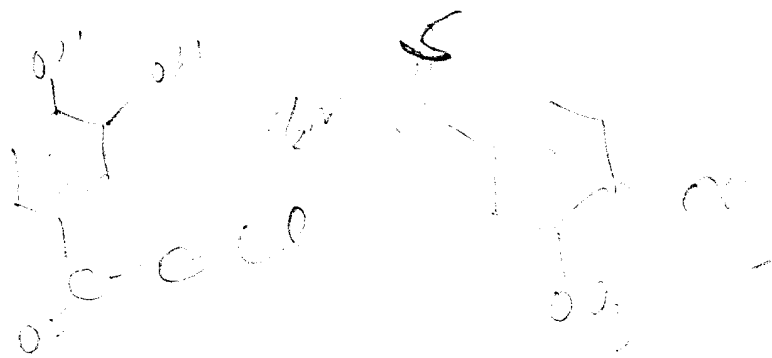
實施例 1

懸濁 3', 4'-二羥基-2-氯乙醯苯 (367 mg) 和 3, 4-二甲氧基硫代苯醯胺 (430 mg) 於乙醇 (20 ml) 中，加熱還流 3 小時。冷卻後濾取所析出結晶，經乙醇洗淨，乾燥，再從乙醇中再結晶而得 2-(3, 4-二甲氧基苯基)-4-(3, 4-二羥基苯基) 噻唑鹽酸鹽的黃色針狀結晶 (160 mg)。

熔點：146 ~ 148 °C

實施例 2 ~ 136

按照實施例 1 所示相同方法，利用適當原料化合物製得表 8 和表 9 中所示化合物。

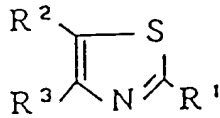


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

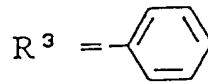
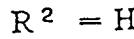
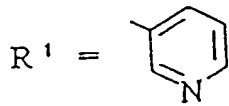
裝
訂
線

五、發明說明 (17)

第 8 表

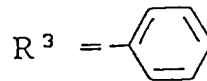
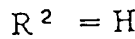
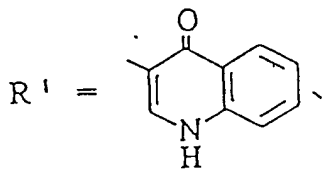


實施例 2 的化合物



結晶形：黃色稜狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 182-183°C (分解, 1/4 FeCl₂ 鹽)

實施例 3 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀 (從二甲基甲醯胺中再結晶)

mp : 300°C 以上

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (172)

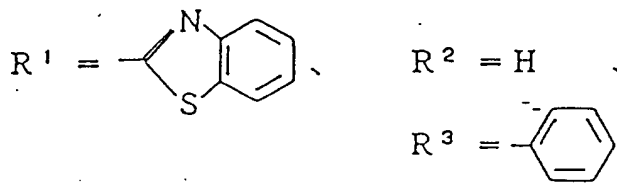
實施例 4 的化合物



結晶形：無色針狀 (從乙醚和正己烷混液中再結晶)

mp : 59 - 60 °C

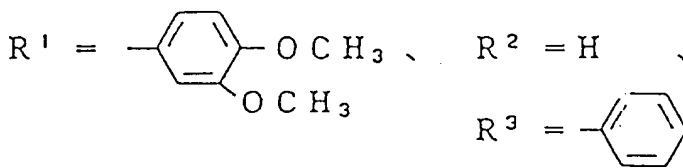
實施例 5 的化合物



結晶形：淡黃色稜狀 (從乙醇中再結晶)

mp : 172 - 173 °C

實施例 6 的化合物



結晶形：淡褐色針狀 (從乙醇中再結晶)

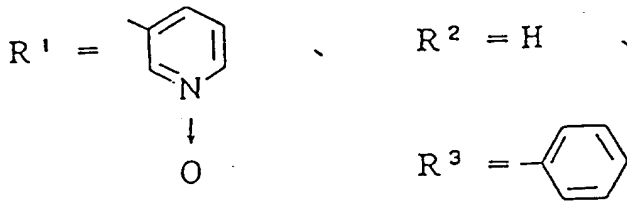
mp : 88 - 89 °C (HCl 鹽)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (17B)

實施例 7 的化合物



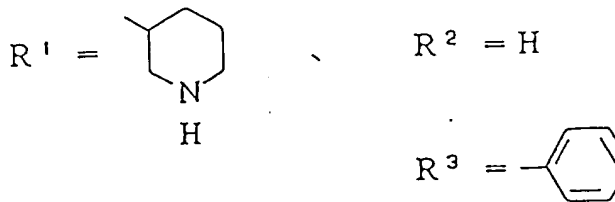
結晶形：褐色粉末狀（從乙酸乙酯中再結晶）。
mp : 140 - 141 °C

實施例 8 的化合物



結晶形：淡黃色板狀（從乙醇中再結晶）
mp : 129 - 130 °C

實施例 9 的化合物



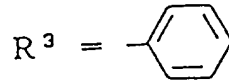
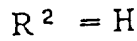
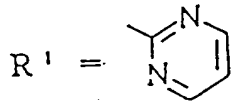
結晶形：無色針狀（從甲醇和乙酸乙酯混液中再結晶）
mp : 188 - 189 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

.....
裝.....訂.....線.....

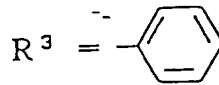
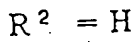
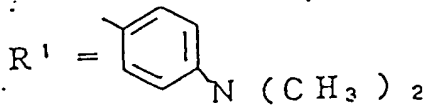
五、發明說明 (17A)

實施例 10 的化合物



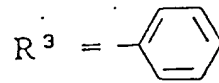
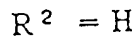
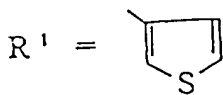
結晶形：淡褐色針狀（從乙酸乙酯中再結晶）
mp : 129 - 130 °C

實施例 11 的化合物



結晶形：淡綠色柱狀（從甲醇中再結晶）
mp : 135 - 136 °C

實施例 12 的化合物



結晶形：無色針狀（從乙醚和正己烷混液中再結晶）
mp : 57.5 - 58.5 °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 (175)

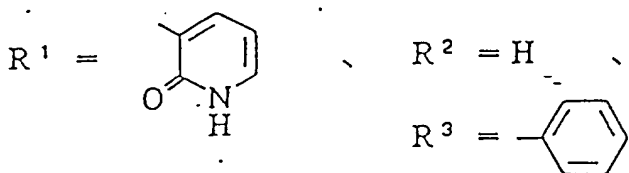
實施例 13 的化合物



結晶形：白色針狀（從乙醚和正己烷混液中再結晶）

mp : 91.5 - 92°C

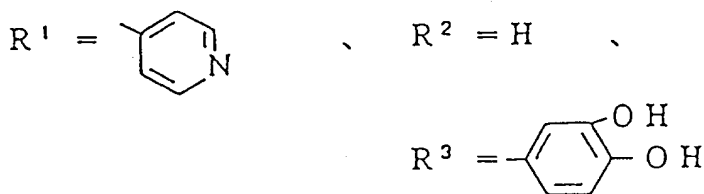
實施例 14 的化合物



結晶形：淡褐色板狀（從甲醇中再結晶）

mp : 206 - 207°C (分解)

實施例 15 的化合物



結晶形：橙色粉末狀（從乙醇水溶液中再結晶）

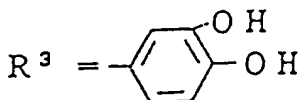
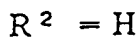
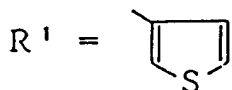
mp : 209 - 210°C (分解、HCl 鹽)

（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)

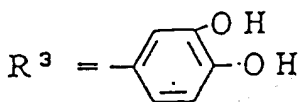
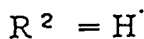
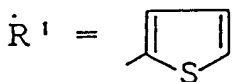
實施例 16 的化合物



結晶形：無色針狀（從乙醚和正己烷混液中再結晶）

mp : 83 - 84 °C

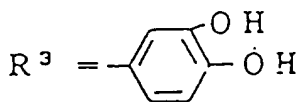
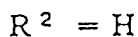
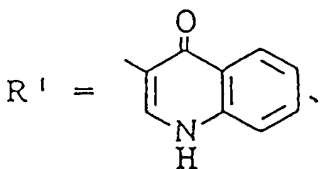
實施例 17 的化合物



結晶形：無色針狀（從乙醚和正己烷混液中再結晶）

mp : 76 - 78 °C

實施例 18 的化合物



結晶形：褐色粉末狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）

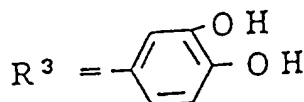
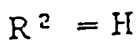
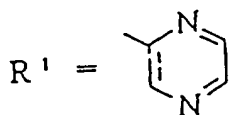
mp : 300 °C 以上

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

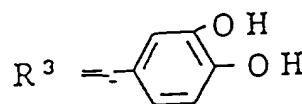
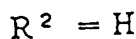
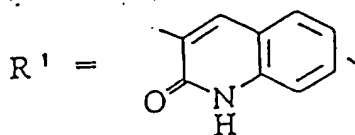
五、發明說明 (177)

實施例 19 的化合物



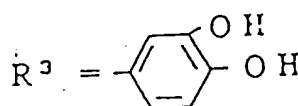
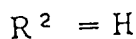
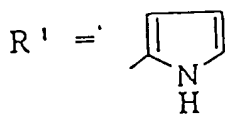
結晶形：黃色粉末狀（從二噁烷水溶液中再結晶）
mp : 280 - 281 °C

實施例 20 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）
mp : 262 - 263 °C

實施例 21 的化合物



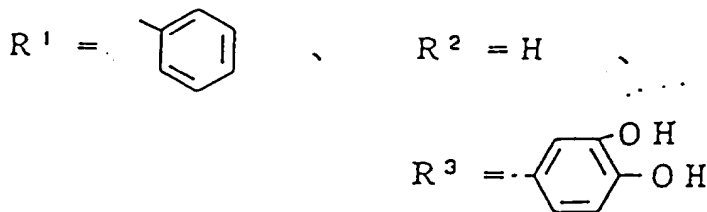
結晶形：淡黃色粉末狀（從乙酸乙酯中再結晶）
mp : 180 - 181 °C (分解)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

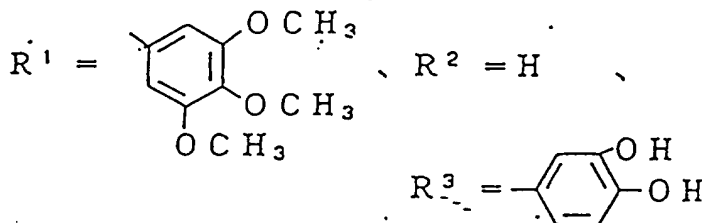
五、發明說明 (178)

實施例 2 2 的化合物



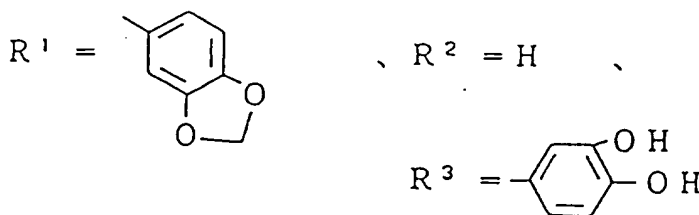
結晶形：黃色稜狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 124 - 126°C (HCl 塩)

實施例 2 3 的化合物



結晶形：黃色針狀 (從乙酸乙酯和乙醚混液中
 より再結晶)
 mp : 128 - 129°C (HCl · 1/2H₂O 塩)

實施例 2 4 的化合物



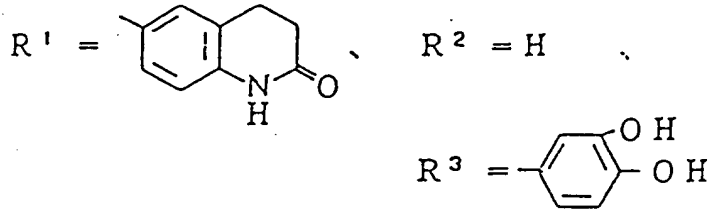
結晶形：淡褐色粉末狀 (從二甲基甲醯胺水溶
 液中再結晶)
 mp : 187 - 188°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

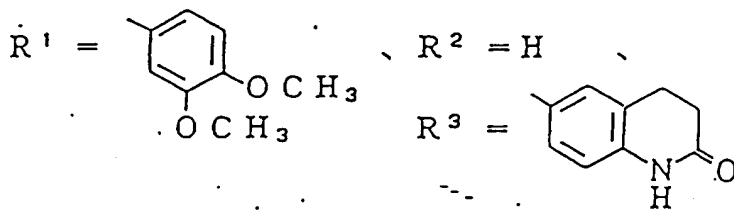
五、發明說明 (179)

實施例 25 的化合物



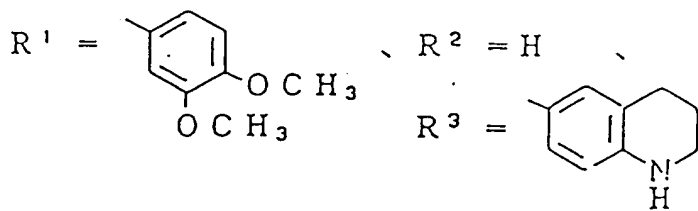
結晶形：黃色粉末狀（從乙醇中再結晶）
 mp：248-249°C (HCl 鹽)

實施例 26 的化合物



結晶形：白色針狀（從乙醇中再結晶）
 mp：205-206°C

實施例 27 的化合物



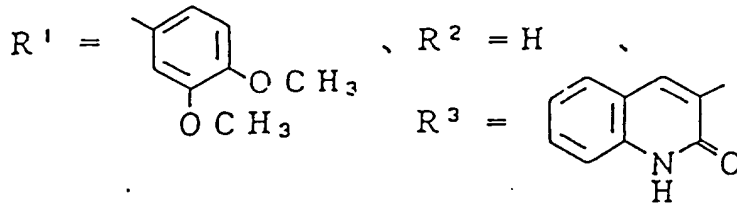
結晶形：淡褐色粉末狀（從乙醇中再結晶）
 mp：156-158°C (HCl 鹽)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (180)

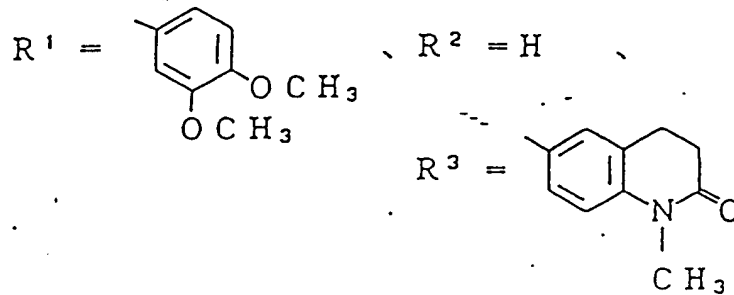
實施例 28 的化合物



結晶形：淡褐色針狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 282 - 284 °C (分解)

實施例 29 的化合物



結晶形：無色針狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

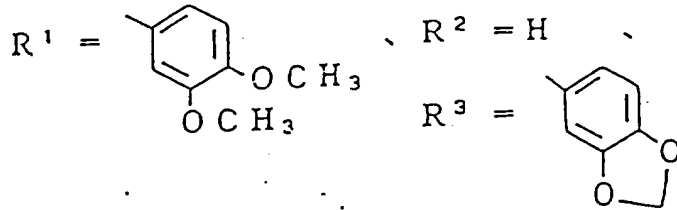
mp : 199 - 200 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

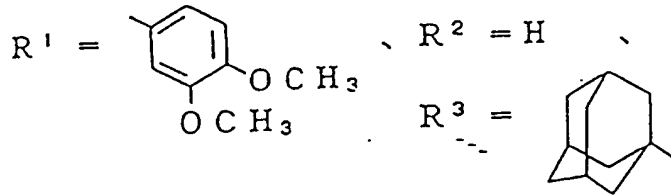
五、發明說明 (18)

實施例 30 的化合物



結晶形：無色稜狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 163-163.5 °C

實施例 31 的化合物



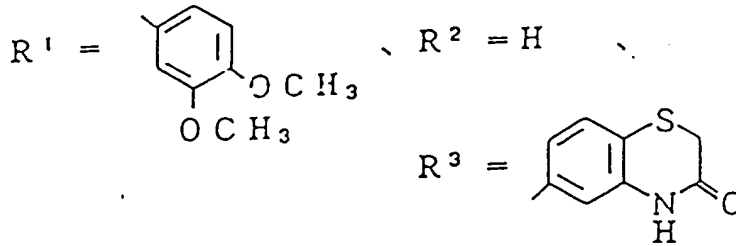
結晶形：淡黃色板狀 (從正己烷中再結晶)
mp : 98-99 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (182)

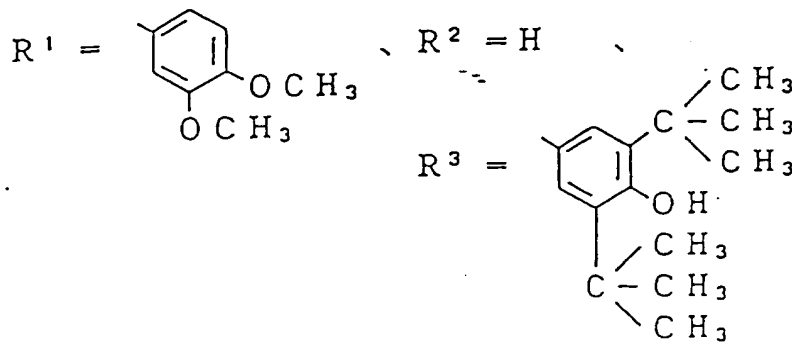
實施例 3 2 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 249 - 250 °C

實施例 3 3 的化合物



結晶形：白色針狀（從乙醇中再結晶）

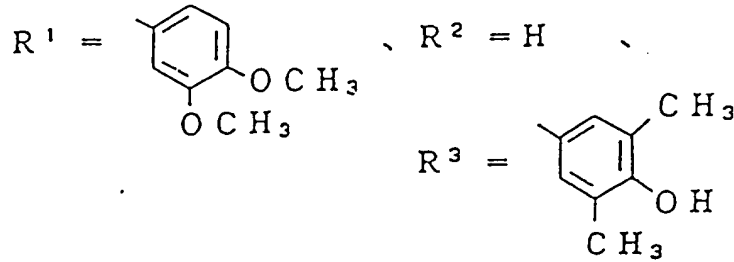
mp : 149 - 150 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

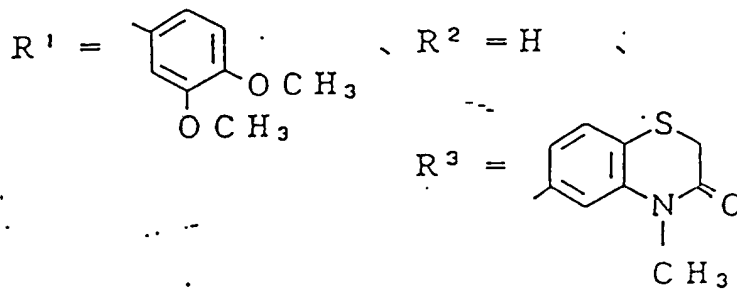
五、發明說明 (18)

實施例 34 的化合物



結晶形：白色針狀（從甲醇中再結晶）
mp：160-161°C

實施例 35 的化合物



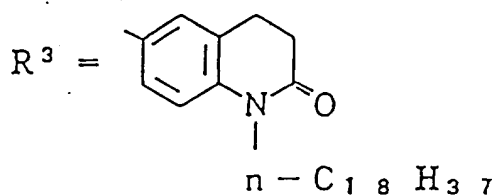
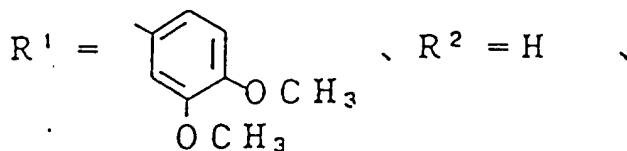
結晶形：淡黃色粉末狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）
mp：143.5-144°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

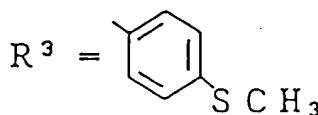
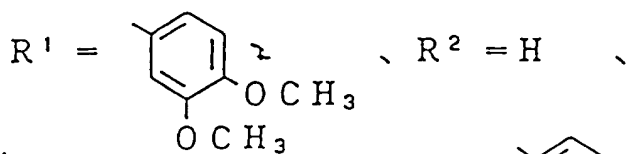
五、發明說明 (184)

實施例 36 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醇中再結晶）
mp : 94-95°C

實施例 37 的化合物



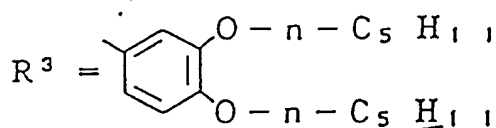
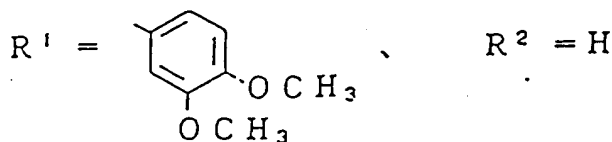
結晶形：淡褐色針狀（從乙醇中再結晶）
mp : 151-152°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

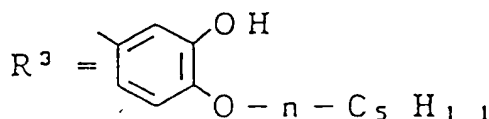
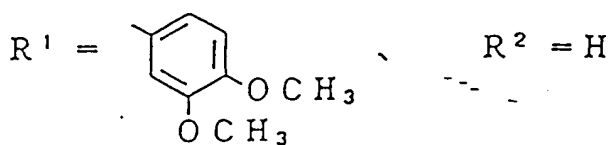
五、發明說明 (185)

實施例 38 的化合物



結晶形：白色針狀 (從石油醚中再結晶)
mp : 67 - 68 °C

實施例 39 的化合物



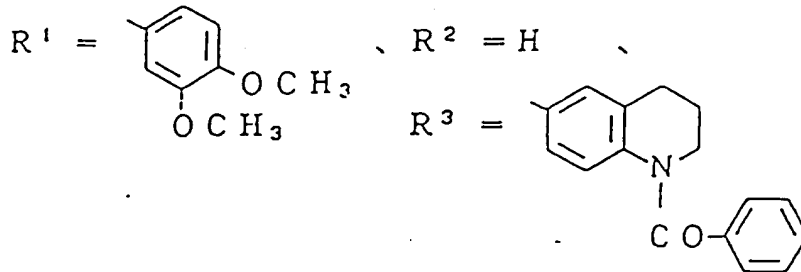
結晶形：白色針狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 122 - 123 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

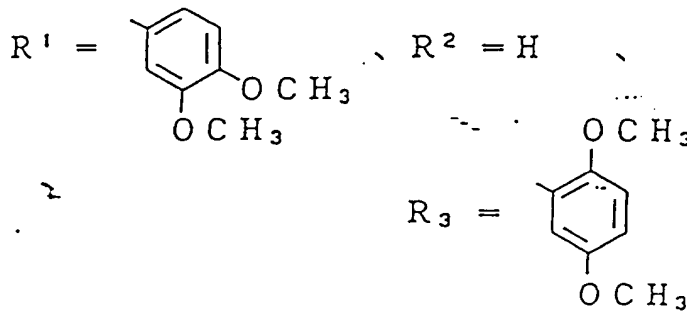
五、發明說明 (186)

實施例 40 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀（從乙醇中再結晶）
 mp : 152.5 - 153.5 °C

實施例 41 的化合物



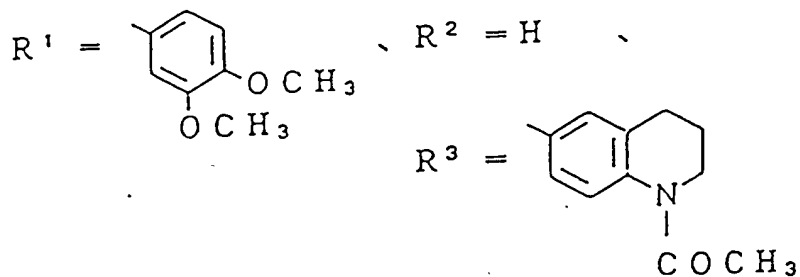
結晶形：淡黃色稜狀（從乙醇水溶液中再結晶）
 mp : 83 - 84 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

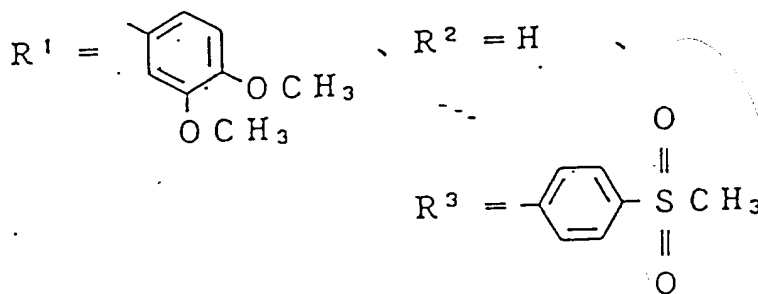
五、發明說明 (188)

實施例 4 4 的化合物



結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 147.5 - 148.5 °C

實施例 4 5 的化合物



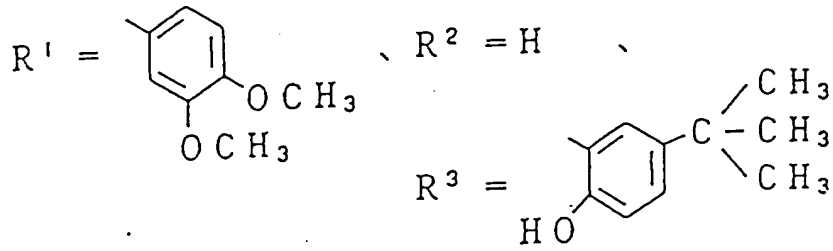
結晶形：淡黃色針狀 (從甲醇中再結晶)
 mp : 151 - 152 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (189)

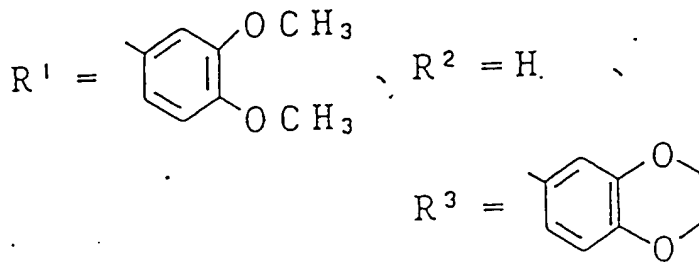
實施例 4 6 的化合物



結晶形：無色板狀（從乙醚和石油醚混液中再結晶）

mp : 150 - 152 °C

實施例 4 7 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶）

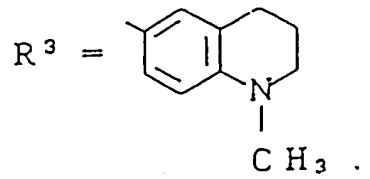
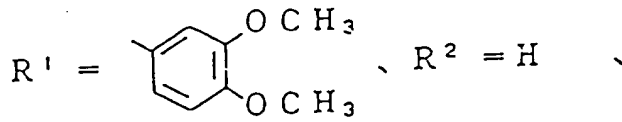
mp : 126 - 127 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (190)

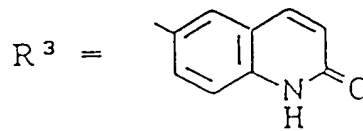
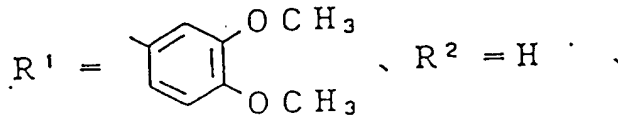
實施例 4 8 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從乙醇和乙醚混液中再結晶）

mp : 124 - 126 °C (HCl 鹽)

實施例 4 9 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從二甲基甲酰胺中再結晶）

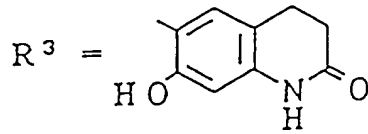
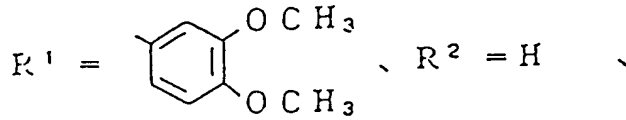
mp : 263 - 265 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

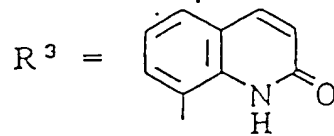
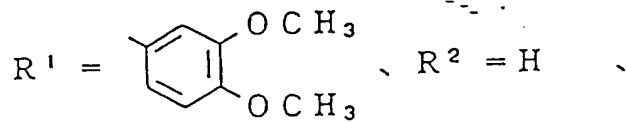
五、發明說明 (19)

實施例 50 的化合物



結晶形：無色稜狀 (從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶)
mp : 249 - 250°C (分解)

實施例 51 的化合物



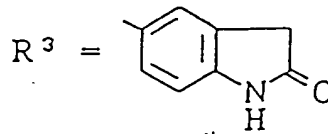
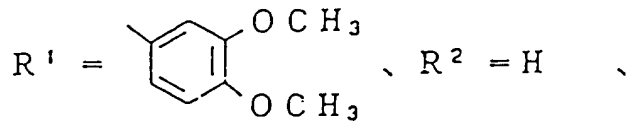
結晶形：淡褐色稜狀 (從二甲基甲醯胺中より再結晶)
mp : 225 - 226°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (192)

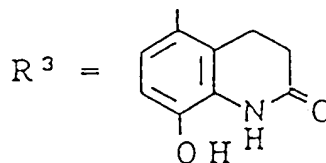
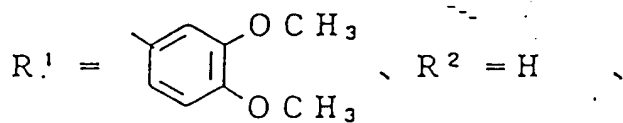
實施例 5 2 的化合物



結晶形：淡褐色針狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 250 - 251 °C

實施例 5 3 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

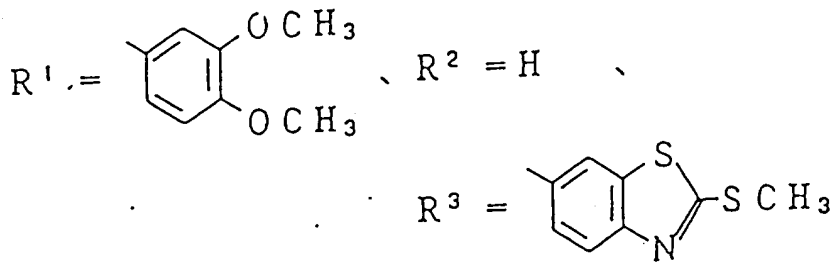
mp : 145 - 146 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (19B)

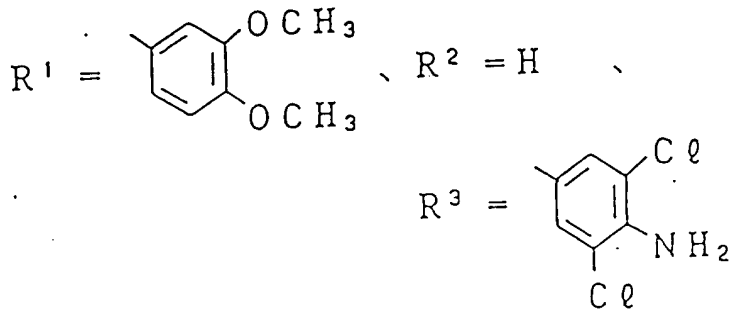
實施例 5 4 的化合物



結晶形：淡褐色針狀 (從二甲基甲醯胺和甲醇混液中再結晶)

mp : 182 - 183°C

實施例 5 5 的化合物



結晶形：淡褐色稜狀 (從二甲基甲醯胺和甲醇混液中再結晶)

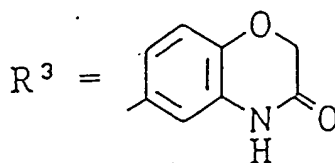
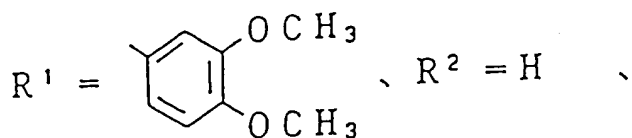
mp : 184 - 185°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

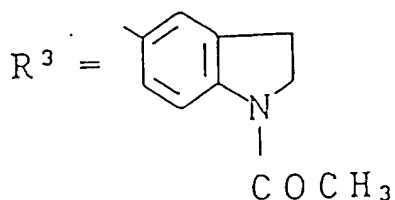
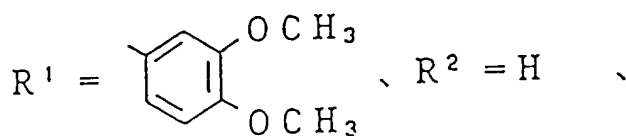
五、發明說明 (19)

實施例 5 6 的化合物



結晶形：白色稜狀 (從二噁烷中再結晶)
mp : 233 - 234 °C

實施例 5 7 的化合物



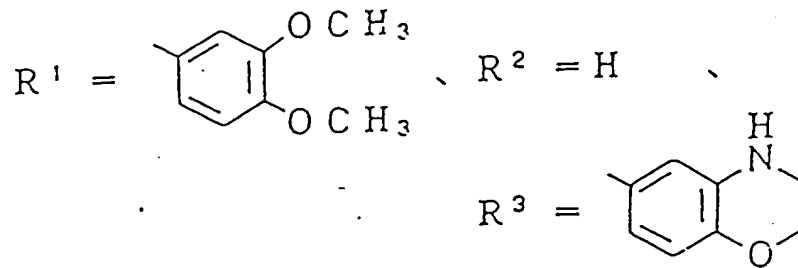
結晶形：淡褐色粒狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 178 - 179 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

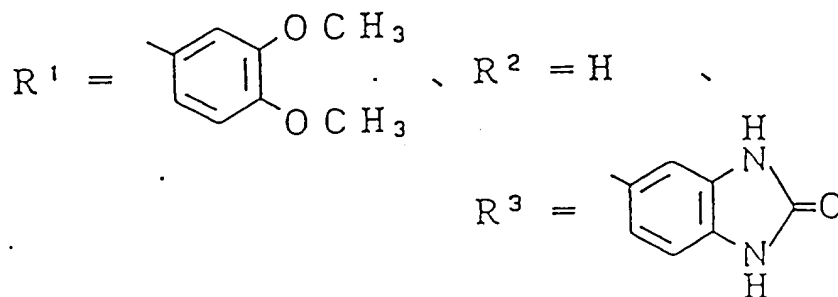
五、發明說明 (195)

實施例 58 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從乙醇水溶液中再結晶）
 mp：159-161°C (HCl 鹽)

實施例 59 的化合物



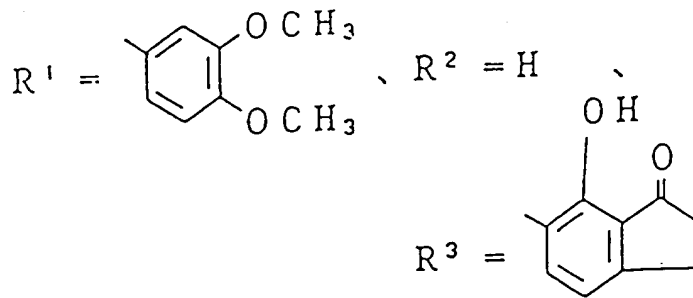
結晶形：白色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）
 mp：300°C 以上

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (196)

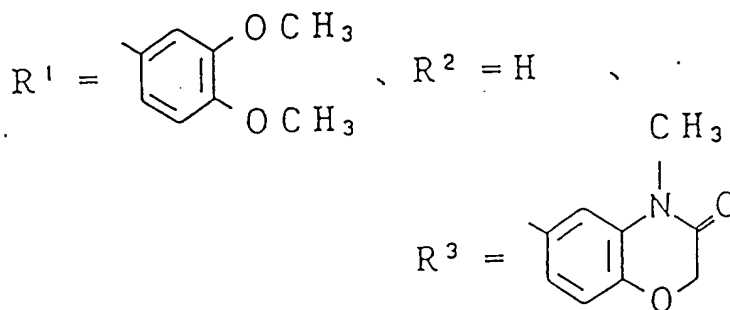
實施例 60 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 215 - 216 °C

實施例 61 的化合物



結晶形：無色針狀（從乙腈中再結晶）

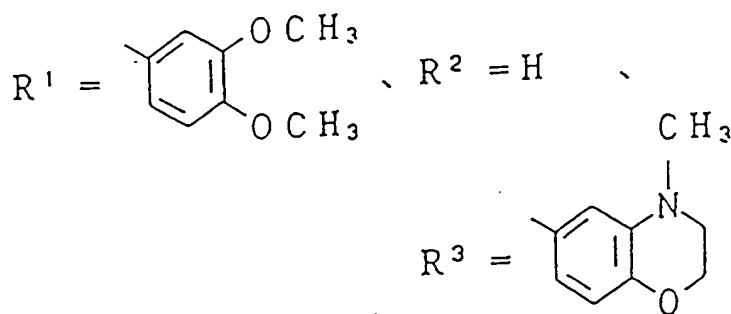
mp : 156 - 157 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

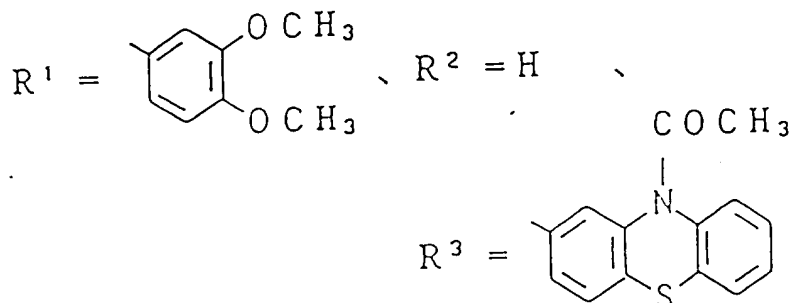
五、發明說明 (197)

實施例 6 2 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 128-130°C (HCl 塩)

實施例 6 3 的化合物



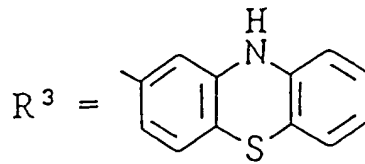
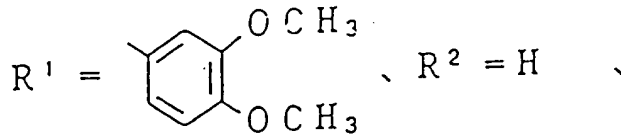
結晶形：無色針狀(從乙酸乙酯中再結晶)
 mp : 155-156°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (19B)

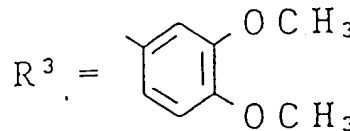
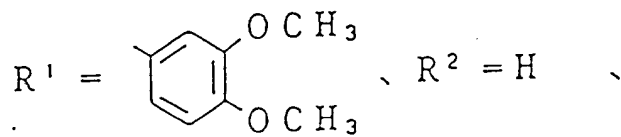
實施例 6 4 的化合物



結晶形：淡黃色針狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）

mp : 206 - 208 °C

實施例 6 5 的化合物



結晶形：淡褐色針狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

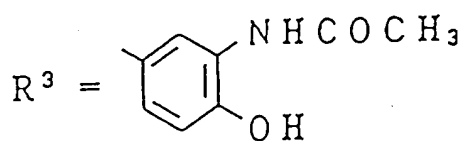
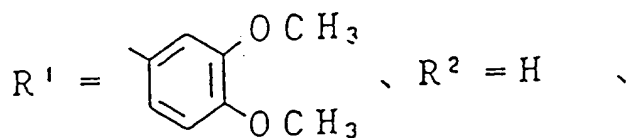
mp : 168 - 169 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

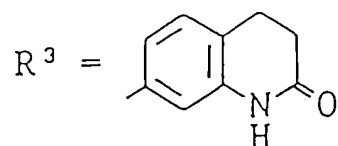
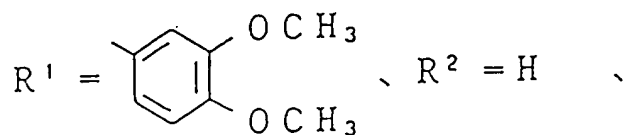
五、發明說明 (199)

實施例 6 6 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醇中再結晶）
mp：191-192°C

實施例 6 7 的化合物



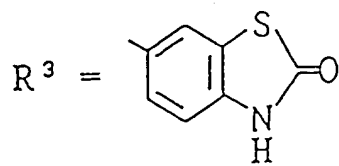
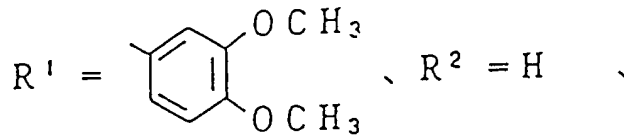
結晶形：白色粉末狀（從二甲基甲醯胺和
甲醇混液中再結晶）
mp：226-227°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (20)

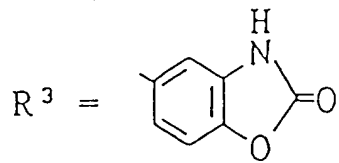
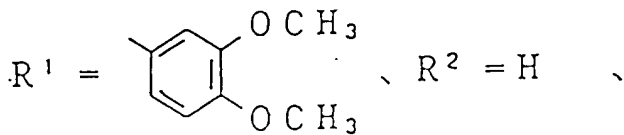
實施例 68 的化合物



結晶形：淡褐色針狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）

mp : 227 - 228 °C

實施例 69 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從甲醇中再結晶）

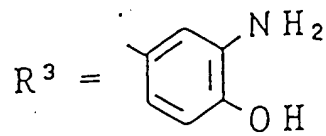
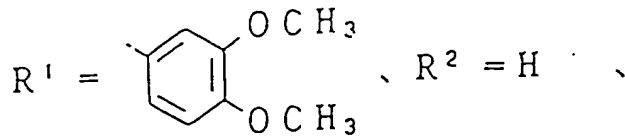
mp : 271 - 272 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

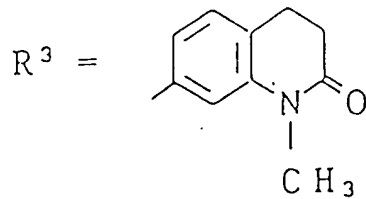
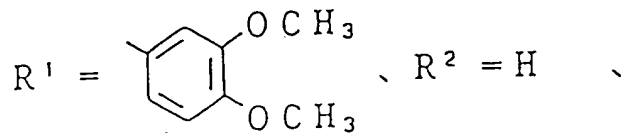
五、發明說明 (20)

實施例 70 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從甲醇中再結晶）
mp : 165-167°C (分解、2HCl·塩)

實施例 71 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醚和石油醚混液中再結晶）

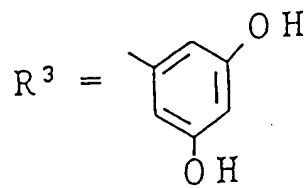
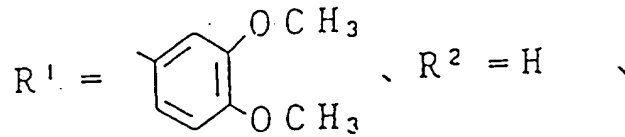
mp : 114-115°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (202)

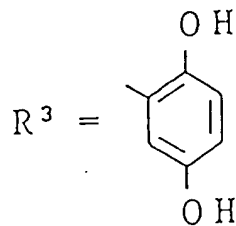
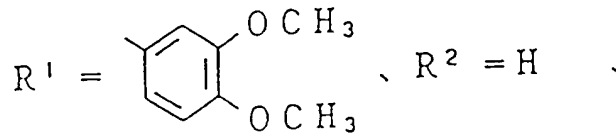
實施例 7 2 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醇和正己烷混液中再結晶）

mp : 229 - 230 °C

實施例 7 3 的化合物



結晶形：橙色板狀（從乙醇中再結晶）

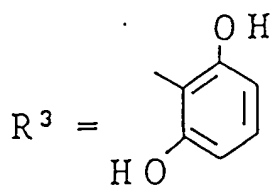
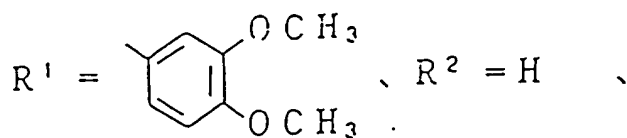
mp : 192 - 192.5 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (20B)

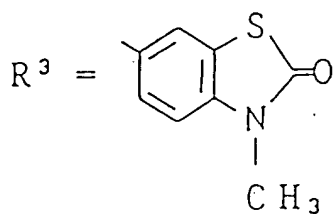
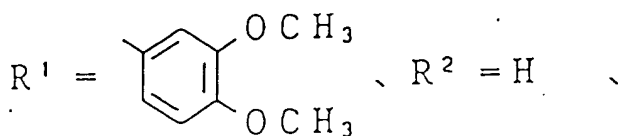
實施例 7 4 的化合物



結晶形：淡黃色稜狀 (從乙醇和正己烷混液中再結晶)

mp : 196 - 197 °C

實施例 7 5 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀 (從二甲基甲醯胺中再結晶)

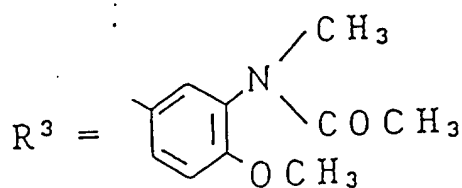
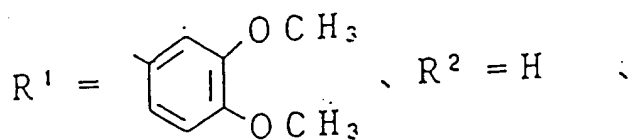
mp : 203 - 204 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

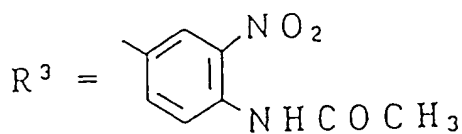
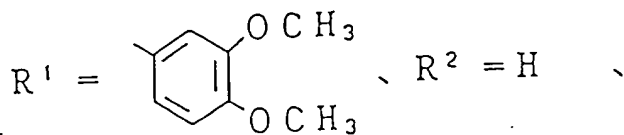
五、發明說明 (204)

實施例 7 6 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醚中再結晶)
mp : 111 - 112°C

實施例 7 7 的化合物



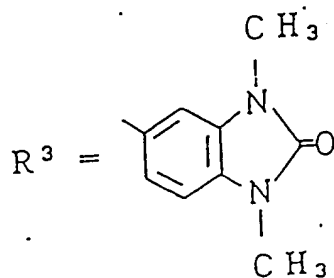
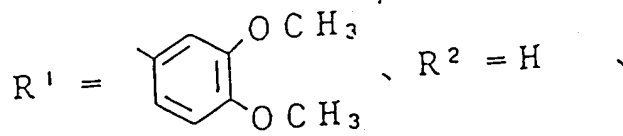
結晶形：黃色針狀 (從乙腈中再結晶)
mp : 219 - 220.5°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

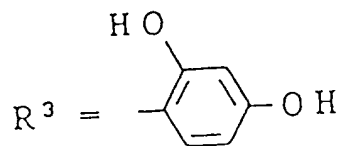
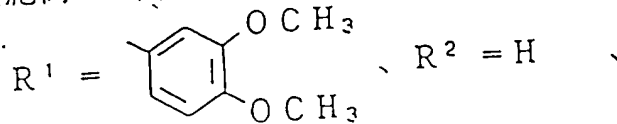
五、發明說明 (205)

實施例 78 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀 (從乙腈中再結晶)
mp : 172.5 - 173.5 °C

實施例 79 的化合物



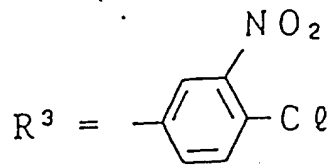
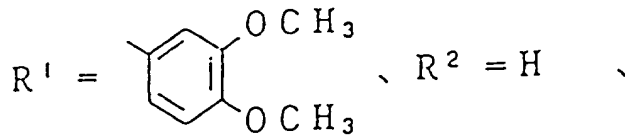
結晶形：淡黃色粉末狀 (從乙醇和正己烷混液中再結晶)
mp : 203 - 204 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

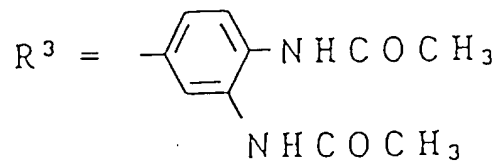
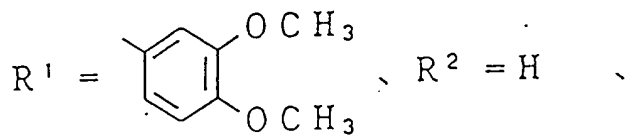
五、發明說明 (205)

實施例 80 的化合物



結晶形：黃色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 177 - 178°C

實施例 81 的化合物



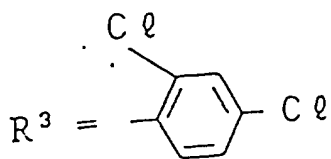
結晶形：淡黃色粉末狀 (從乙腈中再結晶)
mp : 224 - 225°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

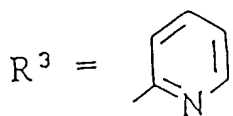
五、發明說明 (207)

實施例 8 2 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙醇水溶液中再結晶)
mp : 125 - 126 °C

實施例 8 3 的化合物



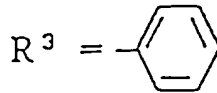
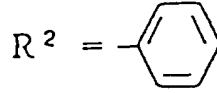
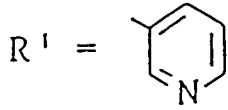
結晶形：黃色稜狀 (從乙酸乙酯和正己烷
混液中再結晶)
mp : 147 - 148 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

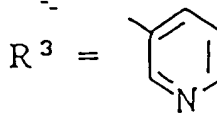
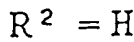
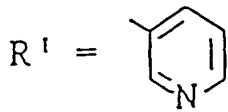
五、發明說明 (208)

實施例 8 4 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀（從異丙醇中再結晶）
mp：202-204°C (HBr 鹽)

實施例 8 5 的化合物



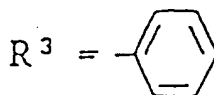
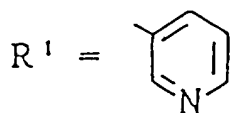
結晶形：褐色板狀（從乙酸乙酯中再結晶）
mp：131-132°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

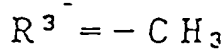
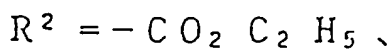
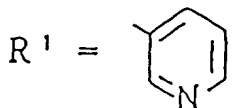
五、發明說明 (209)

實施例 86 的化合物



結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 147 - 149°C

實施例 87 的化合物



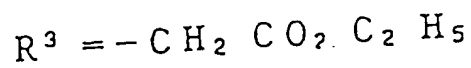
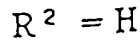
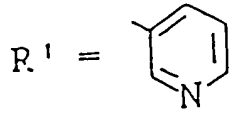
結晶形：白色粉末狀 (從乙醇水溶液中再結晶)
mp : 147 - 148°C (HCl 鹽)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (210)

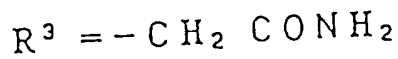
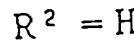
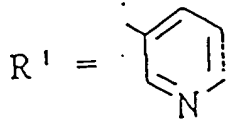
實施例 88 的化合物



結晶形：白色稜狀 (從乙醇中再結晶)

mp : 119-120°C (HCl 鹽)

實施例 89 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)

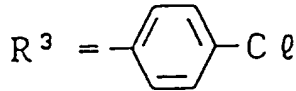
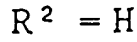
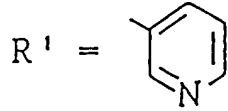
mp : 198-200°C (分解, HCl 鹽)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

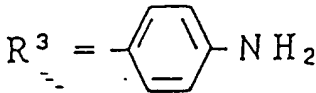
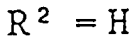
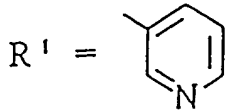
五、發明說明 (21)

實施例 90 的化合物



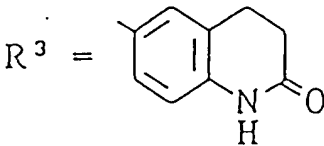
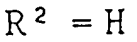
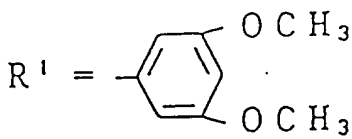
結晶形：白色粉末狀（從乙醇水溶液中再結晶）
mp : 118-119°C

實施例 91 的化合物



結晶形：黃色柱狀（從乙醇中再結晶）
mp : 176-177°C

實施例 92 的化合物



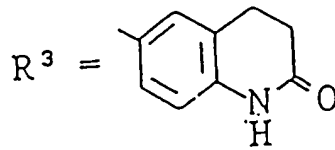
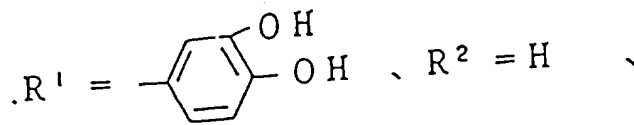
結晶形：淡褐色針狀（從乙醇中再結晶）
mp : 184-185°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

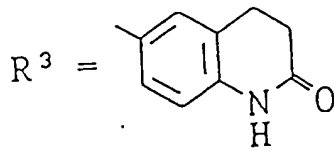
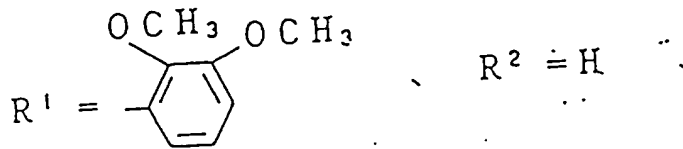
五、發明說明 (212)

實施例 9 3 的化合物



結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 255 - 258 °C (分解、HBr 塩)

實施例 9 4 的化合物



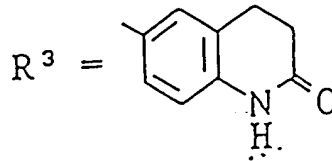
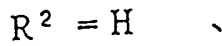
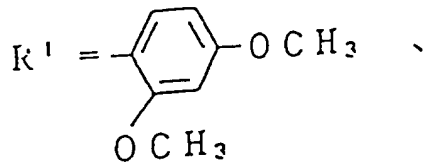
結晶形：淡褐色針狀 (從二甲基甲醯胺中再結晶)
mp : 235 - 236 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (21B)

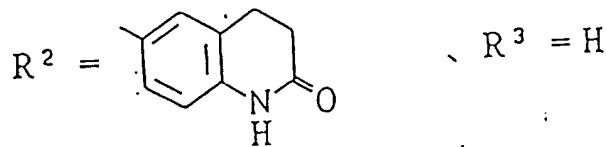
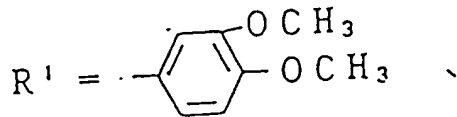
實施例 9 5 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 236 - 237°C

實施例 9 6 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從甲醇中再結晶）

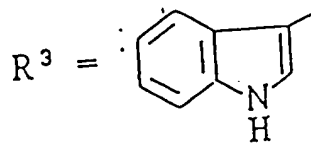
mp : 235 - 236°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

.....裝.....訂.....線.....

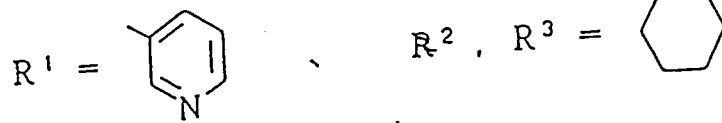
五、發明說明 (21A)

實施例 97 的化合物



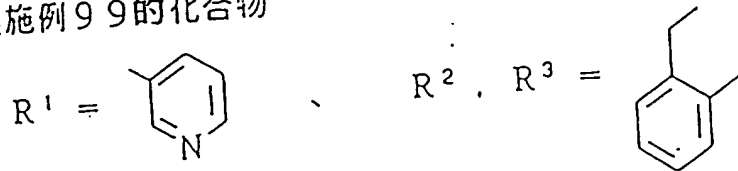
結晶形：無色稜狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 198-199°C

實施例 98 的化合物



結晶形：淡褐色稜狀 (從乙醇和乙醚混液中再結晶)
mp : 148-149°C (HCl 塩)

實施例 99 的化合物



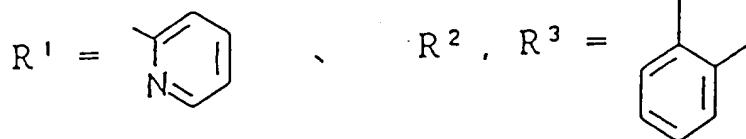
結晶形：黃色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 226-228°C (HBr 塩)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

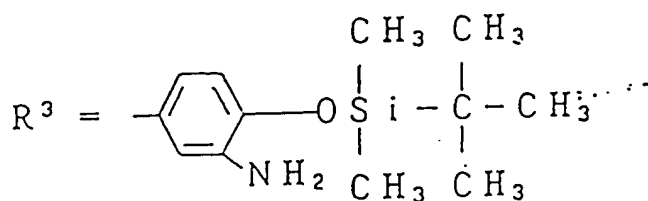
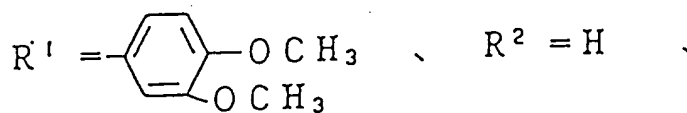
五、發明說明 (215)

實施例 100 的化合物



結晶形：暗綠色針狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 154 - 155°C (HBr 鹽)

實施例 101 的化合物



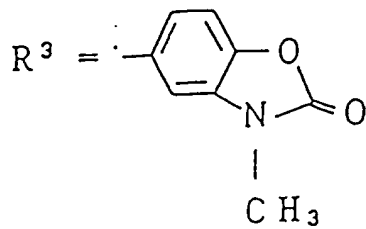
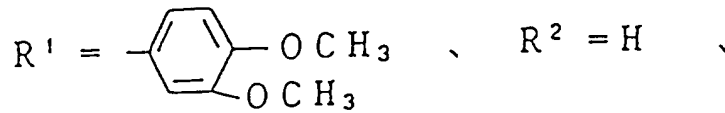
結晶形：淡褐色針狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 128 - 129°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

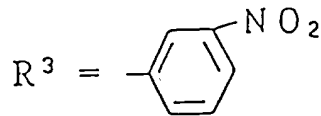
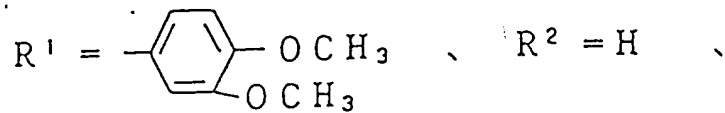
五、發明說明 (216)

實施例 102 的化合物



·結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 170 - 171 °C

實施例 103 的化合物



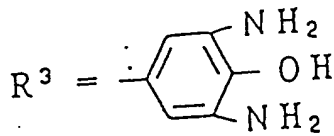
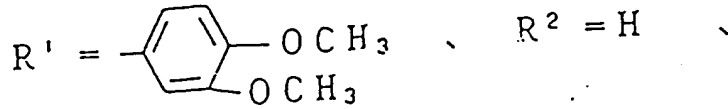
結晶形：黃色針狀 (從氯仿和乙醇混液中再結晶)
mp : 149 - 150 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

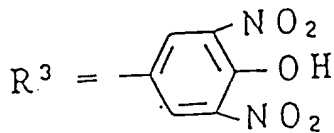
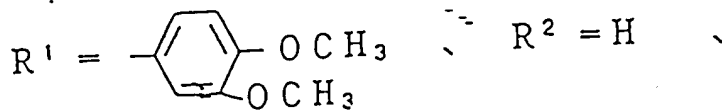
五、發明說明 (217)

實施例 104 的化合物



結晶形：淡紫色板狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 167-169°C (分解)

實施例 105 的化合物



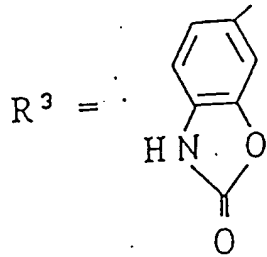
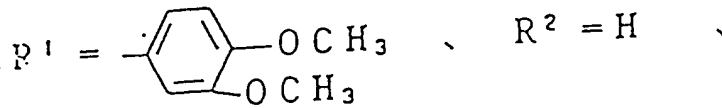
結晶形：赤色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 184-186°C (分解)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

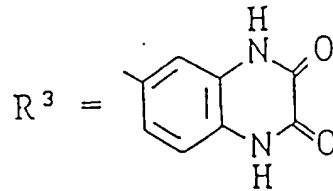
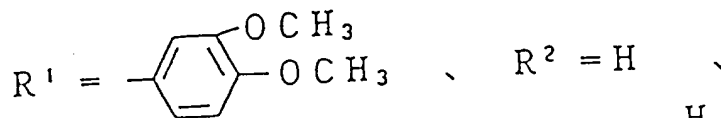
五、發明說明 (21B)

實施例 106 的化合物



結晶形：褐色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 221-224°C

實施例 107 的化合物



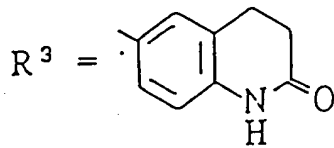
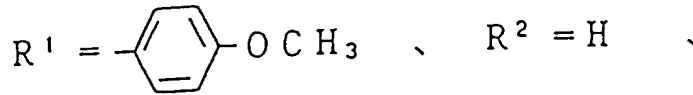
NMR (DMSO-d₆) δ :
10.5 (2H, brs) 、 8.18 (1H, d, J=1.7Hz) 、
8.09 (1H, s) 、 7.96 (1H, dd, J=8.5Hz, 1.7Hz) 、
7.71 (1H, d, J=8.5Hz) 、 7.5-7.65 (2H, m) 、
7.09 (1H, d, J=8.4Hz) 、 3.86 (3H, s) 、
3.83 (3H, s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

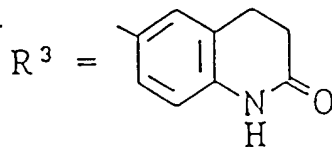
五、發明說明 (21b)

實施例 108 的化合物



結晶形：無色稜狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 216 - 217 °C

實施例 109 的化合物



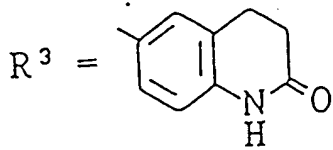
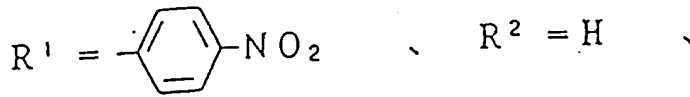
結晶形：淡黃色稜狀 (從二甲基甲醯胺中再結晶)
mp : 263 - 264 °C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

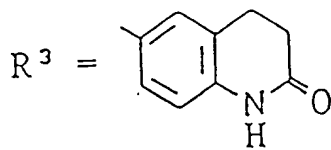
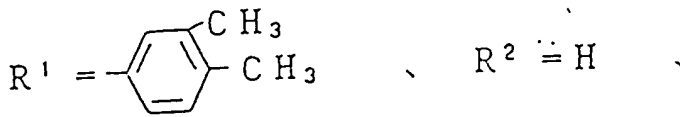
五、發明說明 (220)

實施例 110 的化合物



結晶形：橙色針狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）
mp：300°C以上

實施例 111 的化合物



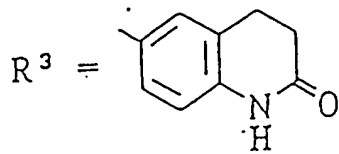
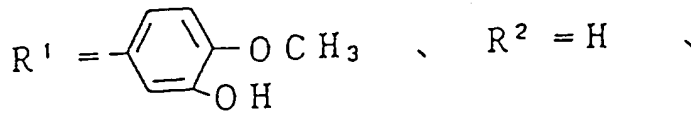
結晶形：淡黃色板狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）
mp：231-232°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

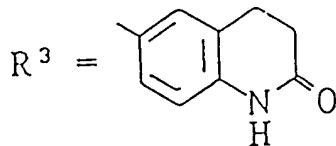
五、發明說明 (22)

實施例 1 1 2 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從二噁烷中再結晶）
mp : 272.5 - 273.5°C

實施例 1 1 3 的化合物



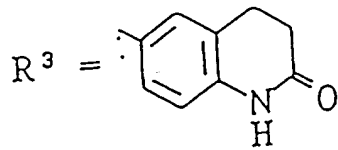
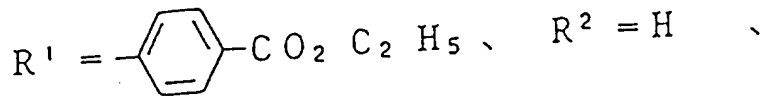
結晶形：淡黃色稜狀（從二噁烷中再結晶）
mp : 242 - 243°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

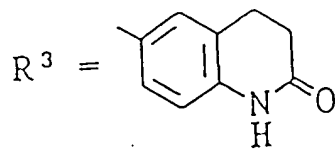
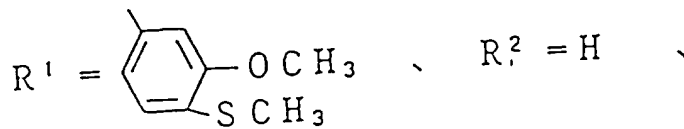
五、發明說明 (22)

實施例 1 1 4 的化合物



結晶形：淡黃色針狀（從二噁烷中再結晶）
m p : 236 - 237 °C

實施例 1 1 5 的化合物



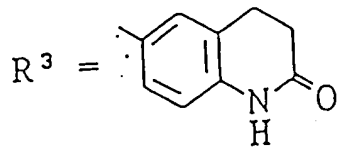
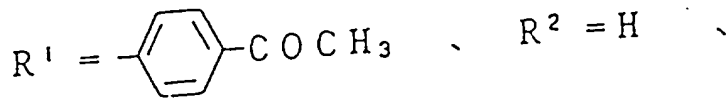
結晶形：淡褐色稜狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）
m p : 255 - 256 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (22B)

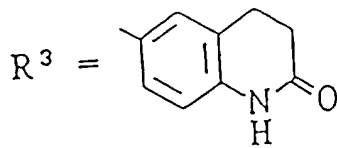
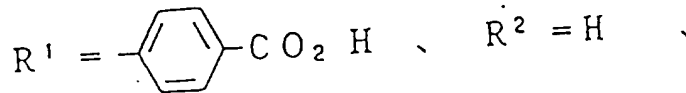
實施例 116 的化合物



結晶形：淡黃色柱狀 (從二甲基甲醯胺中
再結晶)

mp : 264.5 - 265°C

實施例 117 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀 (從二甲基甲醯胺中
再結晶)

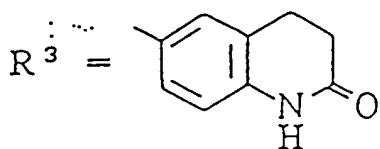
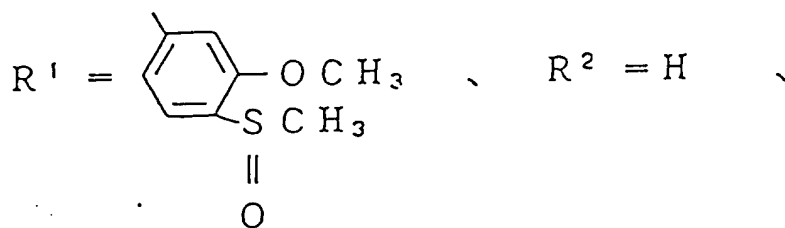
mp : 300°C 以上

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (224)

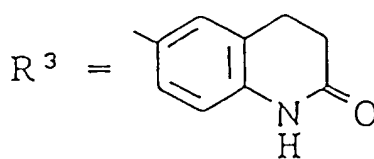
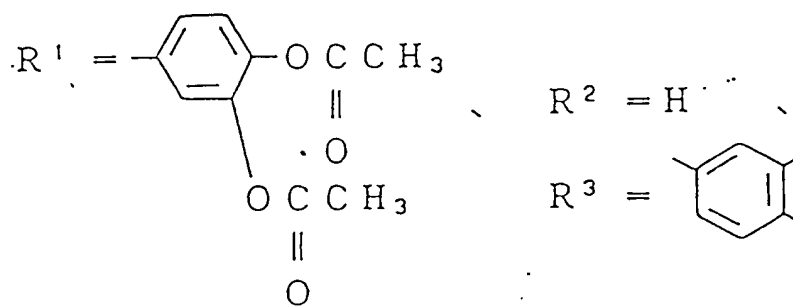
實施例 118 的化合物



結晶形：淡黃色針狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 264 - 265 °C

實施例 119 的化合物



結晶形：無色針狀（從乙腈中再結晶）

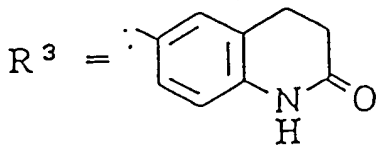
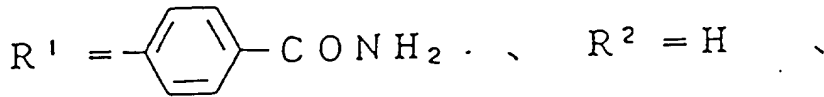
mp : 209 - 210 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (225)

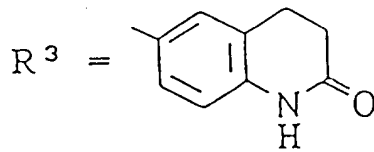
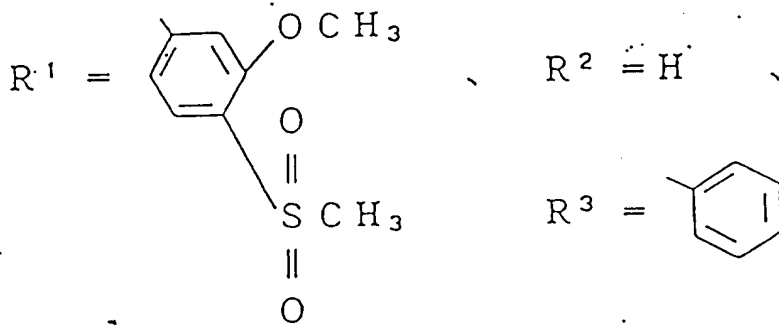
實施例 1 2 0 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 300°C 以上

實施例 1 2 1 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）

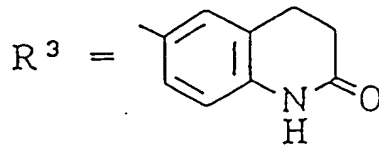
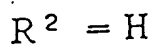
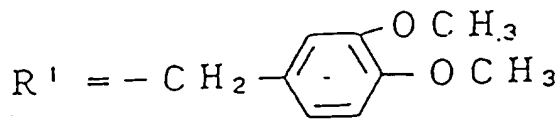
mp : 284 - 286°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 . . . 訂 . . . 線 . . .

五、發明說明 (228)

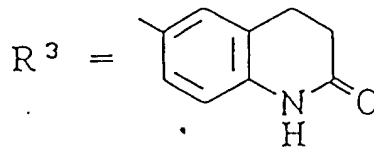
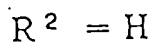
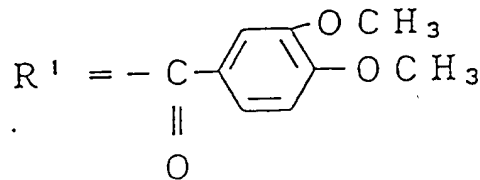
實施例 1 2 6 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 185 - 186 °C (HCl 鹽)

實施例 1 2 7 的化合物



結晶形：淡褐色針狀（從氯仿和乙醇混液中再結晶）

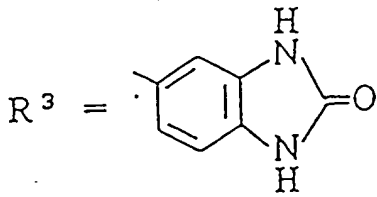
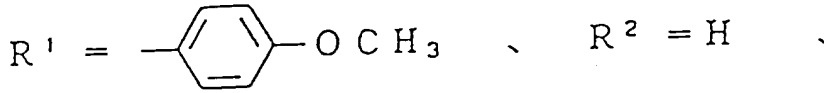
mp : 249 - 251 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (229)

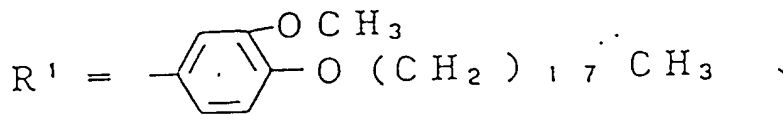
實施例 130 的化合物



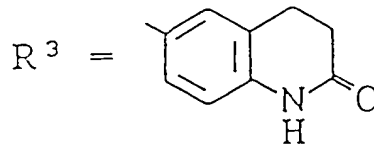
結晶形：白色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 300°C 以上

實施例 131 的化合物



$R^2 = H$ 、



結晶形：白色粉末狀（從乙醇中再結晶）

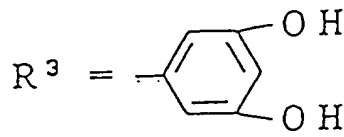
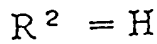
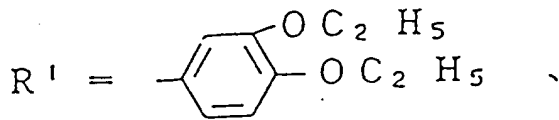
mp : 127-128°C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (230)

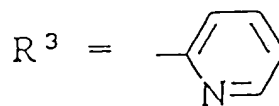
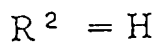
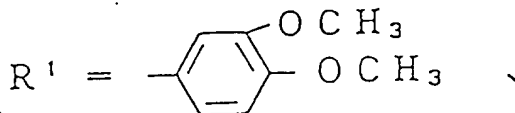
實施例 1 3 2 的化合物



結晶形：無色柱狀（從石油醚和乙醚混液中再結晶）

mp : 141 - 142 °C

實施例 1 3 3 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀（從乙醇中再結晶）

mp : 157 - 167 °C (分解、HCl 鹽)

NMR (CDCl₃) δ :

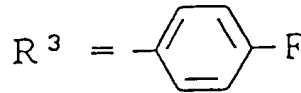
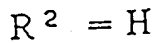
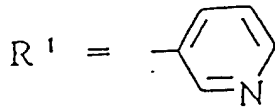
3.80 (3H, s) 、 3.87 (3H, s) 、 7.06 (1H, d, J=8.5Hz) 、 7.56 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.5Hz) 、 7.65-7.82 (2H, m) 、 8.31 (1H, t, J=6.7Hz) 、 8.46 (1H, d, J=7.9Hz) 、 8.65-8.82 (2H, m)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

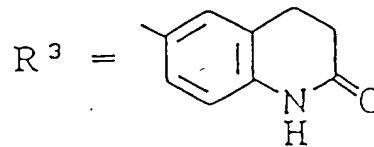
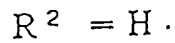
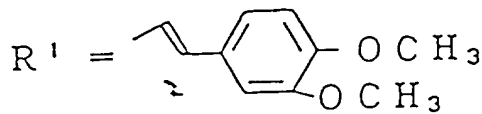
五、發明說明 (231)

實施例 134 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀（從甲醇中再結晶）
mp : 270 - 271 °C (分解、1/3 FeCl₂ 鹽)

實施例 135 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）

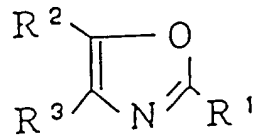
mp : 182 - 183 °C

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

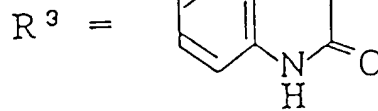
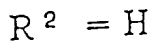
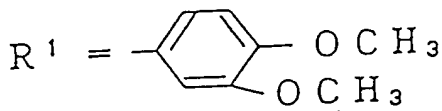
裝
訂
線

五、發明說明 (232)

第 9 表



實施例 136 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從乙醇中再結晶）
m.p : 191 - 192°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 (233)

實施例 137

溶解 6 - [2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯甲醯氧基) 乙醯基] - 3 , 4 - 二氫脛基喹啉 (2 g) 於乙酸 (25 ml) 中，再加入乙酸鉍 (2 g) ，於 130 °C 下加熱攪拌 3 小時。蒸餾去除溶劑，溶解殘渣於乙醇中，經活性碳處理後由乙醇中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 , 4 - 二氫脛基喹啉 - 6 - 基) 喹啉的淡褐色針狀結晶 120 mg 。

熔點：191 ~ 192 °C 。

實施例 138

6 - [2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯甲醯胺基) 乙醯基] - 3 , 4 - 二氫脛基喹啉 (500 mg) 和 2 , 4 - 雙 (4 - 甲氧基苯基) - 1 , 3 - 二噁基 - 2 , 4 - 二磷酸鹽 - 2 , 4 - 二硫化物 (勞遜氏試劑) 以粉狀混合後在 200 °C 下加熱攪拌之。3 小時後結束反應。殘渣施以矽膠管柱層析 (二氯甲烷 : 甲醇 = 49 : 1 V / V) ，從溶出部分所得固形物經乙醇再結晶處理而得 2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基) - 5 - (3 , 4 - 二氫脛基喹啉 - 6 - 基) 噁啉的白色粉末 98 mg 。

熔點：235 ~ 236 °C

按本實施例 (實施例 138) 相同方法，利用適當原料化合物，可製得前述實施例 1 ~ 95 ，實施例 97 ~ 135 的各種化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (234)

實施例 1 3 9

溶解 - 2 - (吡啶 - 3 - 基) - 4 - 苯基噻唑 (1 g) 於二氯甲烷 (50 ml) 中，然後在室溫下加入間氯過苯甲酸 (900 mg)，並在室溫下攪拌 2 小時。反應溶液以碳酸氫鈉水溶液洗淨後乾燥之。蒸餾去除溶劑所得殘渣由乙酸乙酯中再結晶而得 3 - (4 - 苯基噻唑 - 2 - 基) 吡啶 - N - 氧化物的褐色粉末 306 mg。

熔點：140 ~ 141 °C。

實施例 1 4 0

溶解 3 - (4 - 苯基噻唑 - 2 - 基) 吡啶 - N - 氧化物 (2.8 g) 於乙醚 (25 ml) 中，加熱還流 6 小時。蒸餾去除溶劑所得殘渣用氨水處理後以二氯甲烷萃取之。水洗，乾燥，餾除溶劑後所得殘渣中加入少量的二氯甲烷，濾取所析出結晶。由甲醇中再結晶而得 2 - (2 - 氧基吡啶 - 3 - 基) - 4 - 苯基噻唑的淡褐色板狀結晶 60 mg。

熔點：206 ~ 207 °C (分解)。

實施例 1 4 1

懸濁氫化鋁鋰 (103 mg) 於四氫呋喃 (50 ml) 中，將 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑 (1 g) 分量慢慢加入，在 90 °C 下加熱攪拌 3 小時。繼之在冷卻下加入水 (

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (235)

0.3 ml)，攪拌後過濾，所得殘渣物以二氯甲烷萃取，水洗，乾燥並蒸餾去除溶劑。殘渣用活性碳處理後，以鹽酸酸性甲醇製成鹽酸鹽後，從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉 - 6 - 基) 噻唑鹽酸鹽的淡褐色粉末 (465 mg)。

熔點：156 ~ 158 °C

實施例 142

懸濁 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑 (500 mg) 於乙酸 (4 ml)，溴氫酸 (2 ml) 中，加熱還流 6 小時。冷卻後濾取析出的結晶並乾燥之。由乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二羥基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑的黃色粉末 67 mg。

熔點：255 ~ 258 °C (分解)。

實施例 143

溶解 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫 - 2H - 1, 4 - 苯駢噻吡 - 3 (4H) 酮 - 6 - 基) 噻唑 (0.57 g) 於二甲基甲醯胺 (20 ml) 中，冰冷下加入 60% 氫化鈉 (0.065 g) 後攪拌 30 分鐘。加入甲基碘 (0.18 ml) 後在 0 °C ~ 室溫下攪拌一夜。濃縮溶液，加水並濾取所析出結晶，水洗，乾燥

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (236)

之。從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (4 - 甲基 - 2 H - 1, 4 - 苯駢噁吡 - 3 (4 H) - 酮 - 6 - 基) 噻啞的淡黃色粉末 0.32 g。

熔點：143.5 ~ 144 °C

按照本實施例 143 相同方法，利用適當原料化合物，可製得前述實施例 11, 29, 36, 42, 48, 61, 62, 71, 75, 78, 102, 123 的各種化合物。

實施例 144

溶解 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (1, 2, 3, 4 - 四氫噁啉 - 6 - 基) 噻啞 (1 g) 於吡啶 (10 ml) 中，在 0 °C 下加入苯甲醯氯 (0.44 g) 並攪拌 5 小時。濃縮溶液，加入乙醇，再加水濾取所析出結晶，從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (1 - 苯甲醯 - 1, 2, 3, 4 - 四氫噁啉 - 6 - 基) 噻啞的淡黃色粉末 (0.7 g)。

熔點：152.5 ~ 153.5 °C

實施例 145

懸濁 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 - 胺基 - 4 - 羥基苯基) 噻啞 (300 mg) 於四氫呋喃 (20 ml) 中，在室溫下加入三乙胺 (0.46 ml)，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (237)

同溫下攪拌 30 分鐘。然後導入光氣 (100 mg) 並攪拌 2 小時。蒸餾去除溶劑以二乙醚洗淨後濾取結晶。再從甲醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (苯駢喹啉 - 2 - 酮 - 5 - 基) 喹啉的白色粉末 (50 mg)。

熔點：271 ~ 272 °C。

實施例 146

溶解 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉 - 6 - 基) 喹啉 (1 g) 於乙醚 (10 ml) 和吡啶 (10 ml) 中，並在室溫下攪拌一夜。反應溶液經濃縮加水，濾取所析出結晶，水洗，並乾燥之。從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (1 - 乙醯基 - 1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉 - 6 - 基) 喹啉的無色針狀結晶 0.31 g。

熔點：147.5 ~ 148.5 °C。

按照本實施例 146 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 57, 63, 66, 76, 77 和 81 的各種化合物。

實施例 147

懸濁 2 - (4 - 乙氧基羰基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 喹啉 (2.05 g) 於 10% 氫氧化鉀水溶液 (20 ml) 和乙醇 (50 ml) 中，還流

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (238)

5 小時。蒸餾去除乙醇，冷卻下加入濃鹽酸成為酸性 (pH 1)，濾取結晶。從二甲基甲醯胺中再結晶而得 2 - (4 - 羧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 喹啉的淡黃色粉末 0.70 g。

熔點：300℃以上

實施例 148

懸濁 2 - (4 - 羧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 喹啉 (0.62 g) 於草醯氨 (20 ml) 中，加熱還流 1 小時。蒸餾去除草醯氨，冰冷下懸濁在丙酮中加入氨水，恢復至室溫後攪拌一夜。加水濾取所析出結晶，水洗，乾燥之。從二甲基甲醯胺中再結晶而得 2 - (4 - 氨基甲醯基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 喹啉的淡黃色粉末 0.29 g。

熔點：300℃以上

實施例 149

懸濁 2 - (3 - 甲氧基 - 4 - 甲基硫苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫羥基喹啉 - 6 - 基) 喹啉 (3.40 g) 於氯仿和乙醇混液 (150 ml) 中，冰冷下，將 80% 間氯過苯甲酸 (1.97 g) 分量慢慢加入並攪拌 1 小時。恢復室溫後攪拌一夜。加入碳酸鈉水溶液，用氯仿萃取 3 次，以飽和食鹽水洗淨之。用硫酸鎂乾燥溶劑後，蒸餾去除溶劑，所得結晶在二甲基甲醯胺中再結晶而得 2 - (3

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (239)

— 甲氧基 — 4 — 甲基亞磺醯基苯基) — 4 — (3, 4 — 二
氫羥基喹啉 — 6 — 基) 喹啉的淡黃色針狀結晶 0.50 g
。

熔點：264 ~ 265 °C

按照本實施例 149 相同方法，利用適當原料化合物
可製得前述實施例 45 的化合物。

實施例 150

懸濁 2 — (3 — 甲氧基 — 4 — 甲基亞磺醯基苯基) —
4 — (3, 4 — 二氫羥基喹啉 — 6 — 基) 喹啉 (2.9 g
) 於氯仿和乙醇的混合液 (100-ml) 中，冷卻下分量
慢慢加入間氯過苯甲酸 (80%，1.72 g) 並攪拌 1
小時後，恢復室溫而攪拌一夜。濾取結晶，用乙醇，乙醚
洗滌，乾燥之。由二甲基甲醯胺水溶液中再結晶而得 2 —
(3 — 甲氧基 — 4 — 甲基磺醯基苯基) — 4 — (3, 4 —
二氫羥基喹啉 — 6 — 基) 喹啉的白色粉末 0.50 g。

熔點：284 ~ 286 °C

實施例 151

溶解 2 — (3, 4 — 二甲氧基苯甲醯基) — 4 — (3
, 4 — 二羥基羥基喹啉 — 6 — 基) 喹啉 (100 mg) 於
氯仿 (6 ml) 中，室溫下加入氫化硼鈉並在同溫下攪拌
1 小時。蒸餾去除溶劑，用氯仿萃取，水洗，乾燥，繼之
蒸餾去除溶劑。所得殘渣施以矽膠柱管層析法 (溶出液：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (240)

氯仿 / 甲醇 = 99 : 1) 精製，再從乙酸乙酯再結晶而得 2 - [1 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基) - 1 - 羥基甲基] - 4 - (3 , 4 - 二羥基羥基喹啉 - 6 - 基) 喹啉的淡褐色稜狀結晶 52 mg 。

熔點：188 ~ 189 °C 。

實施例 152

懸濁 2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 , 4 - 二羥基羥基 - 6 - 基) 喹啉 (2 g) 於乙酸 (50 ml) 中，加入鉻酸 (1.2 g) ，在 70 ~ 80 °C 下攪拌 3 小時。繼之加入活化矽酸鎂 (2 g ，日本和光純藥工業公司製，商品名稱為 Florisil) 在室溫下攪拌 1 小時。反應結束後蒸餾去除溶劑後，所得殘渣懸濁於氯仿 / 甲醇 = 4 / 1 的混合液中，過濾後蒸餾去除濾液，所得殘渣施以柱管層析法 (溶出液：氯仿 / 甲醇 = 199 / 1) 精製後，再從氯仿和乙醇混液中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 , 4 - 二羥基羥基喹啉 - 6 - 基) 喹啉的淡褐色針狀結晶 300 mg 。

熔點：249 - 251 °C

實施例 154 ~ 234

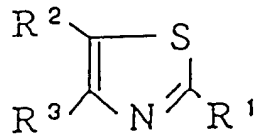
按照前述實施例 1 和 138 相同方法，利用適當原料化合物可製得表 10 中所示化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

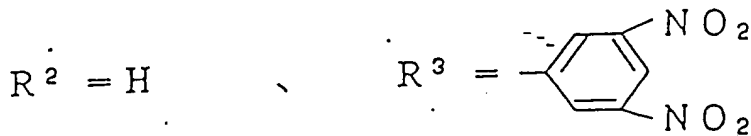
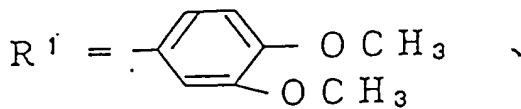
裝
訂
線

五、發明說明 (241)

第 10 表

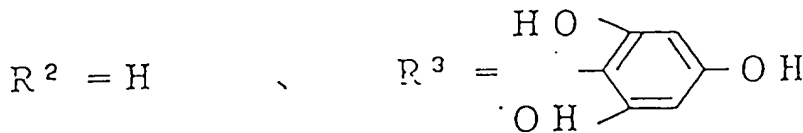
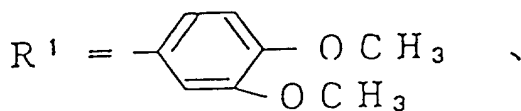


實施例 154 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從二噁烷中再結晶）
mp：196.5-197°C 形態：遊離

實施例 155 的化合物



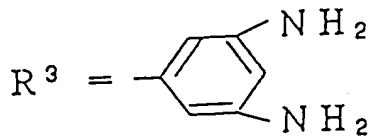
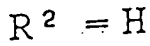
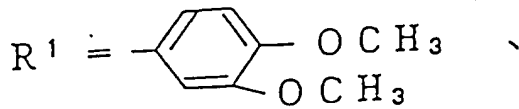
結晶形：淡褐色針狀（從甲醇中再結晶）
mp：133-135°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

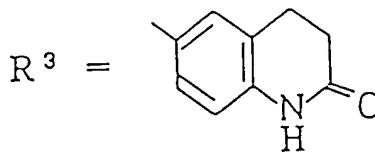
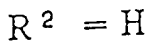
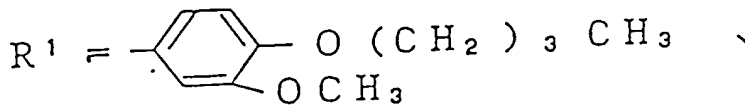
五、發明說明 (242)

實施例 156 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀（從乙醇水溶液中再結晶）
mp : 198 - 200°C 形態：2HCl 鹽

實施例 157 的化合物



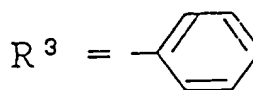
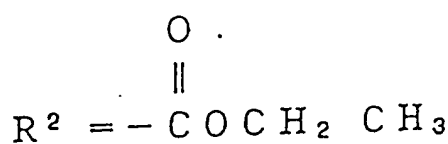
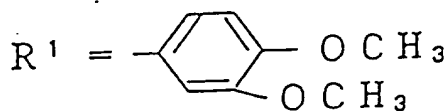
結晶形：無色針狀（從二噁烷中再結晶）
mp : 185 - 186°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

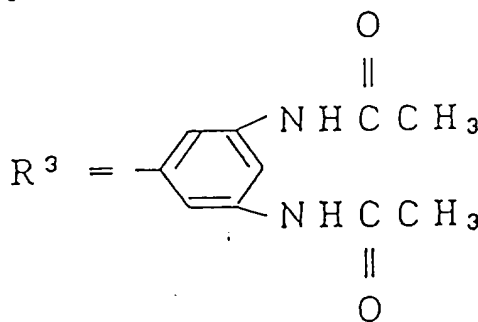
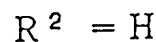
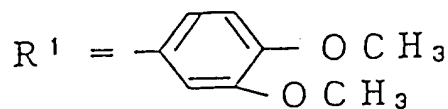
五、發明說明 (24B)

實施例 158 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 121 - 123°C 形態：遊離

實施例 159 的化合物



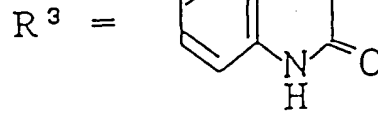
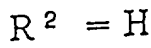
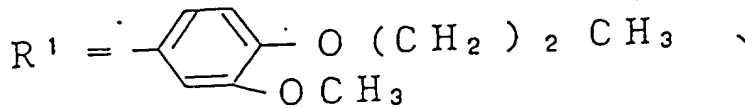
結晶形：白色粉末狀 (從二噁烷水溶液中再結晶)
mp : 255 - 256°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

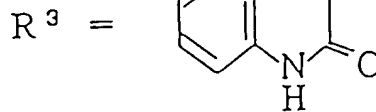
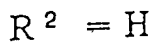
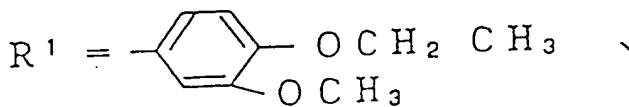
五、發明說明 (244)

實施例 160 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從二噁烷中再結晶）
mp：164-165°C 形態：遊離

實施例 161 的化合物



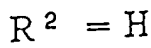
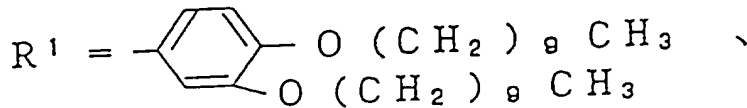
結晶形：無色針狀（從二噁烷中再結晶）
mp：203-204°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

.....
裝.....訂.....線.....
.....

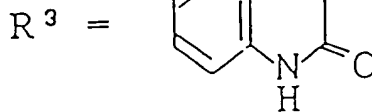
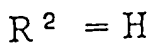
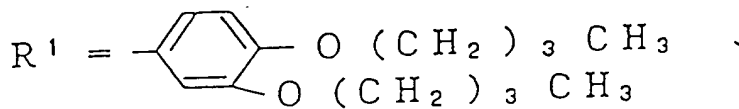
五、發明說明 (245)

實施例 162 的化合物



結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 125.5 - 126.5 °C 形態：遊離

實施例 163 的化合物



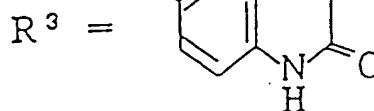
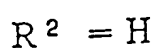
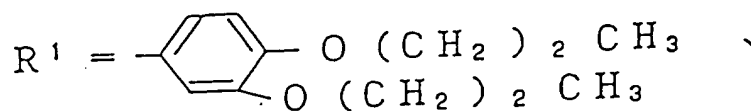
結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 170 - 171 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

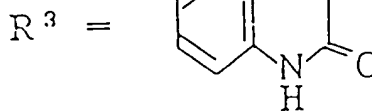
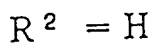
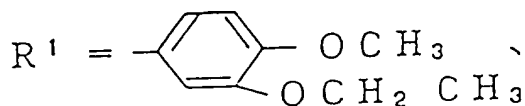
五、發明說明 (246)

實施例 164 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從二噁烷中再結晶）
mp：203—204°C 形態：遊離

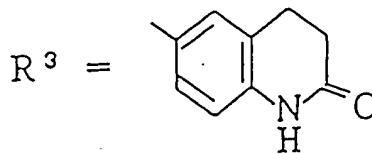
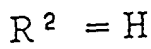
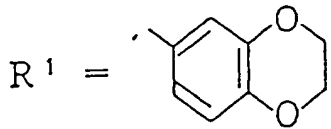
實施例 165 的化合物



結晶形：無色針狀（從二噁烷中再結晶）
mp：179—181°C 形態：遊離

五、發明說明 (247)

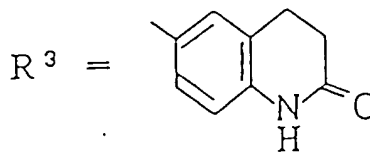
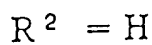
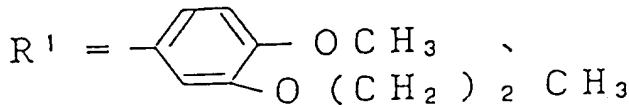
實施例 166 的化合物



結晶形：淡黃色稜狀
mp : 250 - 251 °C

(從二噁烷中再結晶)
形態：遊離

實施例 167 的化合物

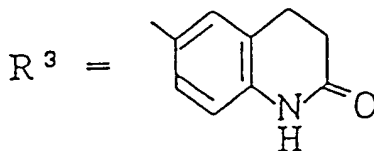
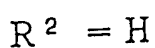
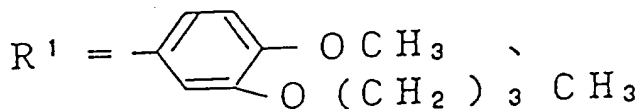


結晶形：白色針狀 (從二噁烷水溶液中再結晶)
mp : 188 - 189 °C

形態：遊離

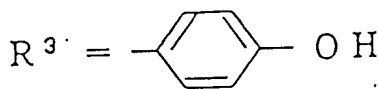
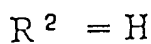
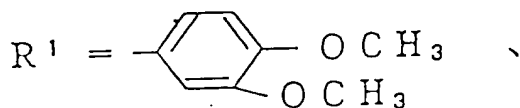
五、發明說明 (248)

實施例 168 的化合物



結晶形：淡黃色針狀 (從二噁烷水溶液中再結晶)
mp : 189 - 190°C 形態：遊離

實施例 169 的化合物



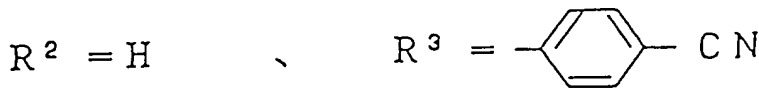
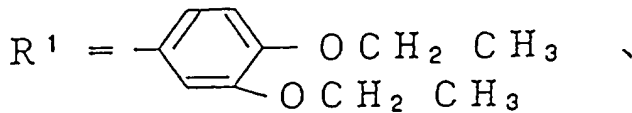
結晶形：淡褐色ヲリズム狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 171 - 172°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

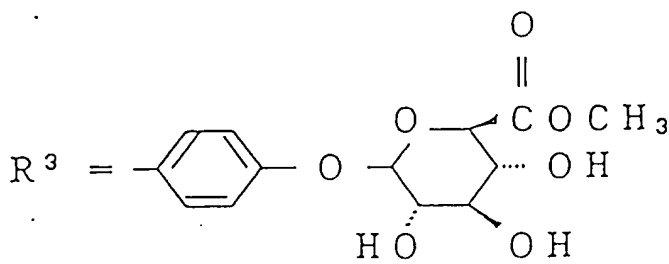
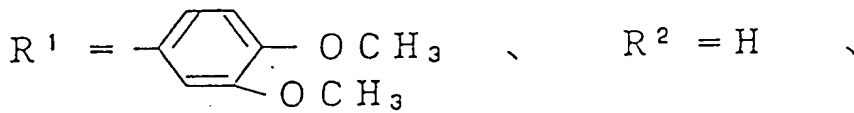
五、發明說明 (249)

實施例 170 的化合物



結晶形：無色針狀（從乙醇中再結晶）
mp：125—126°C 形態：遊離

實施例 171 的化合物



結晶形：無色針狀（從乙醇中再結晶）
mp：195—197°C 形態：遊離

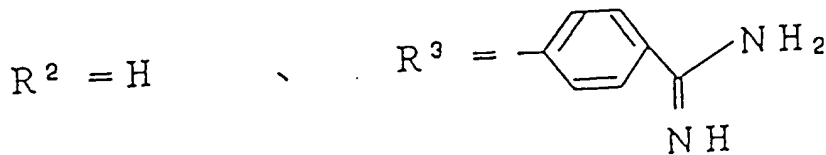
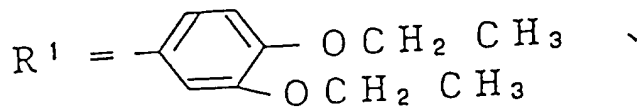
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

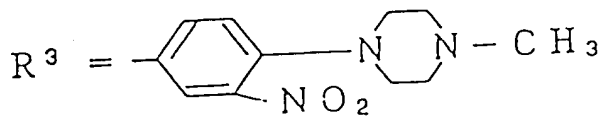
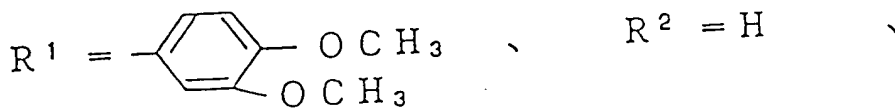
五、發明說明 (250)

實施例 172 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀 (從乙醇水溶液中再結晶)
mp : 96 - 97°C 形態：HCl 鹽

實施例 173 的化合物



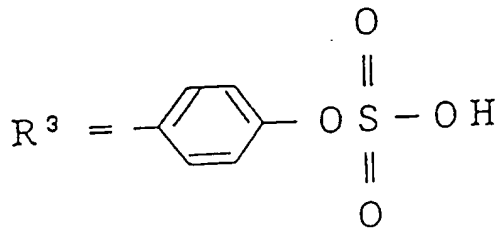
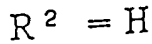
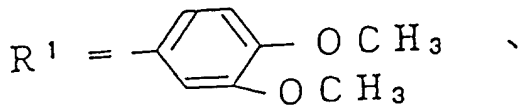
結晶形：淡褐色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 138 - 139°C 形態：2 鹽酸鹽

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (251)

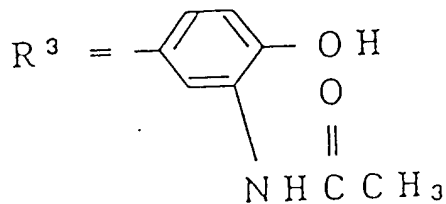
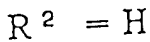
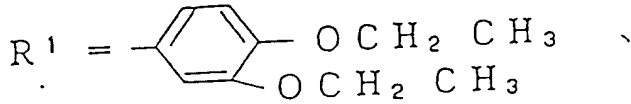
實施例 174 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀
mp : 248 - 249 °C

形態：遊離

實施例 175 的化合物



結晶形：淡黃色板狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 195 - 196 °C

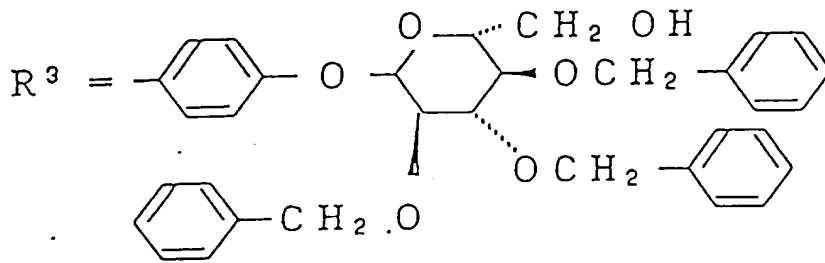
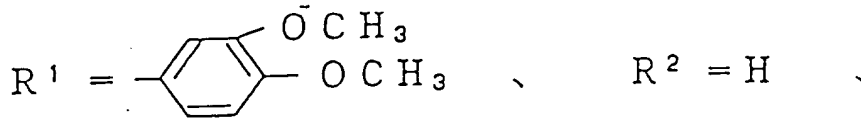
形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

· · · · · 裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

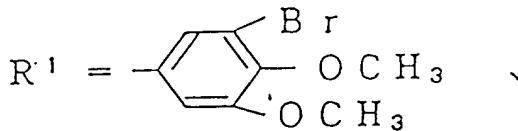
五、發明說明 (252)

實施例 176 的化合物

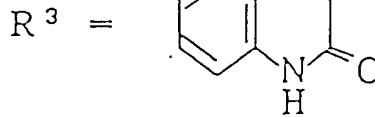


結晶形：白色粉末狀（從乙酸乙酯中再結晶）
 mp：180-181°C 形態：遊離

實施例 177 的化合物



$R^2 = H$



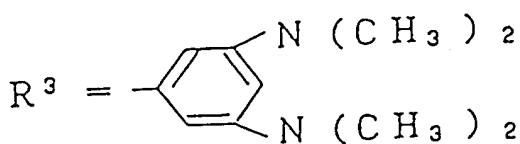
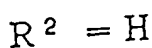
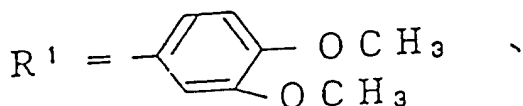
結晶形：淡黃色稜狀（從二噁烷中再結晶）
 mp：254-255°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (253)

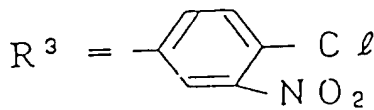
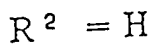
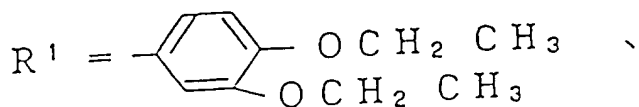
實施例 178 的化合物



結晶形：褐色粉末狀（從乙醇和二乙醚混液中再結晶）

mp : 164 - 165°C 形態：2 鹽酸鹽

實施例 179 的化合物



結晶形：淡黃色針狀（從乙醇中再結晶）

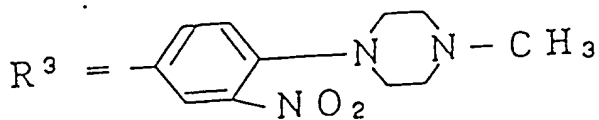
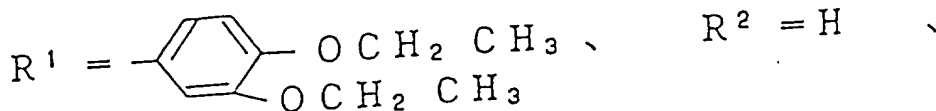
mp : 138 - 139°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

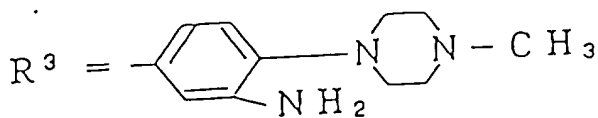
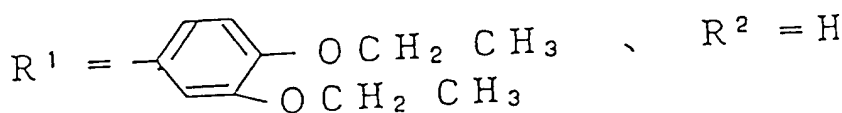
五、發明說明 (54)

實施例 180 的化合物



結晶形：黃色針狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 117 - 118°C 形態：2 鹽酸鹽

實施例 181 的化合物



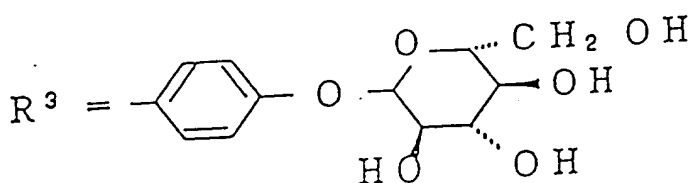
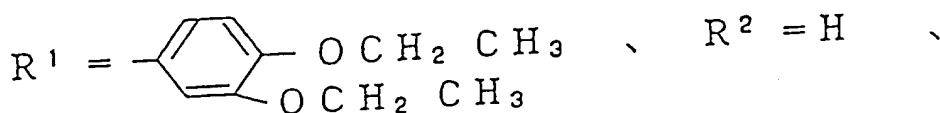
結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 168 - 170°C 形態：3 鹽酸鹽

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

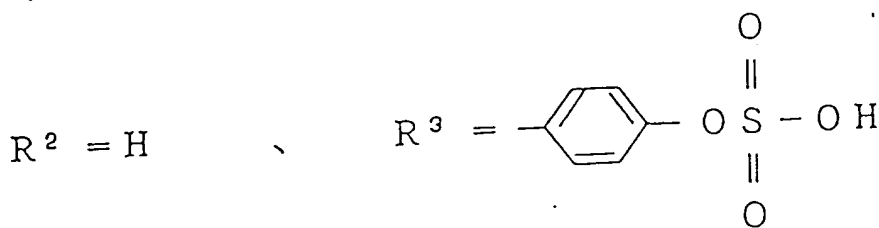
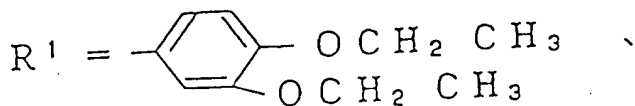
五、發明說明 (256)

實施例 184 的化合物



結晶形：白色針狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 138 - 140°C 形態：遊離

實施例 185 的化合物



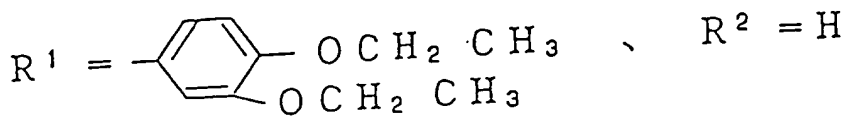
結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇水溶液中再結晶)
mp : 175 - 176°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (257)

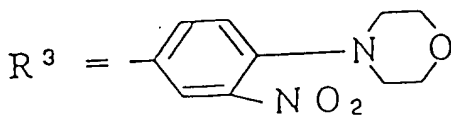
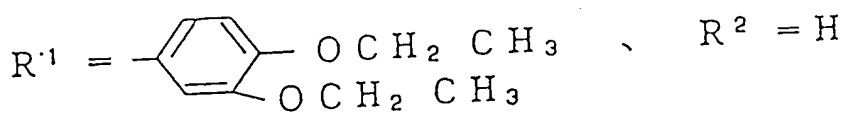
實施例 186 的化合物



結晶形：淡黃色針狀（從乙醇和二乙醚混液中再結晶）

mp : 138 - 140°C 形態：鹽酸鹽

實施例 187 的化合物



結晶形：橙色針狀（從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶）

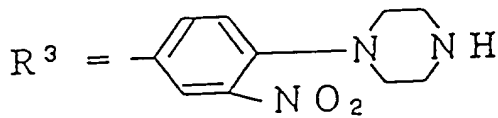
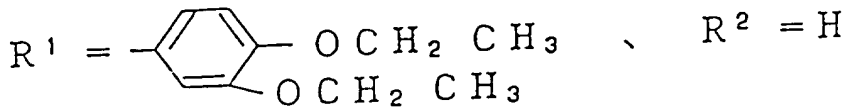
mp : 119 - 120°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

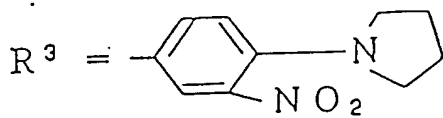
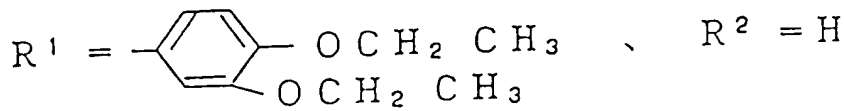
五、發明說明 (258)

實施例 188 的化合物



結晶形：褐色稜狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 202 - 203 °C 形態：鹽酸鹽

實施例 189 的化合物



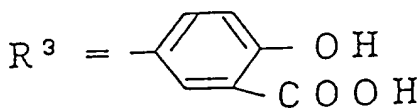
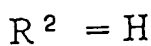
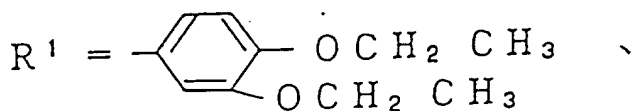
結晶形：黃色針狀 (從二噁烷水溶液中再結晶)
 mp : 142 - 143 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

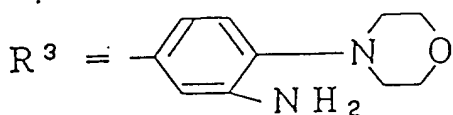
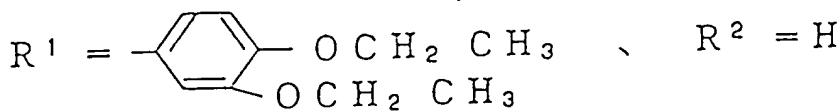
五、發明說明 (259)

實施例 190 的化合物



結晶形：白色針狀（從甲醇中再結晶）
mp：194—195°C 形態：遊離

實施例 191 的化合物



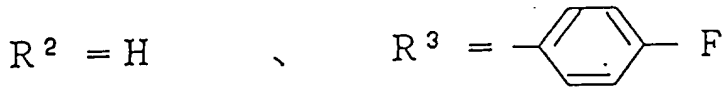
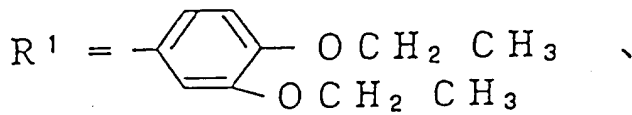
結晶形：無色針狀（從乙醇水溶液中再結晶）
mp：173—175°C 形態：鹽酸鹽

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

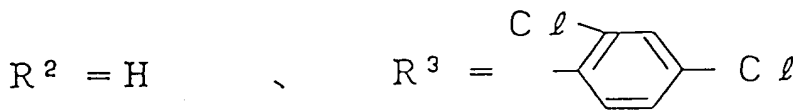
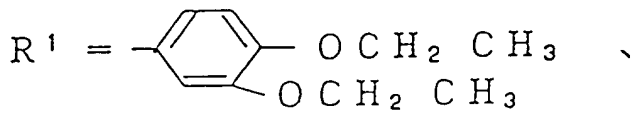
五、發明說明 (260)

實施例 192 的化合物



結晶形：淡黃色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 98 - 99 °C . 形態：遊離

實施例 193 的化合物



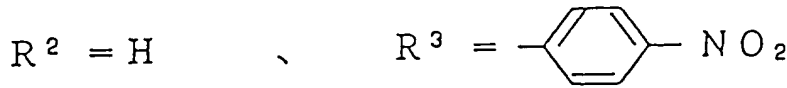
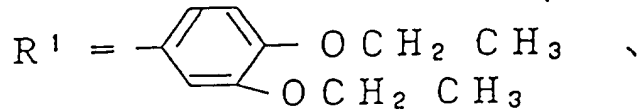
結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 95 - 96 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

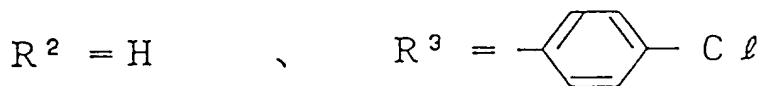
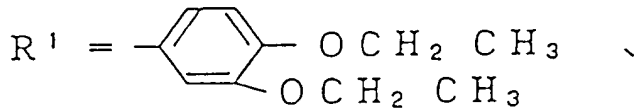
五、發明說明 (261)

實施例 194 的化合物



結晶形：黃色針狀 (從二噁烷水溶液中再結晶)
mp : 145 - 146.5 °C 形態：遊離

實施例 195 的化合物



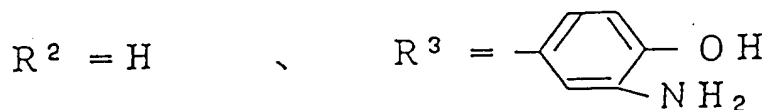
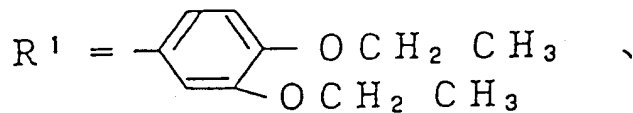
結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 114 - 114.5 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (62)

實施例 196 的化合物



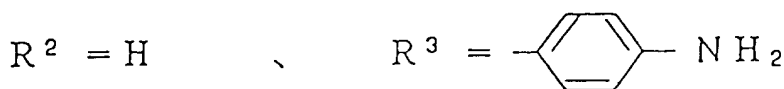
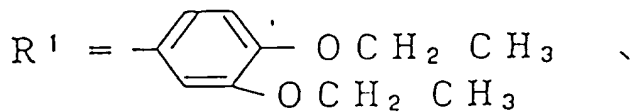
結晶形：黃色粉末狀（從乙醇中再結晶）

mp：158—180°C（分解） 形態：2 鹽酸鹽

NMR (DMSO-d₆) δ：

1.28-1.5 (6H, m)、4.02-4.25 (4H, m)、
7.10 (1H, d, J=8.3Hz)、7.19 (1H, d, J=8.5Hz)、
7.46-7.63 (2H, m)、7.83-7.97 (2H, m)、
8.12 (1H, d, J=2Hz)

實施例 197 的化合物



結晶形：淡綠色粉末狀（從乙醇水溶液中再結晶）

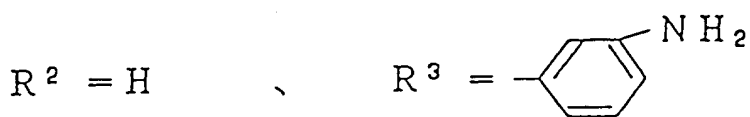
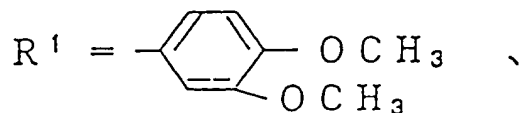
mp：230°C（分解） 形態：鹽酸鹽

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

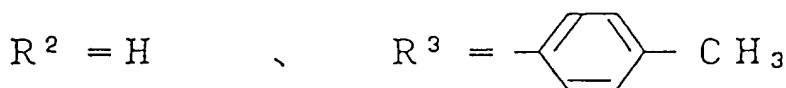
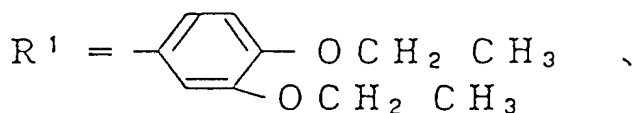
五、發明說明 (263)

實施例 198 的化合物



結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 244°C (分解) 形態：鹽酸鹽

實施例 199 的化合物



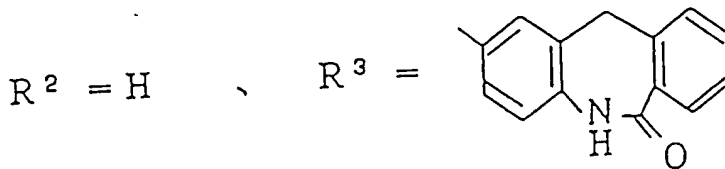
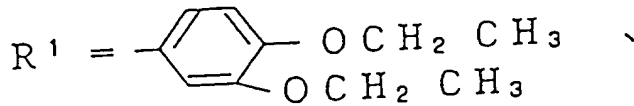
結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 111 - 112°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

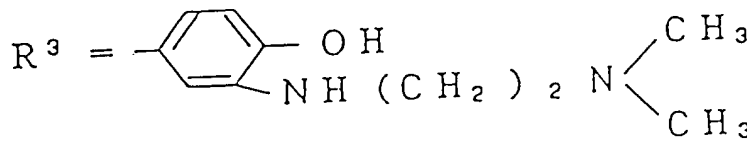
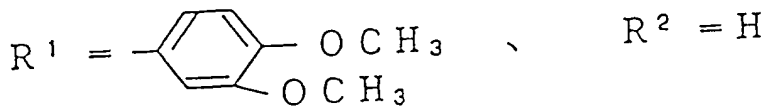
五、發明說明 (264)

實施例 200 的化合物



結晶形：無色棒狀 (從二噁烷中再結晶)
mp : 228 - 229°C 形態：遊離

實施例 201 的化合物



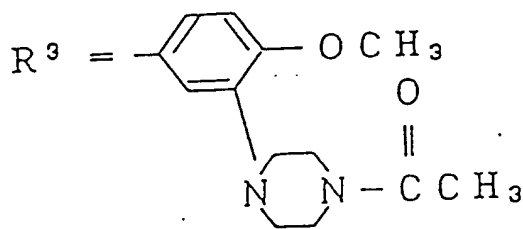
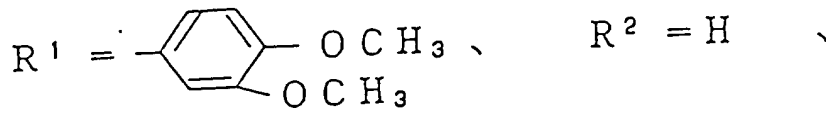
結晶形：白色粉末狀 (從乙醇水溶液中再結晶)
mp : 186 - 188°C 形態：2 鹽酸鹽

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

..... 裝 訂 線

五、發明說明 (265)

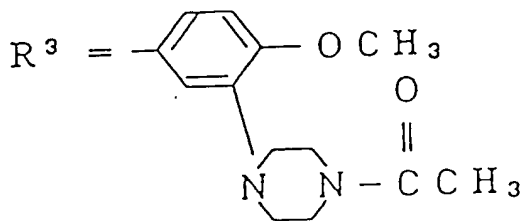
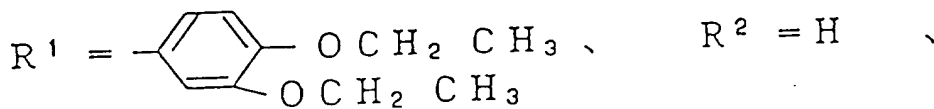
實施例 202 的化合物



結晶形：黃色針狀（從甲醇和乙酸乙酯混液中再結晶）

mp : 170 - 171 °C 形態：遊離

實施例 203 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶）

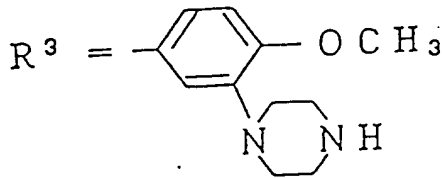
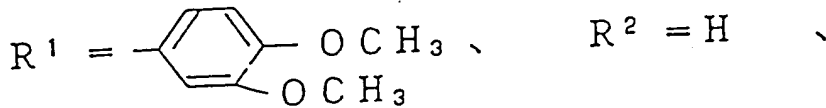
mp : 112 - 113 °C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

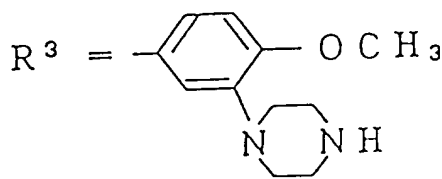
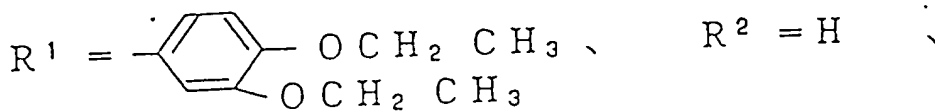
五、發明說明 (266)

實施例 204 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醇中再結晶）
 mp：150-154°C（分解） 形態：2 鹽酸鹽

實施例 205 的化合物



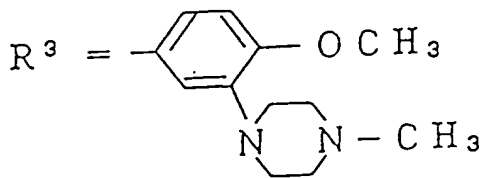
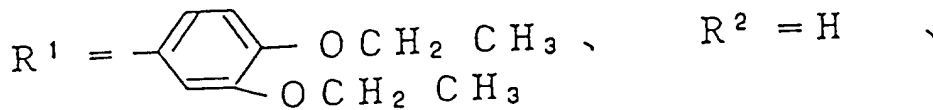
結晶形：白色粉末狀（從甲醇和乙酸乙酯混液中再結晶）
 mp：206-208°C 形態：3 鹽酸鹽

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

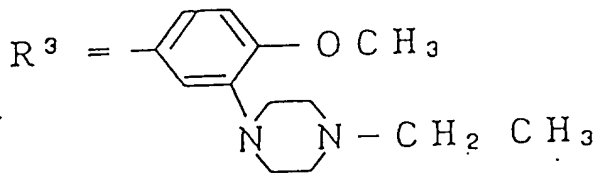
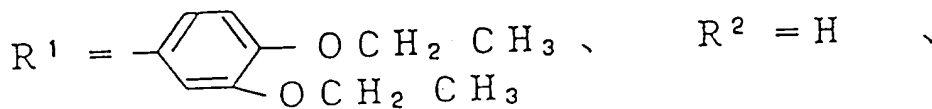
五、發明說明 (267)

實施例 206 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醇中再結晶）
 mp：155-158°C（分解） 形態：3 鹽酸鹽

實施例 207 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醇中再結晶）
 mp：241-244°C 形態：3 鹽酸鹽

（請先閱讀請背面之注意事項再填寫本頁）

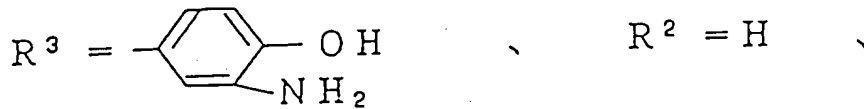
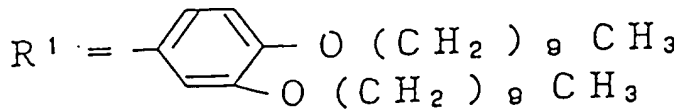
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·



A 6
B 6

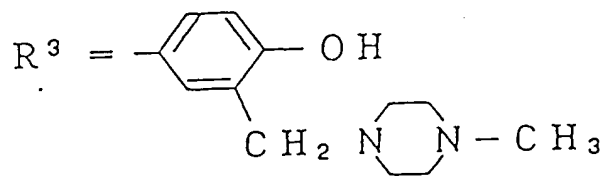
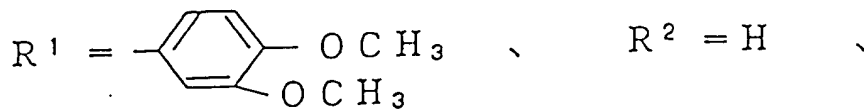
五、發明說明 (268)

實施例 208 的化合物



結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 156 - 162 °C 形態：2 鹽酸鹽

實施例 209 的化合物



結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
 mp : 178 - 190 °C 形態：3 鹽酸鹽

NMR (DMSO-d₆) δ :

2.83 (3H, brs) 、 3.28-3.82 (8H, m) 、
 3.85 (3H, s) 、 3.91 (3H, s) 、 7.11 (2H, d, J=8.4Hz) 、
 7.52-7.68 (2H, m) 、 7.87 (1H, s) 、
 7.98 (1H, dd, J=2.0Hz, 8.5Hz) 、 8.30 (1H, d, J=2.0Hz)

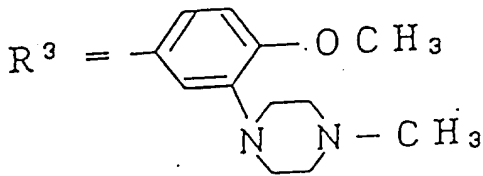
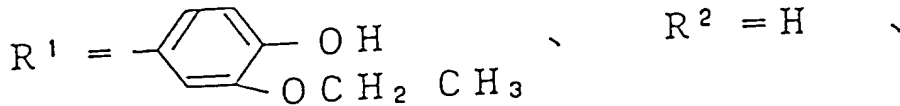
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

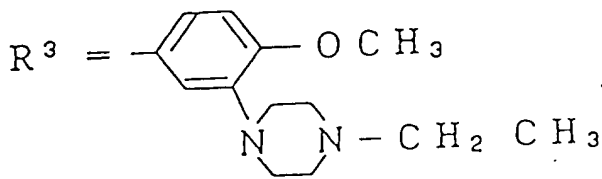
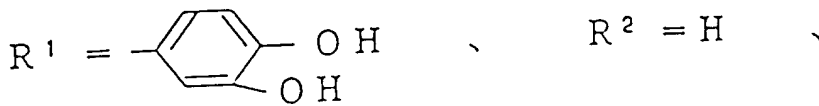
五、發明說明 (269)

實施例 210 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙醇中再結晶）
 mp：188-192°C（分解） 形態：2 鹽酸鹽

實施例 211 的化合物



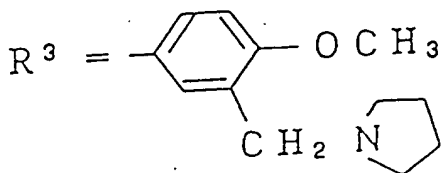
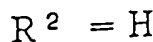
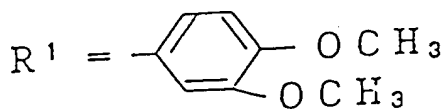
結晶形：黃色針狀（從乙酸乙酯和乙醇混液中再結晶）
 mp：166-170°C 形態：3 鹽酸鹽

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

.....
裝.....訂.....線.....

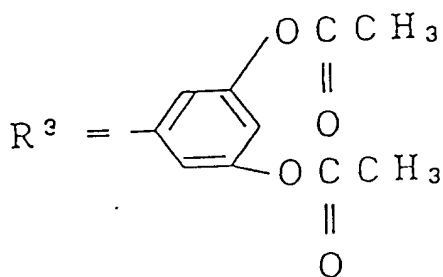
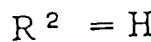
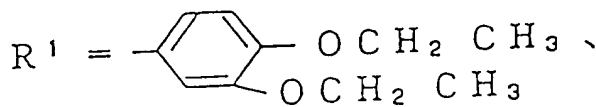
五、發明說明 (270)

實施例 2 1 2 的化合物



結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 167 - 171 °C 形態：2 鹽酸鹽

實施例 2 1 3 的化合物



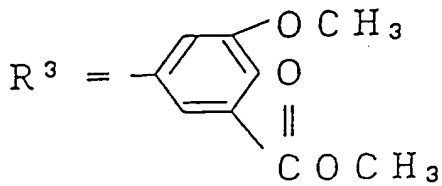
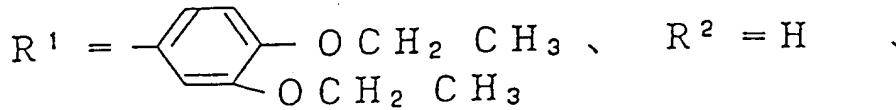
結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 137 - 138 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

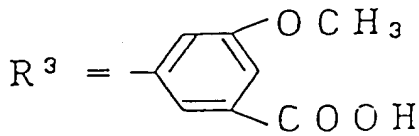
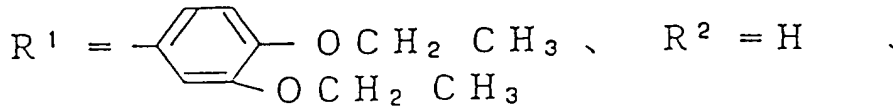
五、發明說明 (271)

實施例 214 的化合物



結晶形：無色稜狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 121 - 122 °C 形態：遊離

實施例 215 的化合物



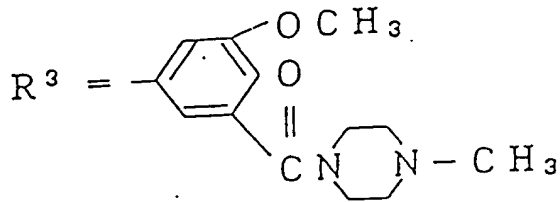
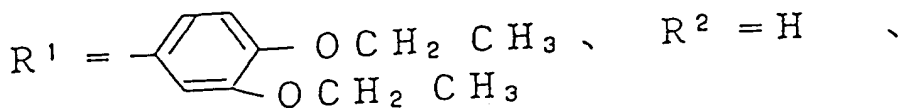
結晶形：無色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 176 - 177 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

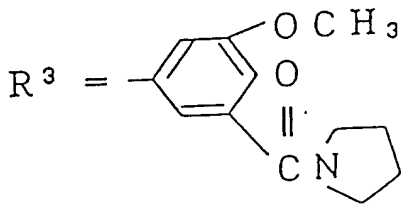
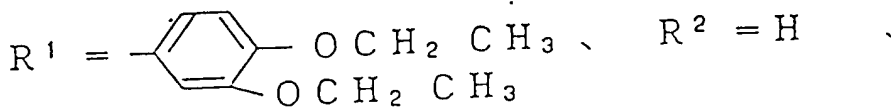
五、發明說明 (272)

實施例 216 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙酸乙酯中再結晶）
mp：185-186°C 形態：鹽酸鹽

實施例 217 的化合物



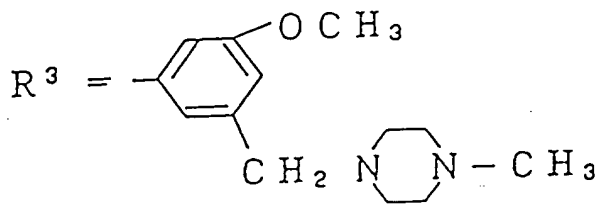
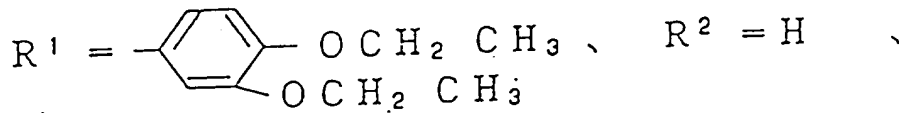
結晶形：白色粒狀（從二異丙醚中再結晶）
mp：113-114°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

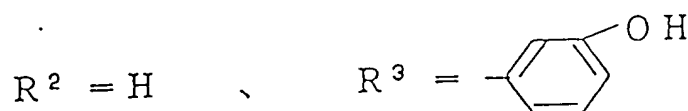
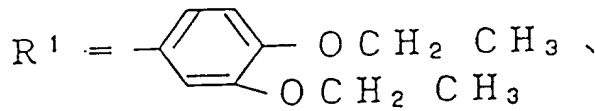
五、發明說明 (273)

實施例 218 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙酸乙酯中再結晶）
mp：212-214°C 形態：2 鹽酸鹽

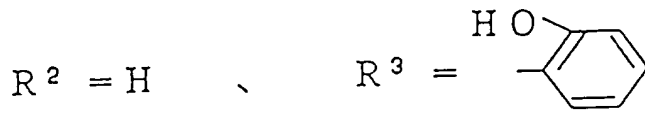
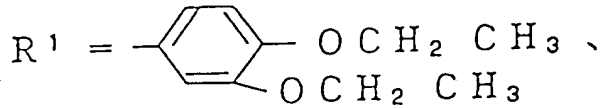
實施例 219 的化合物



結晶形：白色板狀（從乙醇中再結晶）
mp：126-128°C 形態：遊離

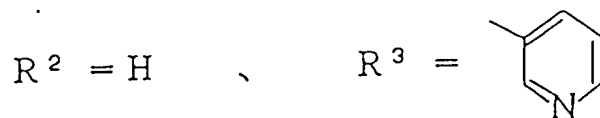
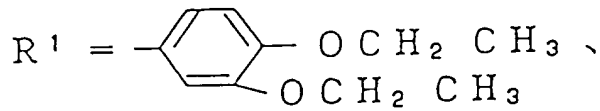
五、發明說明 (274)

實施例 220 的化合物



結晶形：淡黃色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 97 - 98 °C . 形態：遊離

實施例 221 的化合物



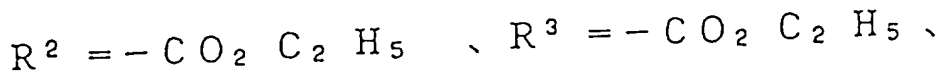
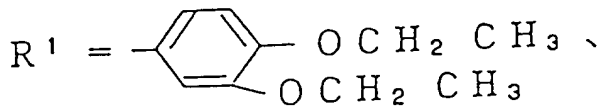
結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 161 - 164 °C . 形態：鹽酸鹽

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (275)

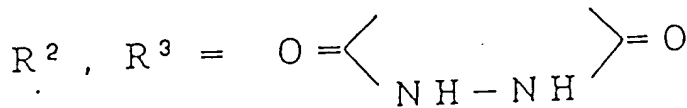
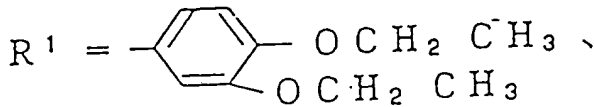
實施例 2 2 2 的化合物



結晶形：黃色針狀（從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶）

mp : 133 - 134 °C 形態：遊離

實施例 2 2 3 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從二甲基甲醯胺中再結晶）

mp : 270 - 279 °C (分解) 形態：遊離

NMR (DMSO-d₆) δ :

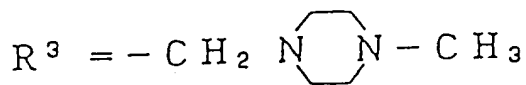
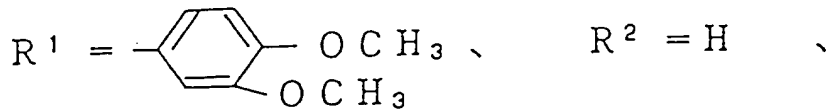
1.39 (3H, t, J=6.8Hz) 、 1.40 (3H, t, J=6.8Hz) 、
4.00-4.35 (4H, m) 、 7.13 (1H, d, J=8.4Hz) 、
7.16 (1H, d, J=2.0Hz) 、 7.68 (1H, dd, J=2.0Hz, ...
8.4Hz) 、 11.97 (2H, brs)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 (276)

實施例 224 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從乙醇中再結晶）

mp：188—210°C（分解） 形態：2 鹽酸鹽

NMR (DMSO-d₆) δ：

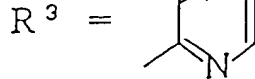
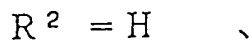
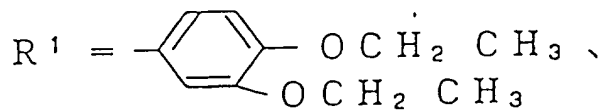
2.82 (3H, s)、3.25-3.78 (8H, m)、

3.85 (3H, s)、3.88 (3H, s)、4.49 (2H, brs)、

7.09 (1H, d, J=8.6Hz)、7.44-7.60 (2H, m)、

7.92 (1H, s)

實施例 225 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從丙酮中再結晶）

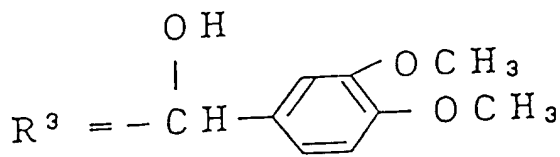
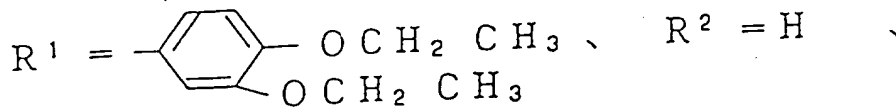
mp：114—115°C 形態：鹽酸鹽

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

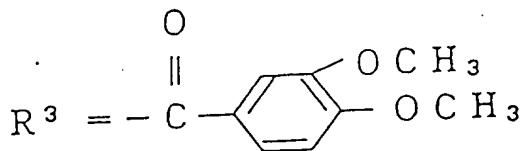
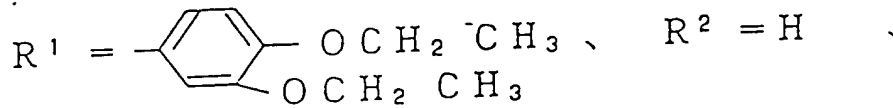
五、發明說明 (277)

實施例 226 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從二乙醚中再結晶）
mp：122-123°C 形態：遊離

實施例 227 的化合物



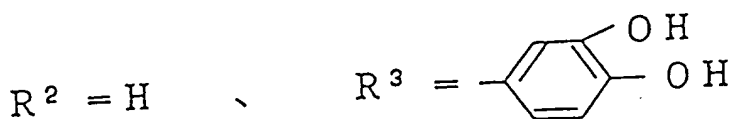
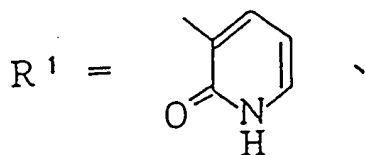
結晶形：白色粉末狀（從乙酸乙酯和正己烷混
液中再結晶）
mp：128-129°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (278)

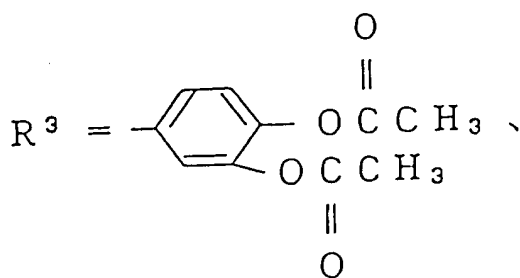
實施例 228 的化合物



結晶形：暗黃色粉末狀（從二甲基甲醯胺水溶液中再結晶）

mp : 285 - 290°C (分解) 形態：遊離

實施例 229 的化合物



結晶形：無色稜狀（從乙酸乙酯中再結晶）

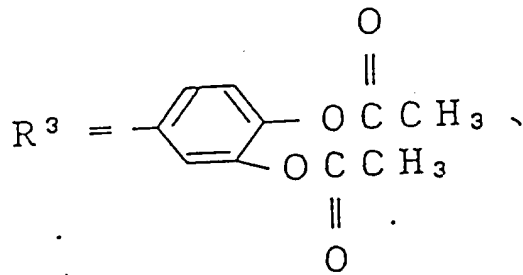
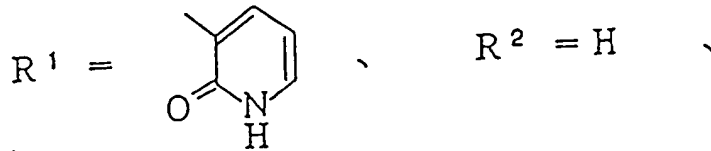
mp : 130 - 131°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

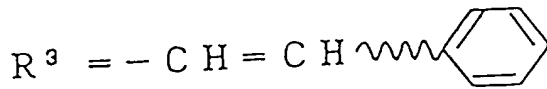
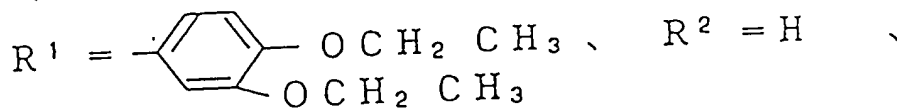
五、發明說明 (79)

實施例 230 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從二甲基甲醯胺和乙醇混液中再結晶）
 mp : 256 - 257 °C 形態：遊離

實施例 231 的化合物



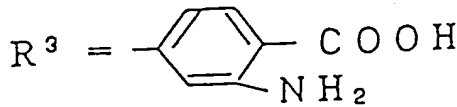
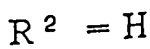
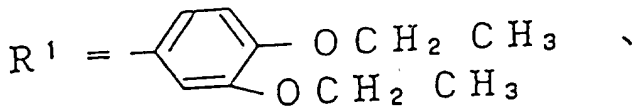
結晶形：淡黃色粉末狀
 mp : 94 - 95 °C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

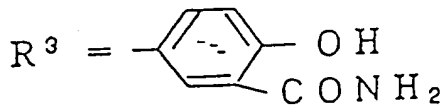
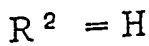
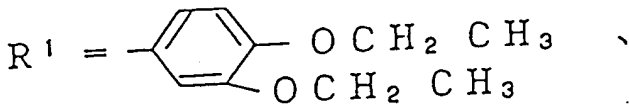
裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (280)

實施例 2 3 2 的化合物



實施例 2 3 3 的化合物

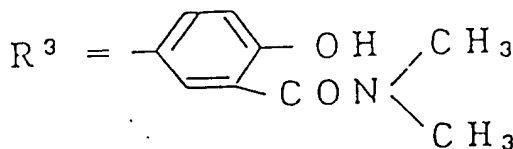
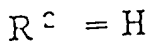
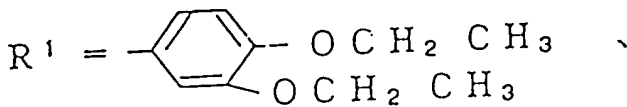


結晶形：無色稜狀 (從二氯甲烷和乙醇混液中再結晶)

mp : 195 - 196 °C

形態：遊離

實施例 2 3 4 的化合物



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (281)

實施例 235

將 4 - (3, 5 - 二硝基苯基) - 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) 噻唑 (5.9 g) 和氯化亞錫二水合物 (24.4 g) 的濃鹽酸溶液 (90 ml) 於室溫下攪拌 2 小時。冷卻後濾取析出的結晶，從乙醇水溶液中再結晶而得 4 - (3, 5 - 二胺基苯基) - 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) 噻唑二鹽酸鹽 3.73 g。

熔點：198 ~ 200 °C

淡黃色粉末狀。

按照本實施例 235 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 55, 91, 104, 181, 191, 196, 197, 198, 208, 232 的化合物。

實施例 236

溶解 4 - (4 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (1.5 g), 2, 3, 4, 6 - 四 - O - 乙醯基 - β - D - 葡糖吡喃糖 (1.4 g) 以及三苯基磷 (1.3 g) 於四氫呋喃 (45 ml) 中，0 °C 下分量慢慢加入含有二乙基偶氮基二羧酸酯 (0.9 g) 的四氫呋喃 (5 ml) 溶液，在室溫下攪拌 14 小時。蒸餾去除溶劑所得殘渣利用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷) 精製之。從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶而得 4 - [4 - (2, 3, 4, 6 - 四 - O - 乙醯基 - β - D - 葡糖吡喃糖基氧基) 苯基] - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑

(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)

1. 52 g.

熔點：180~181°C

白色粉末狀

按照實施例 236 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 171 和 184 的化合物。

實施例 237

懸濁 4 - [4 - (2 , 3 , 4 , 6 - 四 - O - 乙醯基 - β - D - 葡糖吡喃糖基氧基) 苯基] - 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (0 . 15 g) 於甲醇和二氯甲烷的混合溶液 (2 : 1 , 6 ml) 中，再加入催化劑量的甲醇鈉，在室溫下攪拌 2 小時。蒸餾去除溶劑後由甲醇中再結晶而得 4 - [4 - (β - D - 葡糖吡喃糖基氧基) 苯基] - 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 71 mg。

熔點：138~140°C

白色針狀結晶

實施例 238

室溫下滴加氯磺酸 (2 ml) 於吡啶 (40 ml) 中，在 50°C 下攪拌 12 小時。加入 4 - (4 - 羥基苯基 - 2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基) 噻唑 (0 . 33 g) ，先於 50°C 下攪拌 6 小時。然後在室溫下攪拌一夜。反應液經減壓蒸餾乾涸後，加水於殘渣中並濾取結晶，所得 4 - (4 - 羥基磺醯基氧基苯基) - 2 - (3 , 4 - 二甲氧基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (284)

3. 28 - 3. 82 (8 H, m),
 3. 85 (3 H, s),
 3. 91 (3 H, s),
 7. 11 (2 H, d, J = 8. 4 Hz),
 7. 52 - 7. 68 (2 H, m)
 7. 87 (1 H, s)
 7. 98 (1 H, dd, J = 2. 0 Hz,
 8. 5 Hz),
 8. 30 (1 H, d, J = 2. 0 Hz)。

實施例 240

含有 4 - (3 - 甲氧基 - 5 - 羧基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (1. 5 g), N - 甲基六氫吡啶 (0. 4 g) 以及二乙基氰基磷酸鹽 (0. 7 g) 的二甲基甲醯胺溶液 (20 ml), 冰冷攪拌下加入三乙胺 (0. 6 ml), 室溫下攪拌 14 小時。蒸餾去除溶劑, 所得殘渣中加入二氯甲烷 (80 ml) 和水 (30 ml), 並分離之。二氯甲烷層用飽和碳酸氫鈉水溶液 (20 ml) 以及飽和食鹽水 (20 ml) 洗淨, 乾燥後蒸餾去除溶劑, 所得殘渣利用矽膠柱管層析法 (溶出液: 二氯甲烷 / 甲醇 = 200 / 3, V / V) 精製, 溶解於乙酸乙酯, 加入鹽酸酸性乙醇, 濾取析出結晶, 乾燥後從乙酸乙酯中再結晶而得 4 - [3 - 甲氧基 - 5 - (4 - 甲基 - 1 - 六氫吡啶基羧基) 苯基 - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (285)

噻唑鹽酸鹽 1.2 g。

白色粉末狀

熔點：185~186°C

按照本實施例 240 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 120，217 以及 233 的化合物。

實施例 241

溶解 4 - [3 - 甲氧基 - 5 - (4 - 甲基 - 1 - 六氫吡啶基羰基) 苯基] - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (0.4 g) 於四氫呋喃 (20 ml) 中，逐以少量加入氫化鋁鋰 (32 mg)，並在 0°C 下攪拌 30 分鐘，然後在室溫下攪拌 2 小時。加入 10% 氫氧化鈉水溶液 (0.05 ml) 和水 (0.1 ml)，再在室溫下攪拌 20 分鐘。反應液過濾後，濃縮濾液，所得殘渣利用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷 / 甲醇 = 99 / 1；V / V) 精製，溶解於乙酸乙酯，加入鹽酸酸性乙醇，濾取所析出結晶，乾燥後從乙酸乙酯中再結晶而得 4 - [3 - 甲氧基 - 5 - (4 - 甲基 - 1 - 六氫吡啶基甲基) 苯基] - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑二鹽酸鹽 40 mg。

白色粉末狀。

熔點：212~214°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

311136

五、發明說明 (286)

實施例 2 4 2

含有 4 - (4 - 氯 - 3 - 硝基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (1 g) 和嗎啉 (636 mg) 的二甲基甲醯胺 (20 ml) 以及二甲亞碲 (20 ml) 溶液於 150 °C 下加熱還流 2 ~ 3.5 小時。反應液經減壓蒸餾後，殘渣移入冰水中，加入碳酸氫鈉水溶液，用二氯甲烷萃取三次。以食鹽水洗淨後用硫酸鎂乾燥，蒸餾去除溶劑，所得殘渣利用矽膠柱管層析法精製後，從乙酸乙酯和正己烷混液再結晶而得 4 - (4 - 嗎啉基 - 3 - 硝基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 1.03 g。橙色針狀結晶。

熔點：119 ~ 120 °C。

按照本實施例 2 4 2 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 1 7 3, 1 8 0, 1 8 8 和 1 8 9 的化合物。

實施例 2 4 3

懸濁 4, 5 - 二乙氧基羧基 - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (1 g) 於乙醇 (4 ml) 中，加入胼水合物 (2 ml)，在密封管中於 130 °C 下加熱 48 小時。冷卻後濾取所析出結晶。用乙醇洗淨，乾燥後從二甲基甲醯胺中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 5, 6 - 二氫噻唑駢 [4, 5 - d] 嗒嗒基 - 4, 7 - 二酮 220 mg。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (287)

熔點：270 ~ 279 °C (分解)

黃色粉末狀

核磁氣共振譜 (DMSO - d₆) δ :

1.39 (3H, t, J = 6.8 Hz),

1.40 (3H, t, J = 6.8 Hz),

4.00 - 4.35 (4H, m)

7.13 (1H, d, J = 8.4 Hz),

7.61 (1H, d, J = 2.0 Hz),

7.68 (1H, dd, J = 2.0 Hz,

8.4 Hz),

11.97 (2H, br s)。

實施例 244

溶解 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - 氮甲基噻唑 (860 mg) 和 N - 甲基六氫吡啶 (320 mg) 於二甲基甲醯胺 (10 ml) 中，加入氫化鈉 (130 mg) 於室溫下攪拌 14 小時。蒸餾去除溶劑，所得殘渣以氯仿萃取，水洗，乾燥後蒸餾去除溶劑。溶解所得殘渣於乙醇中，加入氯化氫飽和乙醇並放置之。濾取所析出結晶，用少量乙醇洗淨，乾燥之。從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (4 - 甲基六氫吡啶基甲基) 噻唑 820 mg。

熔點：188 ~ 210 °C (分解)

淡褐色粉末狀

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (288)

按照實施例 2 4 4 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 2 0 9，2 1 2，2 1 8 的化合物。

實施例 2 4 5

由 1 - 溴 - 3, 4 - 二甲氧基苯 (2.4 g) 所調製得格利雅試劑 (Grignard reagent) 的四氫呋喃溶液 (60 ml)，經冰冷攪拌後，再加入含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - 甲醯基噻唑 (3 g) 的四氫呋喃溶液 (20 ml)，同溫度下攪拌 1 小時，然後在室溫下攪拌 3 小時。加入飽和氯化銨水溶液 (10 ml)，並蒸餾去除溶劑，所得殘渣用氯仿 (100 ml) 萃取，以水 (20 ml)，飽和食鹽水 (20 ml) 洗淨後，乾燥之。蒸餾去除溶劑所得殘渣利用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷 / 丙酮 = 99 / 1 V / V) 精製。從二乙醚中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [1 - 羥基 1 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) 甲基] 噻唑 2.2 g。

熔點：122 ~ 123 °C

淡褐色粉末狀。

按照本實施例 2 4 5 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 1 2 8 的化合物。

實施例 2 4 6

溶解 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [1 - 羥基 - 1 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) 甲基] 噻唑 (150

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (289)

m g) 於氯仿 (20 m l) 中，加入二氧化錳 (1 g)，加熱還流 2 小時。過濾反應液，濃縮濾液，從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二乙氧基苯甲醯基) 噻唑 98 m g。

熔點：128 ~ 129 °C

白色粉末狀。

按照本實施例 246 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 127 的化合物。

實施例 247

含有苯甲基三苯基氯化磷 (2⁻: 6 g) 的四氫呋喃 (10 m l) 的懸濁液，在 -50 °C 下攪拌中逐以少量滴下正丁基鋰 (4.2 m l)。昇溫至室溫後，再於 -50 °C 下加入 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - 甲醯基噻唑 (2 g) 的四氫呋喃溶液 (12 m l)，同溫度下攪拌 30 分鐘，再於室溫下攪拌 14 小時。加入水 (10 m l)，乙酸乙酯 (40 m l)，經分離萃取，乾燥後蒸餾去除溶劑，所得殘渣利用矽膠柱管層析法精製而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - 苯乙醯基噻唑的順式和反式異構物 (1 : 1) 的混合物 2 g。

熔點：94 ~ 95 °C

淡黃色粉末狀

按照本實施例 247 相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 129 和 135 的化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (290)

實施例 2 4 8

按照前述實施例 1 4 2 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 1 5 5，1 6 9，1 7 5，1 8 2，1 9 0，1 9 6，2 0 1，2 0 8，2 0 9，2 1 0，2 1 1，2 1 9，2 2 0，2 2 8 和 2 3 3 的化合物。

實施例 2 4 9

按照前述實施例 1 4 3 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 1 7 2，1 7 8，1 8 0，1 8 1，1 8 6，2 0 1，2 0 6，2 0 7，2 0 9，2 1 0，2 1 1，2 1 6 和 2 3 4 的化合物。

實施例 2 5 0

按照前述實施例 1 5 1 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 2 2 6 的化合物。

實施例 2 5 1

按照前述實施例 1 5 2 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 2 2 7 的化合物。

實施例 2 5 2

按照前述實施例 1 4 6 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 1 5 9，1 7 5，1 8 6，

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (291)

202 和 203 的化合物。

實施例 253 ~ 351

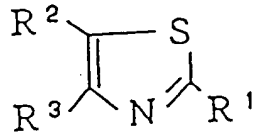
按照前述實施例 1 和 138 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得下列 11 表中所示化合物。

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

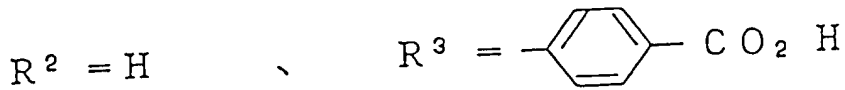
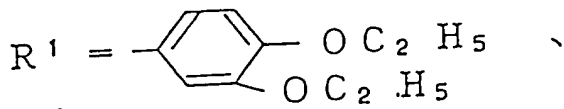
.....
裝.....
訂.....
線.....
.....

五、發明說明 (292)

第 11 表



實施例 253 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從甲醇和氯仿混液中再結晶)

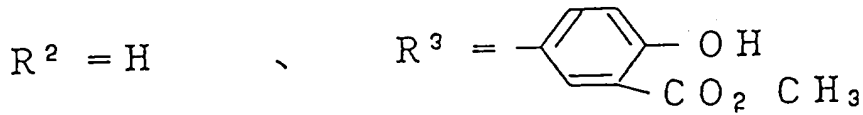
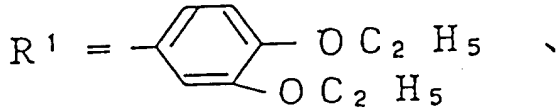
mp : 219.3 - 220.3°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

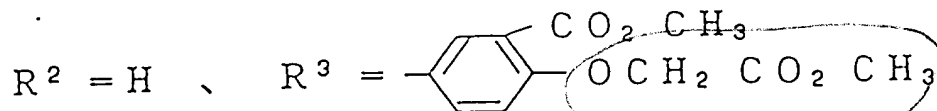
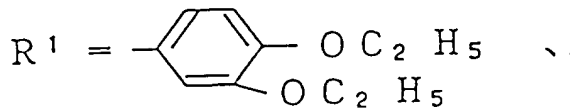
五、發明說明 (293)

實施例 254 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 137 - 138.°C 形態：遊離

實施例 255 的化合物



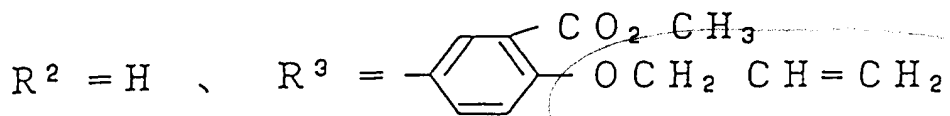
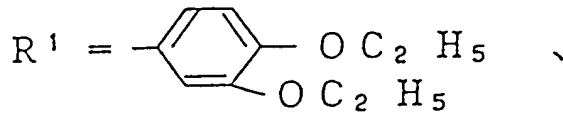
結晶形：無色針狀 (從二異丙醚中再結晶)
mp : 96 - 97°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (294)

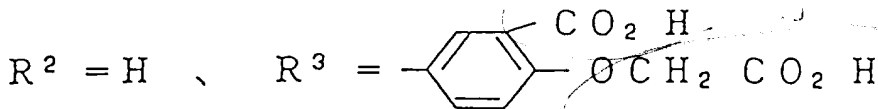
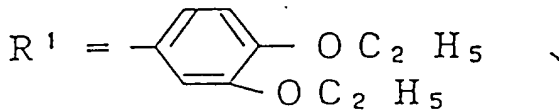
實施例 256 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從二異丙醚中再結晶）：

mp : 86 - 87 °C 形態：遊離

實施例 257 的化合物



結晶形：淡褐色粒狀（從二異丙醚中再結晶）：

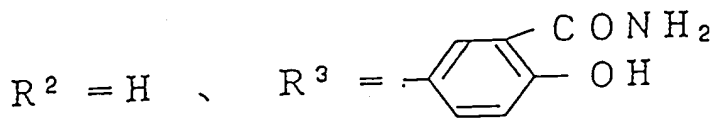
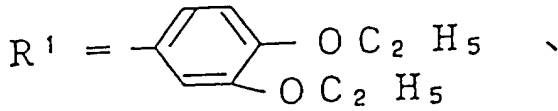
mp : 199 - 200 °C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

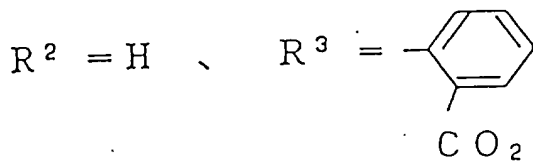
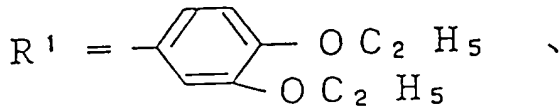
五、發明說明 (295)

實施例 258 的化合物



結晶形：無色稜狀 (從二氯甲烷和乙醇混液中再結晶)
mp : 195 - 196 °C 形態：遊離

實施例 259 的化合物



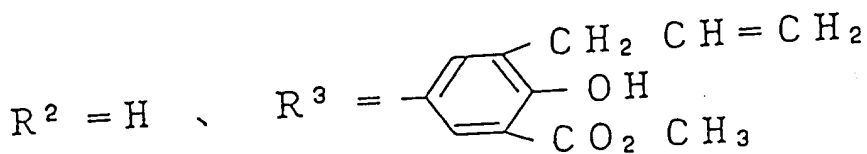
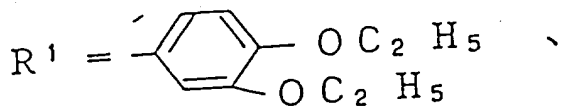
結晶形：白色粉末狀 (從乙醚和正己烷混液中再結晶)
mp : 131 - 131.8 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (296)

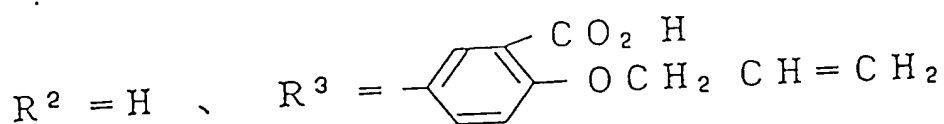
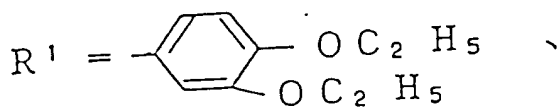
實施例 260 的化合物



結晶形：無色稜狀 (從二異丙醚中再結晶)

mp : 118 - 119°C 形態：遊離

實施例 261 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯中再結晶)

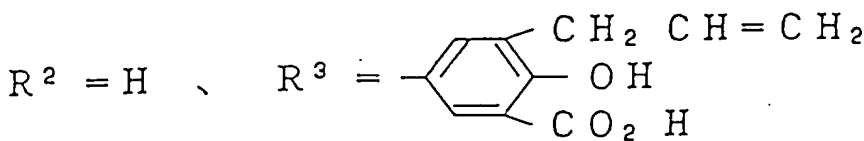
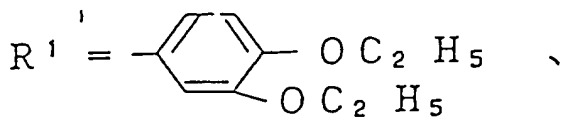
mp : 159 - 160°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (297)

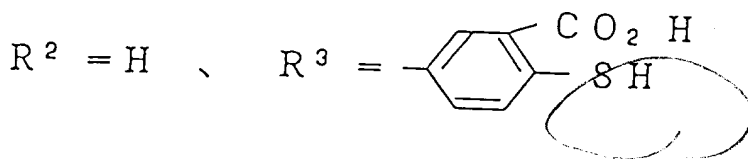
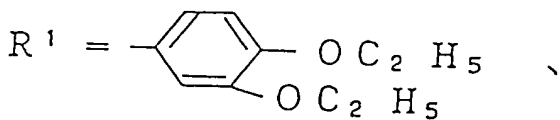
實施例 262 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)

mp : 156 - 157°C 形態：遊離

實施例 263 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀 (從二噁烷和乙醇混液中再結晶)

mp : 283 - 285°C 形態：遊離

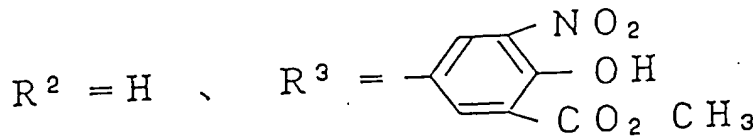
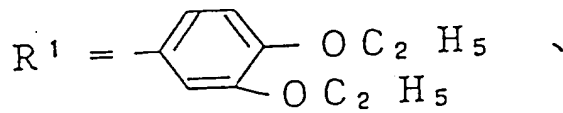
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (298)

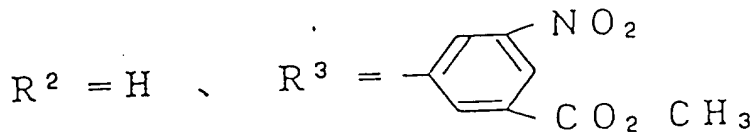
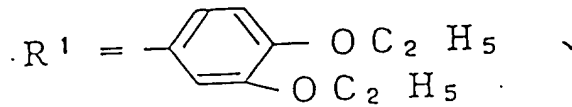
實施例 264 的化合物



結晶形：黃色針狀 (從二氯甲烷和乙醇混液中再結晶)

mp : 194 - 195°C 形態：遊離

實施例 265 的化合物



結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇和氯仿混液中再結晶)

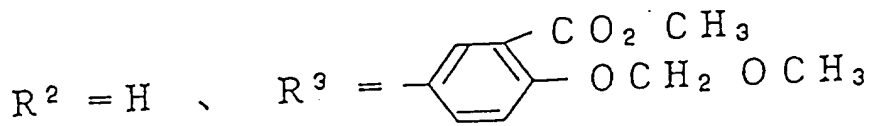
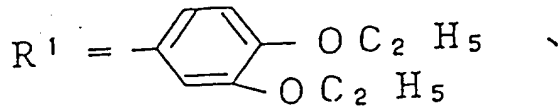
mp : 150.4 - 152°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

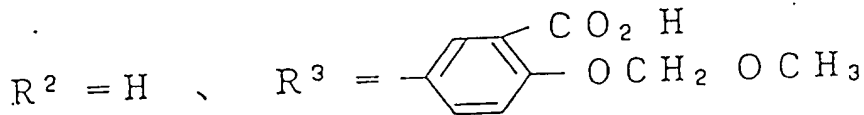
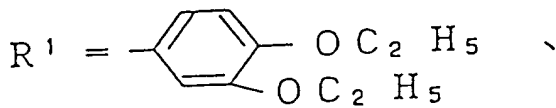
五、發明說明 (299)

實施例 266 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 82 - 83 °C 形態：遊離

實施例 267 的化合物



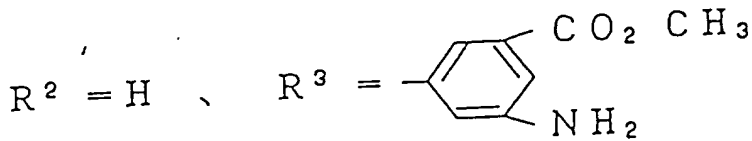
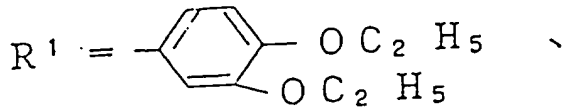
結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 134 - 135 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

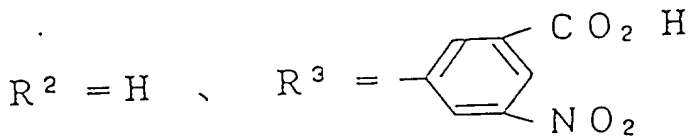
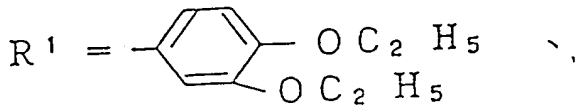
五、發明說明 (300)

實施例 268 的化合物



結晶形：白色針狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 139.8 - 141°C 形態：遊離

實施例 269 的化合物



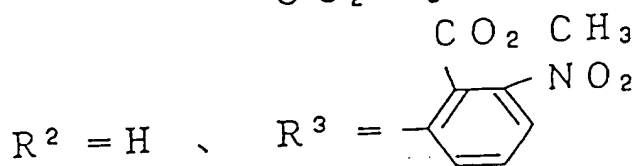
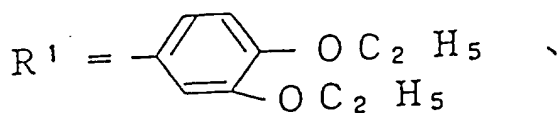
結晶形：褐色粉末狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 247 - 248°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (301)

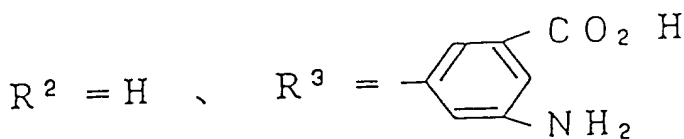
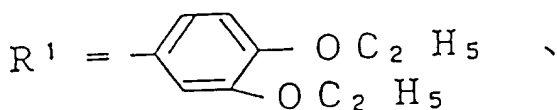
實施例 270 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醚和正己烷混液中再結晶)

mp : 95.8 - 97.4 °C 形態：遊離

實施例 271 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從甲醇和氯仿混液中再結晶)

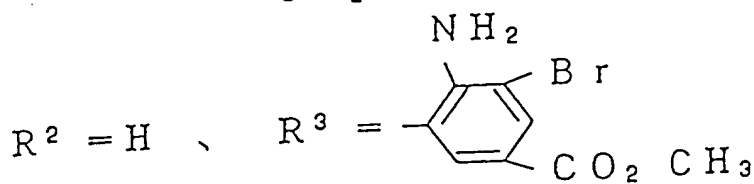
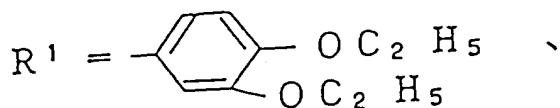
mp : 248 - 258 °C (分解) 形態：2 鹽酸鹽

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

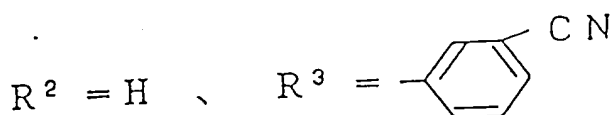
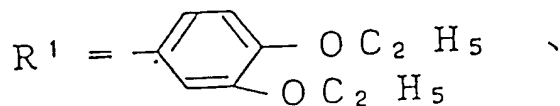
五、發明說明 (302)

實施例 272 的化合物



結晶形：淡黃色針狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 116.6 - 118.2°C 形態：遊離

實施例 273 的化合物



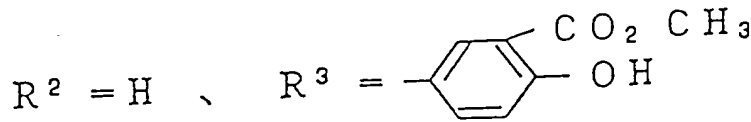
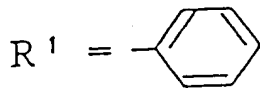
結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 128.6 - 129.2°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

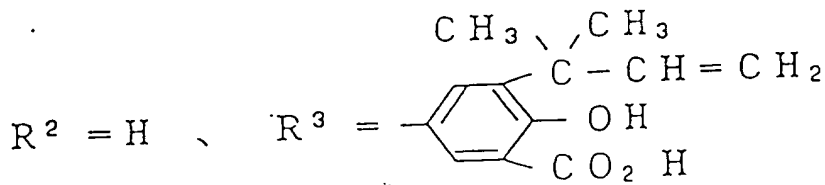
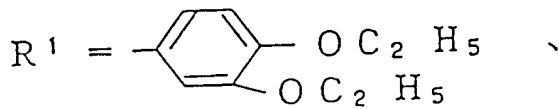
五、發明說明 (303)

實施例 274 的化合物



結晶形：白色稜狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 128.2 - 129°C 形態：遊離

實施例 275 的化合物



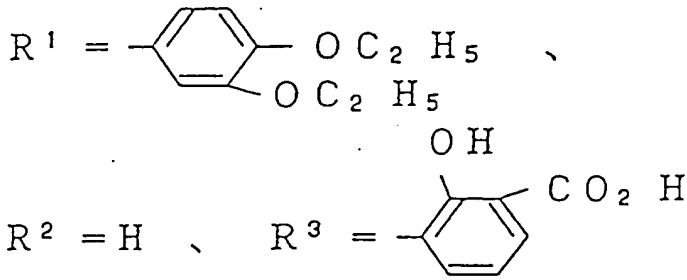
結晶形：淡褐色粒狀-(從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶)
mp : 164 - 165°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

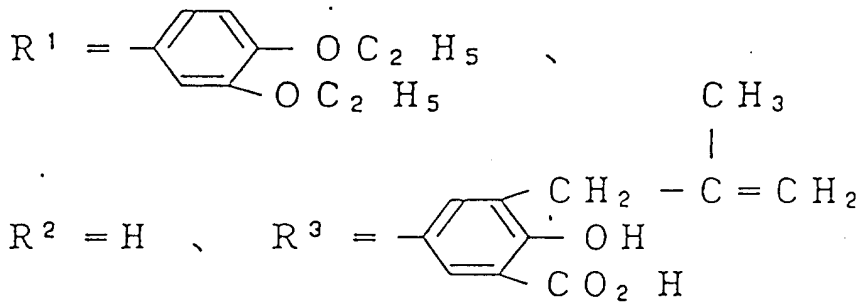
五、發明說明 (304)

實施例 276 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 197 - 198°C 形態：遊離

實施例 277 的化合物



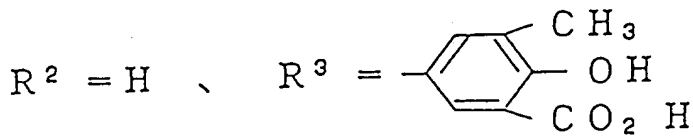
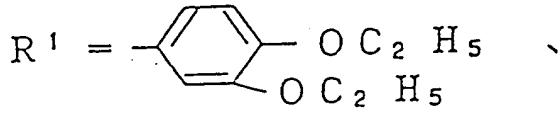
結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶)
mp : 184 - 185°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

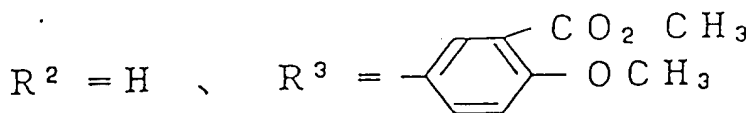
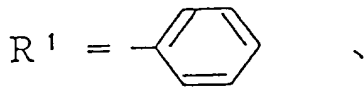
五、發明說明 (305)

實施例 278 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 211 - 212°C 形態：遊離

實施例 279 的化合物



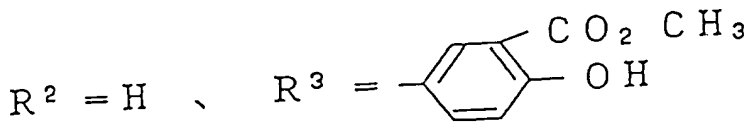
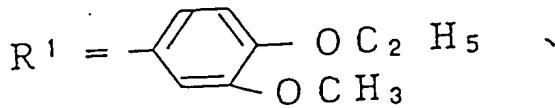
結晶形：白色稜狀 (從甲苯和乙醚混液中再結晶)
mp : 100.6 - 101.4°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (306)

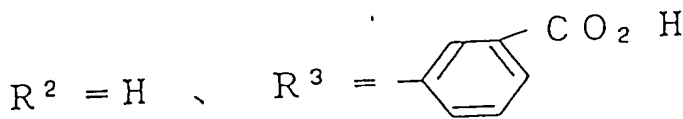
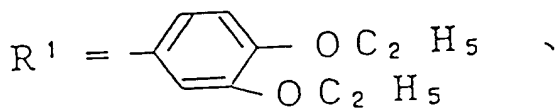
實施例 280 的化合物



結晶形：淡褐色粉末狀（從乙醇和氯仿混液中再結晶）

mp : 138.6—140.6°C 形態：遊離

實施例 281 的化合物



結晶形：淡桃色針狀（從乙醇中再結晶）

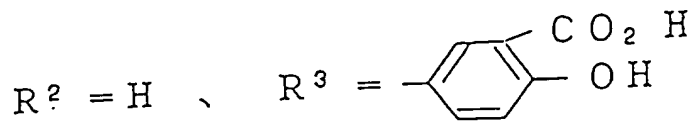
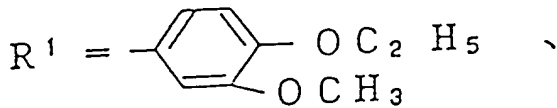
mp : 192—192.8°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

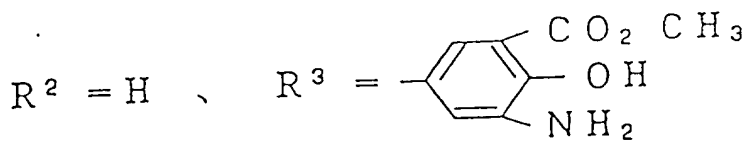
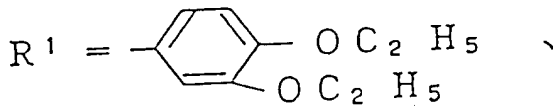
五、發明說明 (307)

實施例 282 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 208.6 - 211.6°C 形態：遊離

實施例 283 的化合物



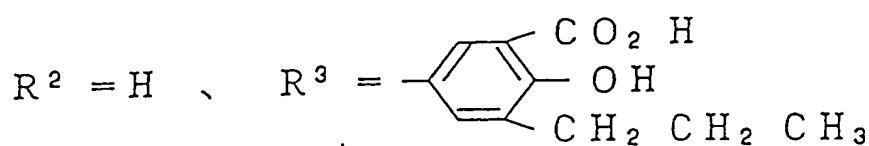
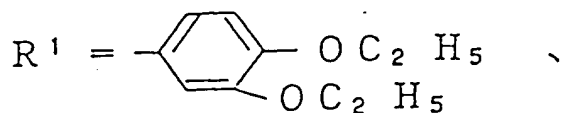
結晶形：白色針狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 135 - 136°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (308)

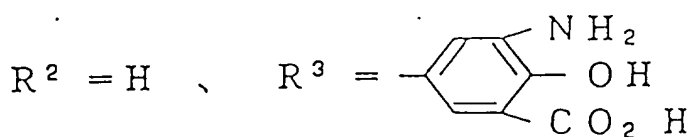
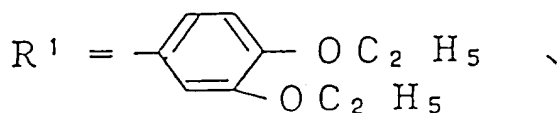
實施例 284 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)

mp. : 179-180°C 形態：遊離

實施例 285 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)

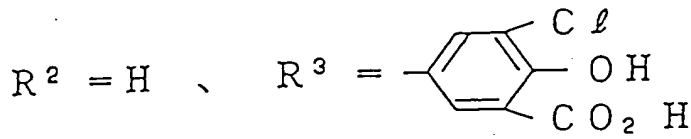
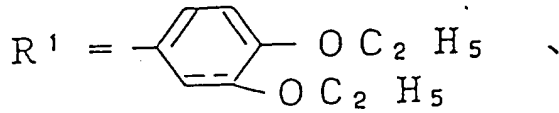
mp : 215-216°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

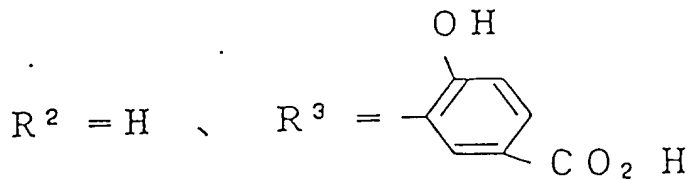
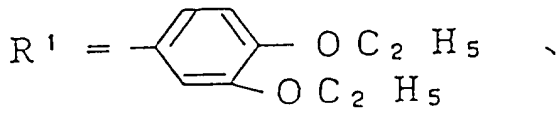
五、發明說明 (309)

實施例 286 的化合物



結晶形：淡綠色針狀 (從甲醇中再結晶)
m.p : 194 - 196.°C 形態：遊離

實施例 287 的化合物



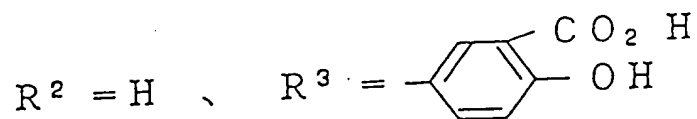
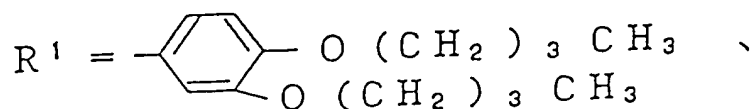
結晶形：白色粉末狀 (從二噁烷中再結晶)
m.p : 272 - 273°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

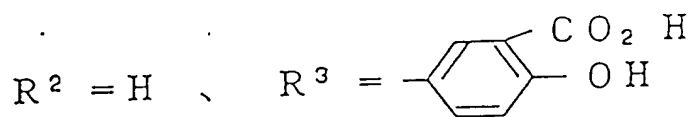
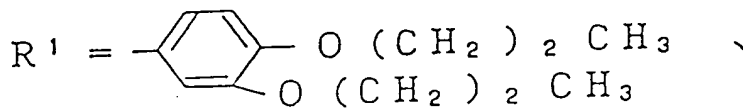
五、發明說明 (310)

實施例 288 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 140.2 - 141.6°C 形態：遊離

實施例 289 的化合物



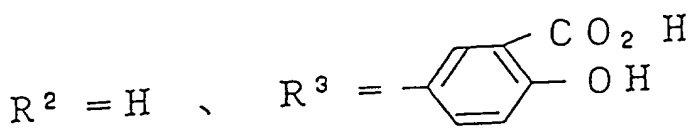
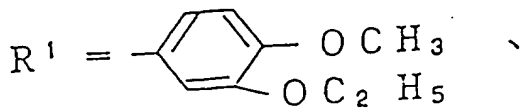
結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 177.6 - 178.8°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

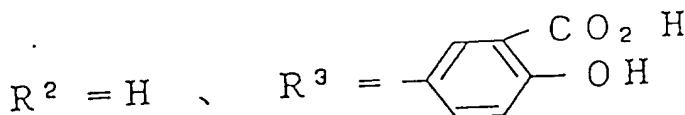
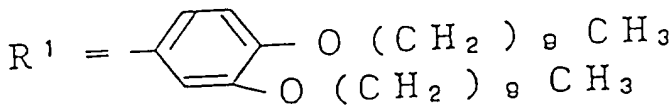
五、發明說明 (311)

實施例 290 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 201.5 - 203.4 °C 形態：遊離

實施例 291 的化合物



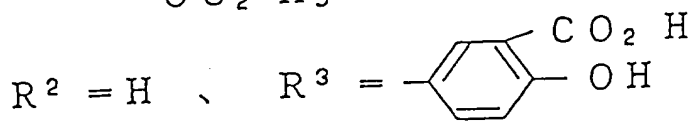
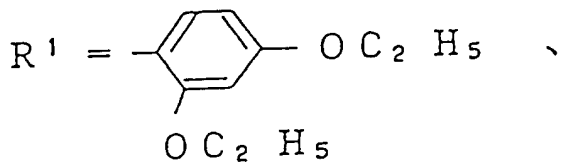
結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 120.2 - 121.6 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

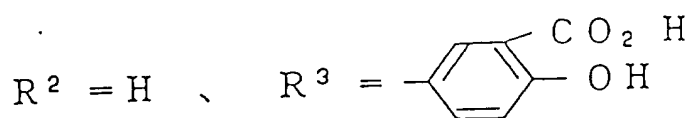
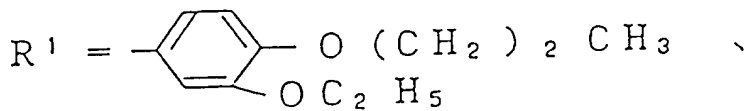
五、發明說明 (312)

實施例 292 的化合物



結晶形：灰色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 224.5 - 226.5°C 形態：遊離

實施例 293 的化合物



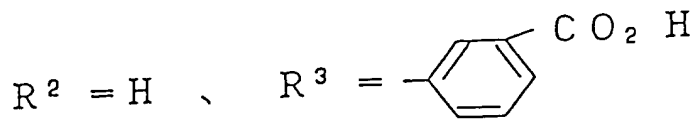
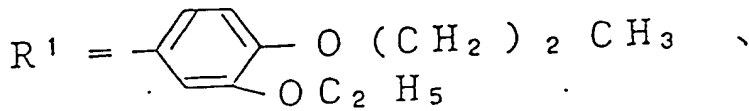
結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 176 - 176.6°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

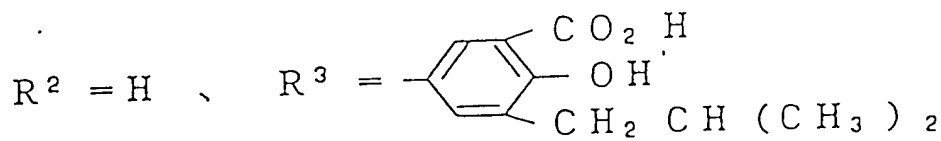
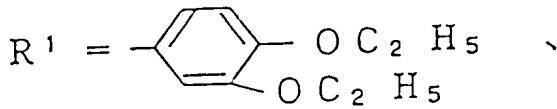
五、發明說明 (313)

實施例 294 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 168.4 - 168.6°C 形態：遊離

實施例 295 的化合物



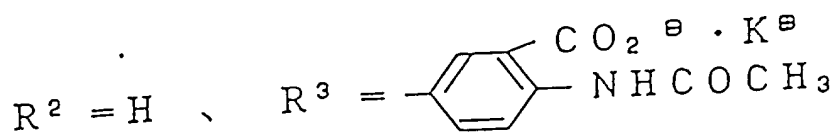
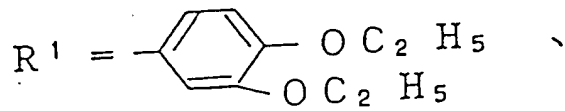
結晶形：白色針狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 180 - 181°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

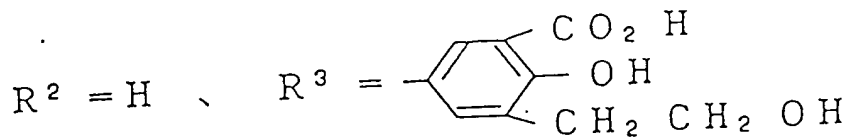
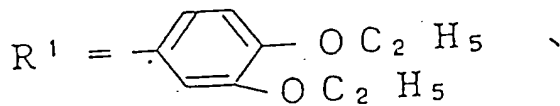
五、發明說明 (314)

實施例 296 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 271 - 273°C 形態：遊離

實施例 297 的化合物



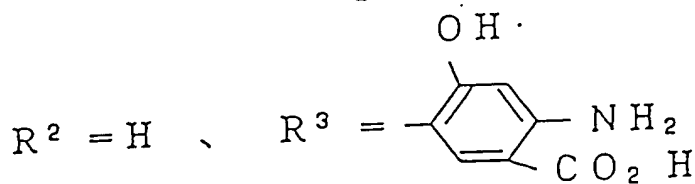
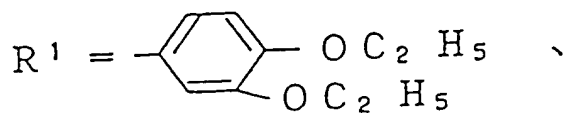
結晶形：淡黃色粉末狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 170 - 171°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (315)

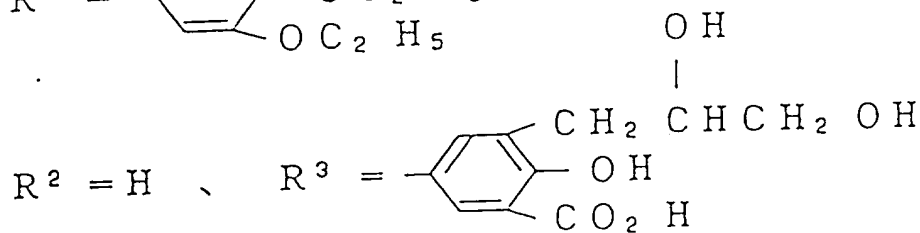
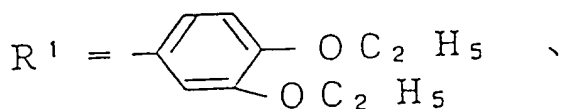
實施例 298 的化合物



結晶形：濃黃色粉末狀 (從乙醇和乙酸乙酯混液中再結晶)

mp : 239 - 243 °C (分解) 形態：遊離

實施例 299 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯中再結晶)

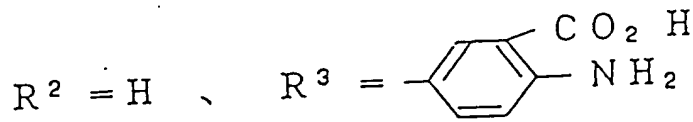
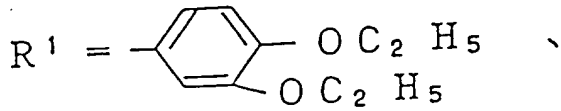
mp : 199 - 200 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

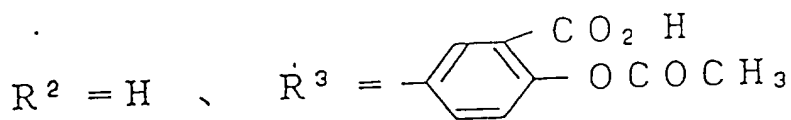
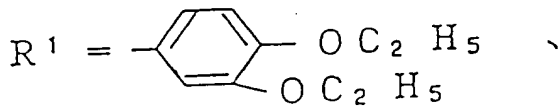
五、發明說明 (316)

實施例 300 的化合物



結晶形：黃色針狀（從乙酸乙酯中再結晶）
mp：228—229°C 形態：遊離

實施例 301 的化合物



結晶形：白色針狀（從乙酸乙酯中再結晶）
mp：178—179°C 形態：遊離

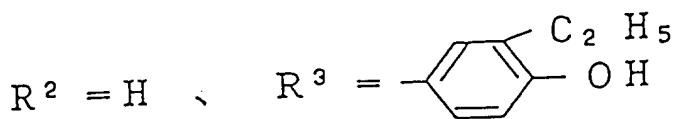
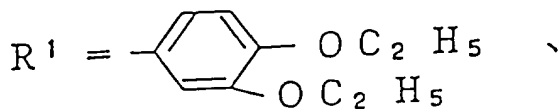
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

· · · · · 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 (317)

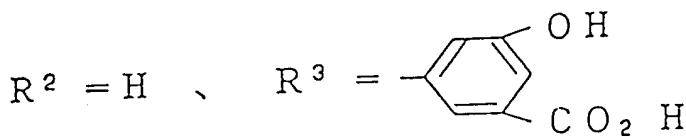
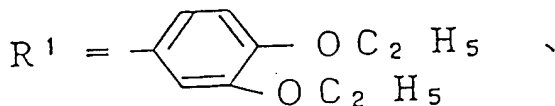
實施例 302 的化合物



結晶形：黃色針狀 (從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶)

mp : 138 - 140°C 形態：遊離

實施例 303 的化合物



結晶形：淡黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)

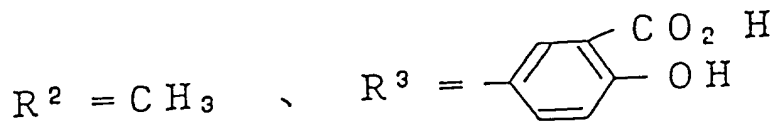
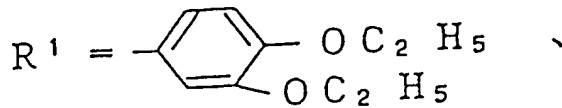
mp : 203.2 - 203.8°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

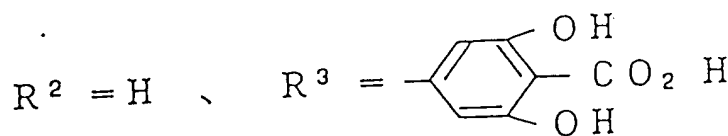
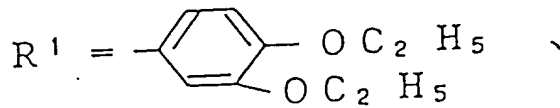
五、發明說明 (318)

實施例 304 的化合物



結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
 mp : 252 - 253°C 形態：遊離

實施例 305 的化合物



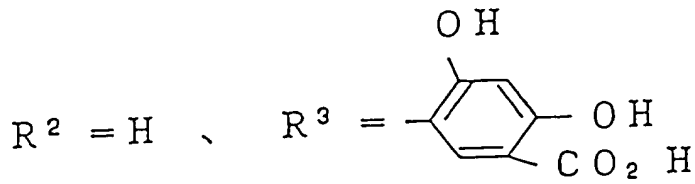
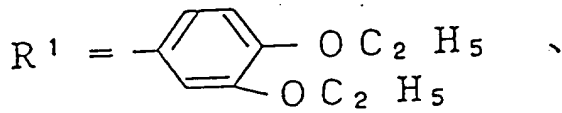
形態：遊離
 NMR : 54)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

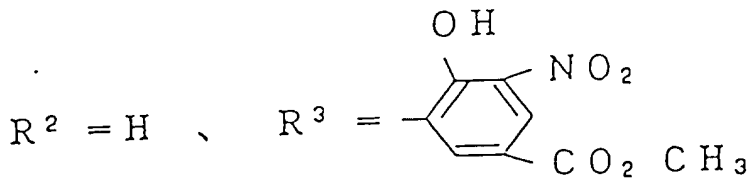
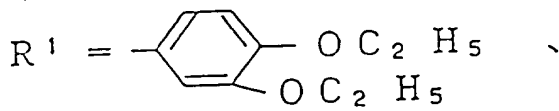
五、發明說明 (319)

實施例 306 的化合物



結晶形：淡褐色板狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 233 - 234 °C 形態：遊離

實施例 307 的化合物



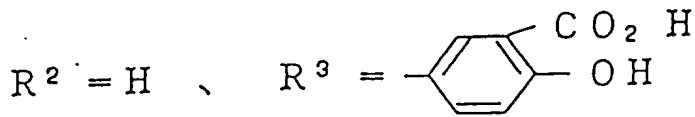
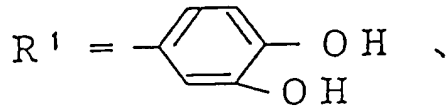
結晶形：淡褐色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 185.8 - 187 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (320)

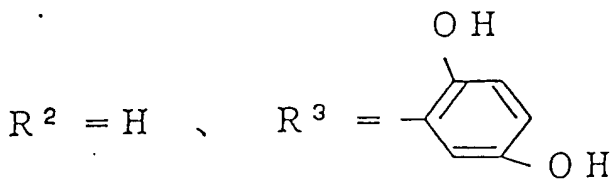
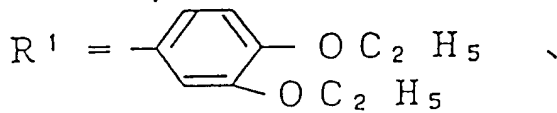
實施例 308 的化合物



結晶形：黃色粉末狀（從乙醇、正己烷和水的混液中再結晶）

mp : 239 - 240. 4 °C 形態：遊離

實施例 309 的化合物



形態：遊離

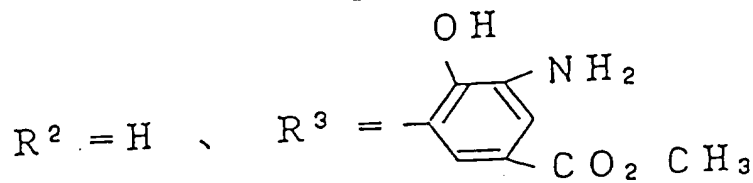
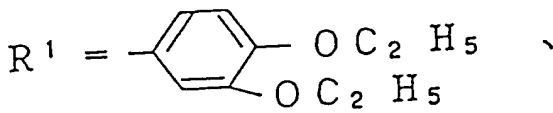
NMR : 55)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

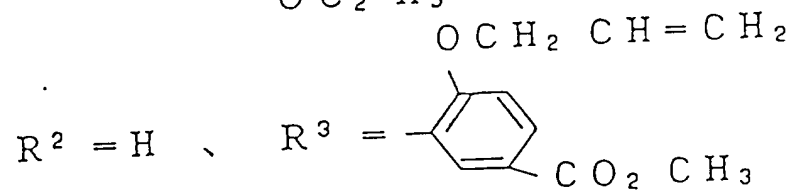
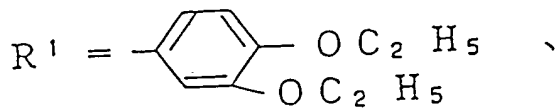
五、發明說明 (321)

實施例 310 的化合物



結晶形：淡黃色針狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 132.8 - 134 °C 形態：遊離

實施例 311 的化合物



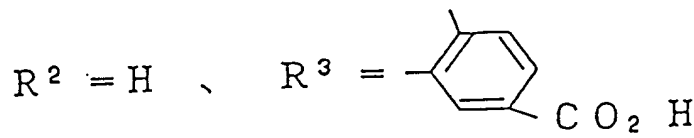
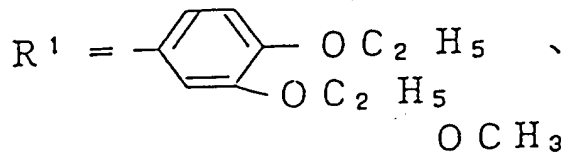
結晶形：白色針狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 92.8 - 94 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

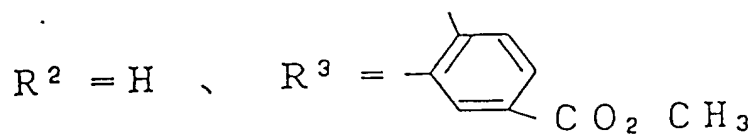
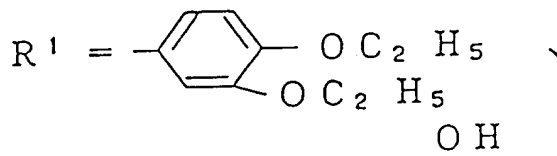
五、發明說明 (322)

實施例 3 1 2 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙酸乙酯中再結晶)
mp : 237.4 - 238.5°C 形態：遊離

實施例 3 1 3 的化合物



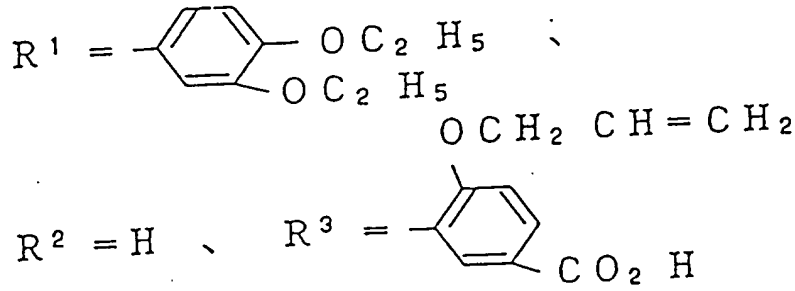
結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 151.8 - 152.5°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

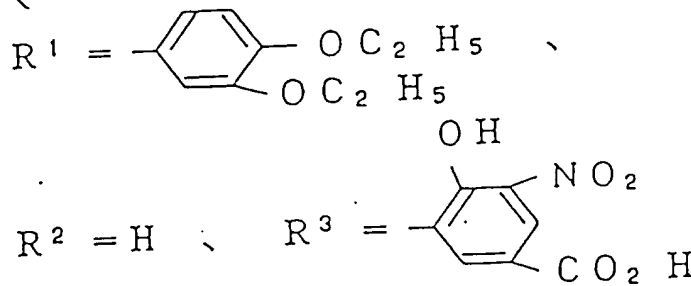
五、發明說明 (323)

實施例 314 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 194 - 195. 2°C 形態：遊離

實施例 315 的化合物



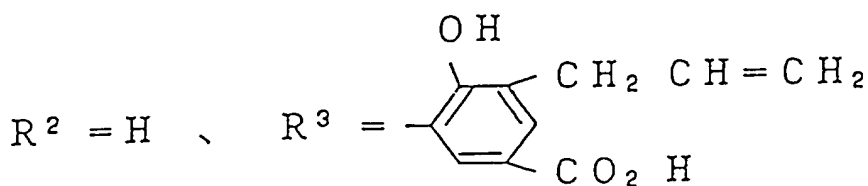
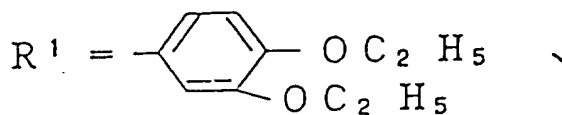
結晶形：淡褐色粉末狀 (從乙酸中再結晶)
mp : 252. 8 - 253. 8°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

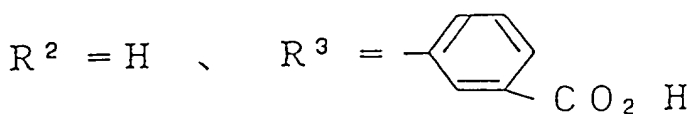
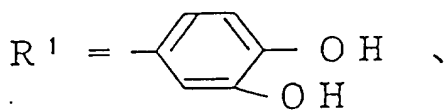
五、發明說明 (324)

實施例 3 1 6 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 251.6 - 252 °C 形態：遊離

實施例 3 1 7 的化合物



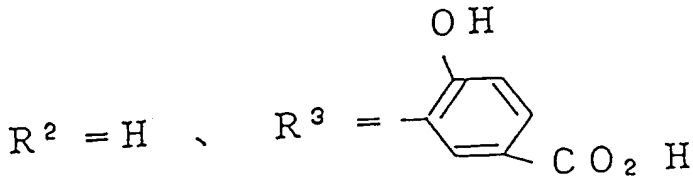
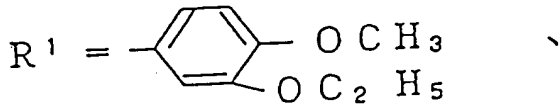
結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 230 - 234.5 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

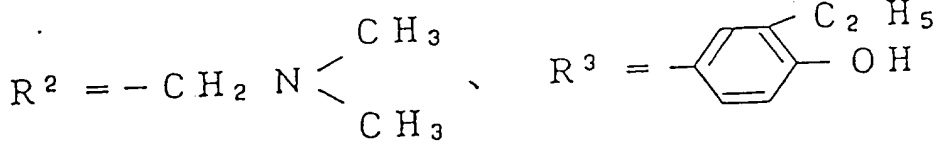
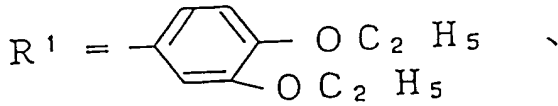
五、發明說明 (325)

實施例 318 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從二噁烷中再結晶)
mp : 270-271°C 形態：遊離

實施例 319 的化合物



結晶形：黃色粉末狀 (從丙酮中再結晶)
mp : 163-168°C 形態：2 鹽酸鹽

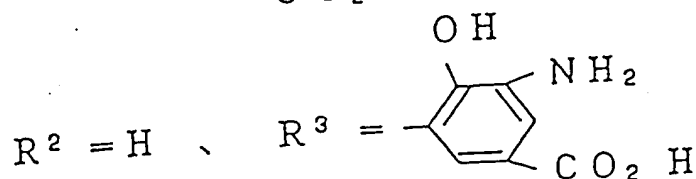
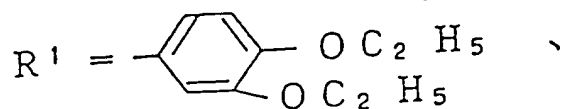
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

..... 裝 訂 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

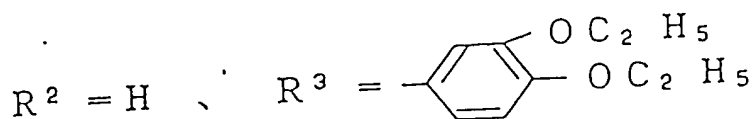
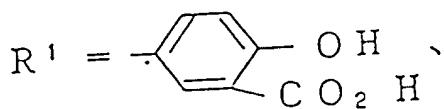
五、發明說明 (326)

實施例 320 的化合物



結晶形：灰色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 264 - 266 °C (分解) 形態：鹽酸鹽

實施例 321 的化合物



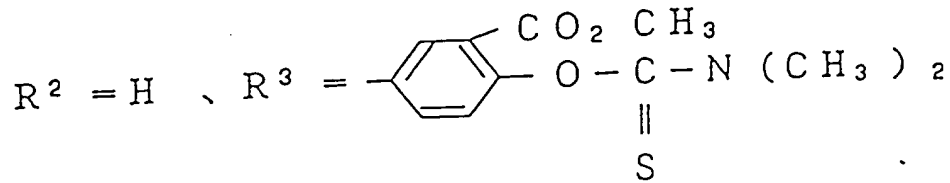
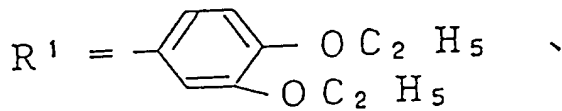
結晶形：白色粉末狀 (從甲醇中再結晶)
mp : 170 - 171 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

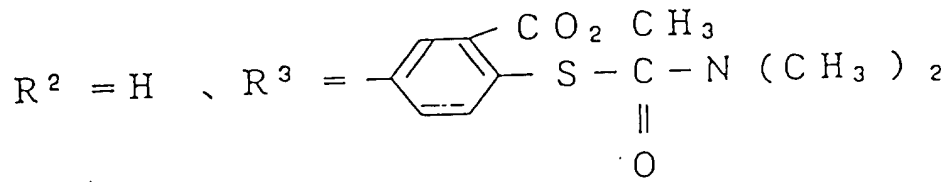
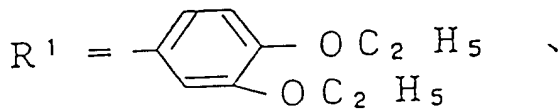
五、發明說明 (327)

實施例 3 2 2 的化合物



形態：遊離
NMR : 31)

實施例 3 2 3 的化合物



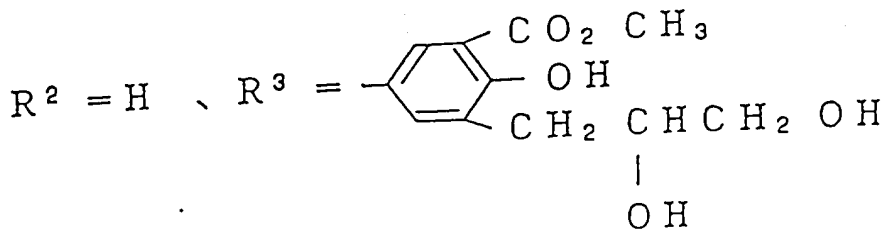
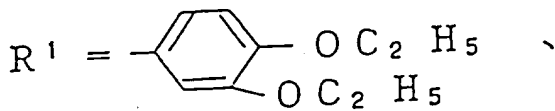
結晶形：黃色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 108—109°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

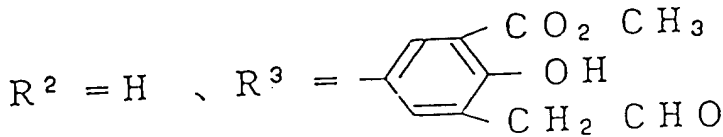
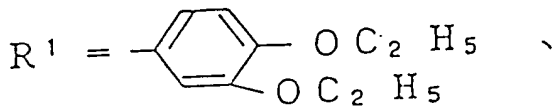
五、發明說明 (328)

實施例 3 2 4 的化合物



形態：遊離
NMR : 32)

實施例 3 2 5 的化合物



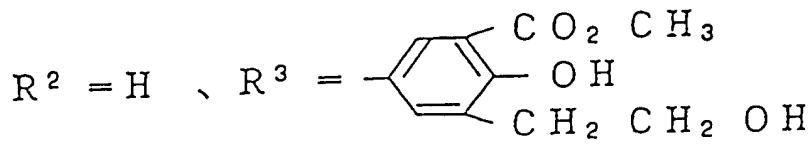
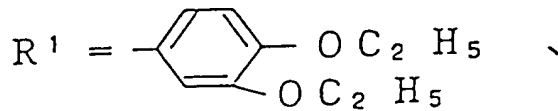
形態：遊離
NMR : 33)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (329)

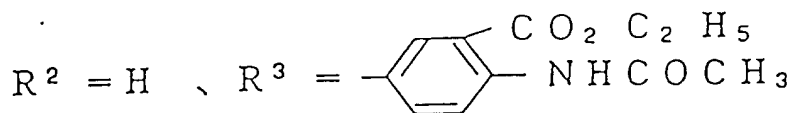
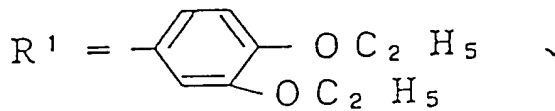
實施例 3 2 6 的化合物



結晶形：淡褐色針狀（從二乙醚中再結晶）

mp : 113 - 114 °C 形態：遊離

實施例 3 2 7 的化合物



形態：遊離

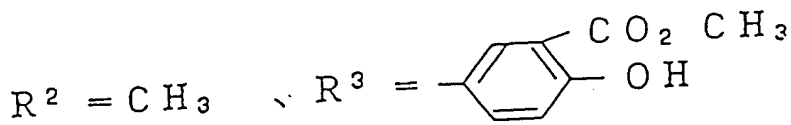
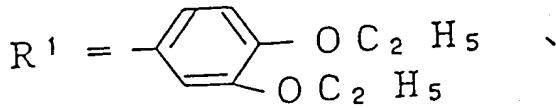
NMR : 34)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

五、發明說明 (330)

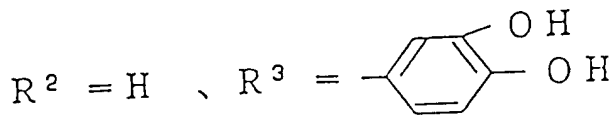
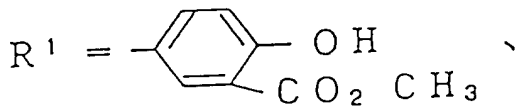
實施例 328 的化合物



結晶形：白色針狀（從二氯甲烷和乙醇混液中再結晶）

mp : 139 - 140°C 形態：遊離

實施例 329 的化合物



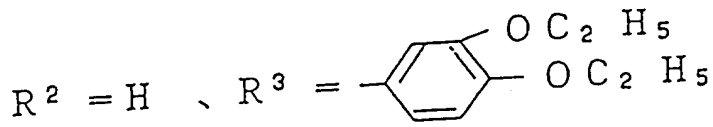
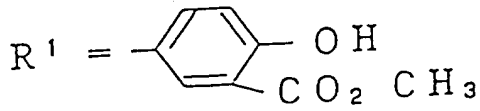
形態：鹽酸鹽
NMR : 35)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

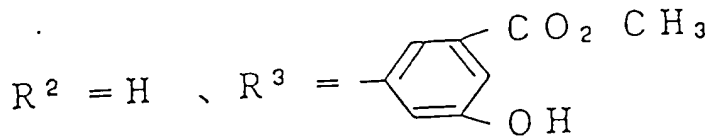
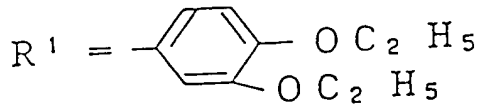
五、發明說明 (331)

實施例 330 的化合物



形態：遊離
NMR :36)

實施例 331 的化合物



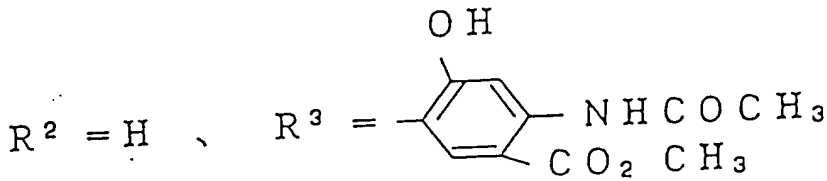
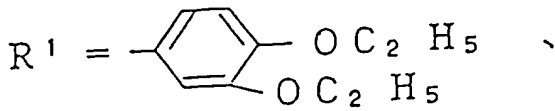
形態：遊離
NMR :37)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

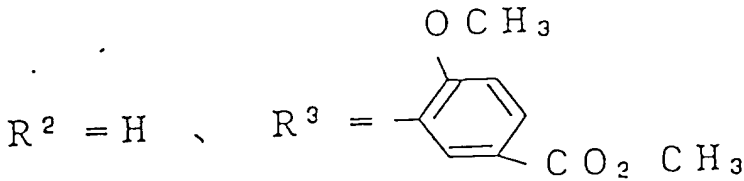
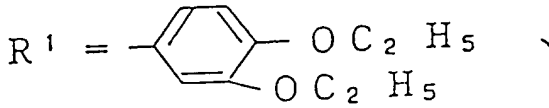
五、發明說明 (332

實施例 3 3 2 的化合物



形態：遊離
NMR :38)

實施例 3 3 3 的化合物



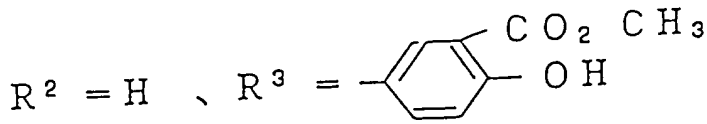
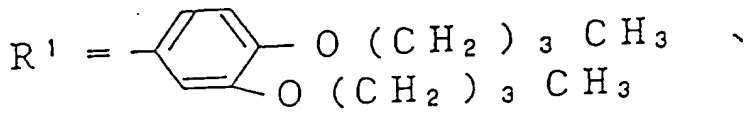
形態：遊離
NMR :39)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

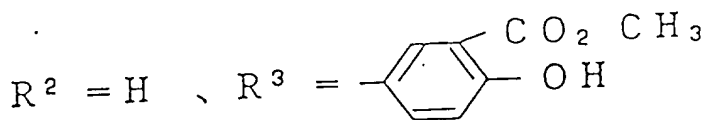
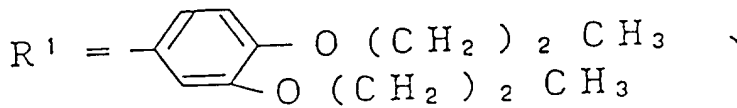
五、發明說明 (333)

實施例 334 的化合物



形態：遊離
NMR：40)

實施例 335 的化合物



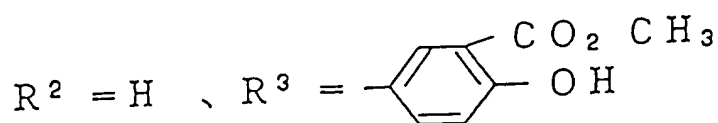
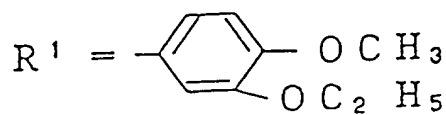
形態：遊離
NMR：41)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

· · · · · 裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

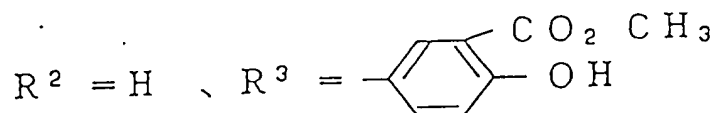
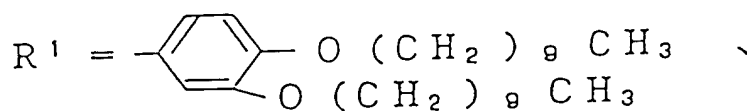
五、發明說明 (334)

實施例 336 的化合物



形態：遊離
NMR：42)

實施例 337 的化合物



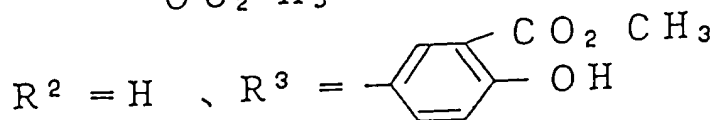
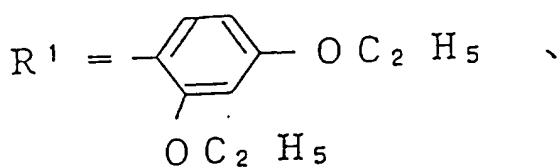
形態：遊離
NMR：43)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

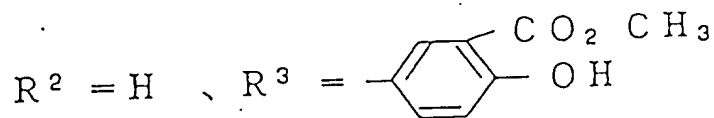
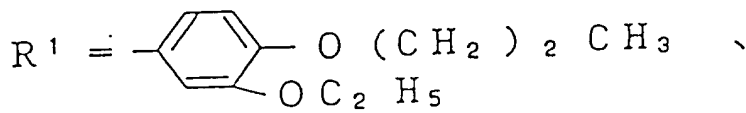
五、發明說明 (335)

實施例 338 的化合物



形態：遊離
NMR：44)

實施例 339 的化合物



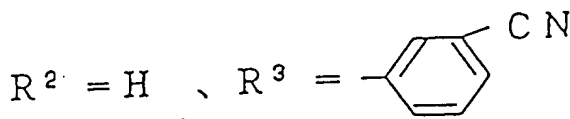
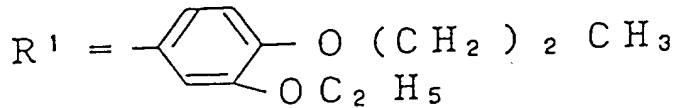
形態：遊離
NMR：45)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

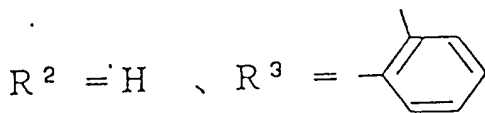
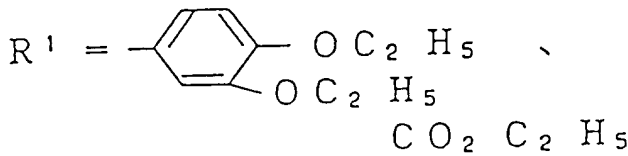
五、發明說明 (336)

實施例 340 的化合物



形態：遊離
NMR：46)

實施例 341 的化合物



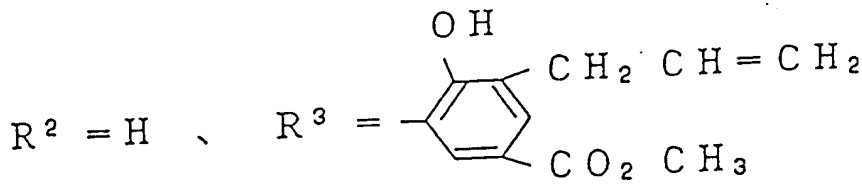
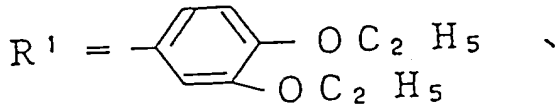
形態：遊離
NMR：47)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

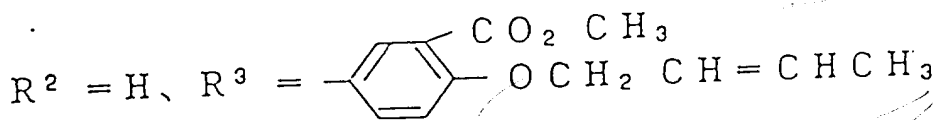
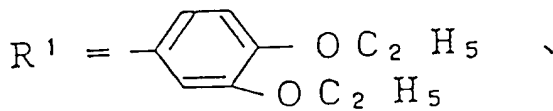
五、發明說明 (337)

實施例 3 4 2 的化合物



形態：遊離
NMR : 48)

實施例 3 4 3 的化合物



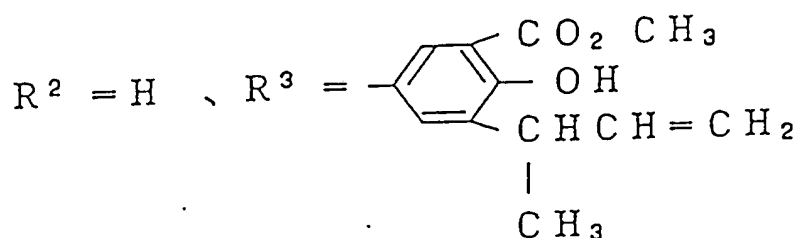
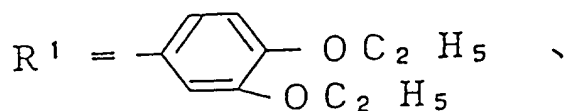
結晶形：白色針狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 103 - 104 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

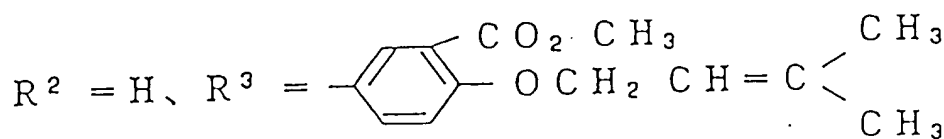
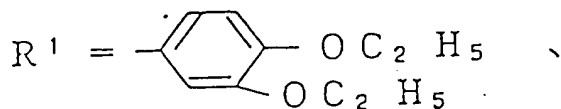
五、發明說明 (338)

實施例 3 4 4 的化合物



結晶形：無色不定形 形態：遊離
NMR : 49)

實施例 3 4 5 的化合物



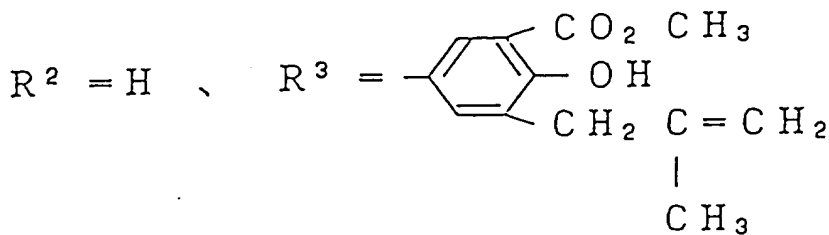
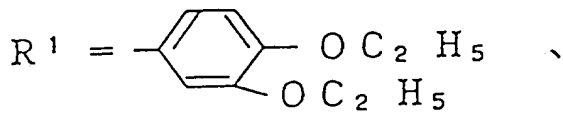
形態：遊離
NMR : 50)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

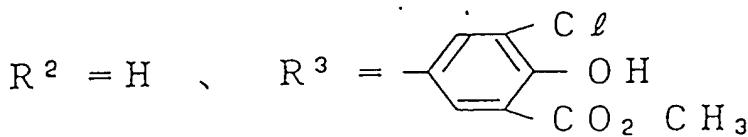
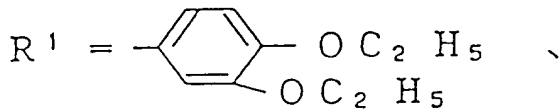
五、發明說明 (340)

實施例 348 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 85 - 86 °C 形態：遊離

實施例 349 的化合物



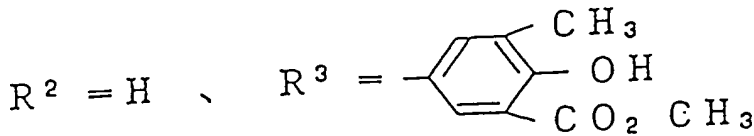
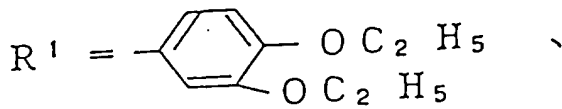
結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 178 - 179 °C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

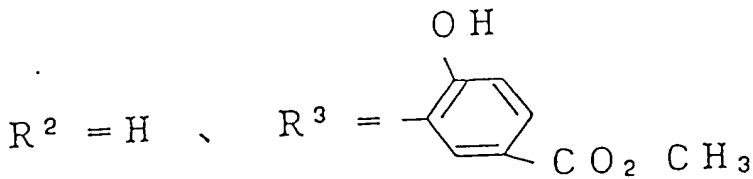
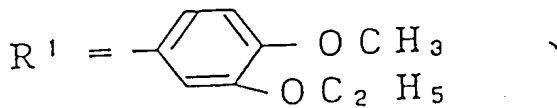
五、發明說明 (341)

實施例 350 的化合物



結晶形：淡褐色板狀 (從乙醇中再結晶)
mp : 149-150°C 形態：遊離

實施例 351 的化合物



形態：遊離
NMR : 53)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (342)

實施例 305、309、322、324、325、
327、329-342、344-347 以及 351 的
化合物的 NMR 資料。

NMR : 31) 實施例 322 的化合物 :

NMR (CDC_l₂) δ :

- 1.49 (3H, t, J = 5.6 Hz)
- 1.52 (3H, t, J = 5.6 Hz)
- 3.08 (3H, s)
- 3.43 (3H, s)
- 3.49 (3H, s)
- 3.67 (3H, s)
- 4.10 - 4.30 (4H, m)
- 6.92 (1H, d, J = 6.7 Hz)
- 7.11 (1H, d, J = 6.7 Hz)
- 7.47 (1H, s)
- 7.52 (1H, dd, J = 1.7 Hz,
6.7 Hz)
- 7.61 (1H, d, J = 1.7 Hz)
- 8.20 (1H, dd, J = 1.8 Hz,
6.4 Hz)
- 8.56 (1H, d, J = 1.8 Hz)

NMR : 32) 實施例 324 的化合物 :

NMR (CDC_l₂) δ :

- 1.50 (3H, t, J = 6.9 Hz)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (343)

- 1 . 5 2 (3 H , t , J = 6 . 9 H z)
- 2 . 2 5 - 2 . 4 0 (1 H , m)
- 2 . 5 9 (1 H , d , J = 5 . 3 H z)
- 2 . 8 6 - 3 . 1 4 (2 H , m)
- 3 . 4 5 - 3 . 8 0 (2 H , m)
- 4 . 0 1 (3 H , s)
- 4 . 0 1 (1 H , b r s)
- 4 . 1 0 - 4 . 3 0 (4 H , m)
- 6 . 9 3 (1 H , d , J = 8 . 3 H z)
- 7 . 3 2 (1 H , s)
- 7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,
8 . 3 H z)
- 7 . 5 9 (1 H , d , J = 2 . 1 H z)
- 8 . 0 2 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)
- 8 . 3 4 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)
- 1 1 . 4 0 (1 H , s)

N M R : 3 3) 實施例 3 2 5 的 化 合 物 :

N M R (C D C l ₂) δ :

- 1 . 5 0 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)
- 1 . 5 2 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)
- 3 . 8 2 (2 H , d , J = 1 . 8 H z)
- 4 . 0 1 (3 H , s)
- 4 . 1 0 - 4 . 3 0 (4 H , m)
- 6 . 9 2 (1 H , d , J = 8 . 4 H z)

(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 (344)

- 7. 33 (1 H, s)
- 7. 54 (1 H, dd, J = 2. 1 Hz,
- 8. 4 Hz)
- 7. 59 (1 H, d, J = 2. 1 Hz)
- 8. 02 (1 H, d, J = 2. 2 Hz)
- 8. 39 (1 H, d, J = 2. 2 Hz)
- 9. 81 (1 H, t, J = 1. 8 Hz)
- 11. 20 (1 H, s)

NMR : 34) 實施例 327 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

- 1. 40 - 1. 60 (9 H, m)
- 2. 26 (3 H, s)
- 3. 16 (2 H, q, J = 7. 0 Hz)
- 4. 23 (2 H, q, J = 7. 0 Hz)
- 4. 44 (2 H, q, J = 7. 1 Hz)
- 6. 93 (1 H, d, J = 8. 4 Hz)
- 7. 40 (1 H, s)
- 7. 54 (1 H, dd, J = 2. 1 Hz,
- 8. 4 Hz)
- 7. 64 (1 H, d, J = 2. 1 Hz)
- 8. 14 (1 H, d, J = 2. 2 Hz,
- 8. 8 Hz)
- 8. 66 (1 H, d, J = 2. 2 Hz)
- 8. 80 (1 H, d, J = 8. 8 Hz)

(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 (345)

1 1 . 2 0 (1 H , s)

N M R : 3 5) 實 施 例 3 2 9 的 化 合 物 :

N M R (D M S O - d ₆) δ :

3 . 9 7 (3 H , s)

6 . 8 2 (1 H , d , J = 8 . 2 H z)

7 . 1 6 (2 H , d , J = 8 . 9 H z)

7 . 3 2 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,
8 . 2 H z)

7 . 4 7 (1 H , d , J = 2 . 1 H z)

7 . 8 0 (1 H , s)

8 . 1 1 (1 H , d d , J = 2 . 4 H z ,
8 . 9 H z)

8 . 3 8 (1 H , d , J = 2 . 4 H z)

1 0 . 8 5 (1 H , b r s)

N M R : 3 6) 實 施 例 3 3 0 的 化 合 物 :

N M R (C D C l ₂) δ :

1 . 3 5 - 1 . 6 0 (6 H , m)

3 . 9 4 (3 H , s)

4 . 1 0 - 4 . 3 0 (4 H , m)

5 . 7 3 (1 H , s)

6 . 9 0 (1 H , d , J = 8 . 3 H z)

7 . 0 3 (1 H , d , J = 8 . 8 H z)

7 . 3 0 (1 H , s)

7 . 4 8 - 7 . 6 5 (2 H , m)

· · · · ·
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)
· · · · ·· · · · ·
裝 · · · · ·
訂 · · · · ·
線 · · · · ·
· · · · ·

五、發明說明 (346)

- 8. 13 (1 H, dd, J = 2.3 Hz,
- 8. 8 Hz)
- 8. 41 (1 H, d, J = 2.3 Hz)

NMR : 37) 實施例 331 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

- 1. 46 (6 H, t, J = 7.0 Hz)
- 3. 92 (3 H, s)
- 4. 07 - 4. 21 (4 H, m)
- 6. 90 (1 H, d, J = 8.4 Hz)
- 7. 15 (1 H, br s)
- 7. 27 - 7. 49 (2 H, m)
- 7. 57 (1 H, d, J = 2.1 Hz)
- 7. 74 (1 H, m)
- 8. 16 (1 H, s)

NMR : 38) 實施例 332 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

- 1. 50 (3 H, t, J = 6.9 Hz)
- 1. 51 (3 H, t, J = 6.9 Hz)
- 3. 93 (3 H, s)
- 4. 11 - 4. 24 (4 H, m)
- 6. 95 (1 H, d, J = 8.2 Hz)
- 7. 44 - 7. 49 (3 H, m)
- 8. 34 (1 H, s)
- 8. 40 (1 H, s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (347)

1 1 . 1 9 (1 H , s)

N M R : 3 9) 實施例 3 3 3 的化合物 :

N M R (C D C l ₃) δ :

1 . 4 9 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)

1 . 5 1 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)

3 . 9 3 (3 H , s)

4 . 0 2 (3 H , s)

4 . 1 0 - 4 . 2 9 (4 H , m)

6 . 9 5 (1 H , d , J = 8 . 3 H z)

7 . 0 5 (1 H , d d , J = 8 . 7 H z)

7 . 5 5 (1 H , d d , J = 2 . 0 H z ,
8 . 3 H z)

7 . 6 4 (1 H , d , J = 2 . 0 H z)

7 . 8 6 (1 H , s)

8 . 0 0 (1 H , d d , J = 2 . 3 H z ,
8 . 7 H z)

9 . 0 5 (1 H , d , J = 2 . 3 H z)

N M R : 4 0) 實施例 3 3 4 的化合物 :

N M R (C D C l ₃) δ :

1 . 0 0 (3 H , t , J = 7 . 3 H z)

1 . 0 1 (3 H , t , J = 7 . 3 H z)

1 . 5 1 - 1 . 5 8 (4 H , m)

1 . 8 1 - 1 . 9 0 (4 H , m)

4 . 0 1 (3 H , s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (349)

8. 8 H z)

8. 4 5 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)

1 0 . 8 6 (1 H , s)

N M R : 4 2) 實施例 3 3 6 的化合物 :

N M R (C D C l ₃) δ :

1 . 5 4 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)

3 . 9 4 (3 H , s)

4 . 0 1 (3 H , s)

4 . 2 6 (2 H , q , J = 7 . 0 H z)

6 . 9 5 (1 H , d , J = 8 . 4 H z)

7 . 0 9 (1 H , d , J = 8 . 6 H z)

7 . 3 2 (1 H , s)

7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 0 H z ,

8 . 4 H z)

7 . 6 0 (1 H , d , J = 2 . 0 H z)

8 . 0 9 (1 H , d , J = 2 . 2 H z ,

8 . 6 H z)

8 . 4 5 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)

1 0 . 8 6 (1 H , s)

N M R : 4 3) 實施例 3 3 7 的化合物 :

N M R (C D C l ₃) δ :

0 . 8 8 (6 H , t , J = 6 . 4 H z)

1 . 2 7 (2 8 H , b r s)

1 . 4 0 - 1 . 6 3 (4 H , m)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (350)

1. 78 - 1. 91 (4 H, m)
 3. 99 (3 H, s)
 4. 01 - 4. 15 (4 H, m)
 6. 93 (1 H, d, $J = 8.4 \text{ Hz}$)
 7. 08 (1 H, d, $J = 8.6 \text{ Hz}$)
 7. 30 (1 H, s)
 7. 51 (1 H, dd, $J = 2.2 \text{ Hz}$,
 8. 4 Hz)
 7. 59 (1 H, d, $J = 2.2 \text{ Hz}$)
 8. 07 (1 H, dd, $J = 2.2 \text{ Hz}$,
 8. 6 Hz)
 8. 43 (1 H, d, $J = 2.2 \text{ Hz}$)
 10. 86 (1 H, s)

NMR : 44) 實施例 338 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

1. 45 (3 H, t, $J = 7.0 \text{ Hz}$)
 1. 62 (3 H, t, $J = 7.0 \text{ Hz}$)
 4. 01 (3 H, s)
 4. 09 (2 H, q, $J = 7.0 \text{ Hz}$)
 4. 22 (2 H, q, $J = 7.0 \text{ Hz}$)
 6. 55 (1 H, d, $J = 2.4 \text{ Hz}$)
 6. 61 (1 H, dd, $J = 2.4 \text{ Hz}$,
 8. 8 Hz)
 7. 08 (1 H, d, $J = 8.8 \text{ Hz}$)

.....
 (請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
 裝.....

.....
 訂.....

.....
 線.....

五、發明說明 (351)

7.37 (1 H, s)

8.10 (1 H, dd, J = 2.4 Hz,
8.8 Hz)

8.46 (1 H, d, J = 8.8 Hz)

8.49 (1 H, d, J = 2.4 Hz)

10.84 (1 H, s)

NMR : 45) 實施例 339 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

1.07 (3 H, t, J = 7.5 Hz)

1.50 (3 H, t, J = 6.8 Hz)

1.80 - 2.10 (2 H, m)

4.00 (3 H, s)

4.12 - 4.47 (4 H, m)

6.95 (1 H, d, J = 8.4 Hz)

7.09 (1 H, d, J = 8.6 Hz)

7.31 - 7.49 (1 H, m)

7.50 - 7.77 (2 H, m)

8.13 - 8.27 (1 H, m)

8.45 (1 H, s)

10.86 (1 H, s)

NMR : 46) 實施例 340 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

1.07 (3 H, t, J = 7.4 Hz)

1.52 (3 H, t, J = 7.0 Hz)

.....
(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 (352)

1. 85 - 1. 96 (2 H, m)
 4. 04 (2 H, d, J = 6. 7 Hz)
 4. 25 (2 H, q, J = 7. 0 Hz)
 6. 95 (1 H, d, J = 8. 3 Hz)
 7. 49 - 7. 63 (5 H, m)
 8. 16 - 8. 20 (1 H, m)
 8. 34 (1 H, s)

NMR : 47) 實施例 341 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

1. 05 (3 H, t, J = 7. 1 Hz)
 1. 43 (3 H, t, J = 7. 0 Hz)
 1. 46 (3 H, t, J = 7. 0 Hz)
 4. 02 - 4. 22 (6 H, m)
 6. 87 (1 H, d, J = 8. 4 Hz)
 7. 34 - 7. 49 (3 H, m)
 7. 58 - 7. 62 (2 H, m)
 7. 63 - 7. 74 (1 H, m)

NMR : 48) 實施例 342 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

1. 50 (3 H, t, J = 7. 0 Hz)
 1. 52 (3 H, t, J = 7. 0 Hz)
 3. 54 (2 H, d, J = 6. 6 Hz)
 3. 92 (3 H, s)
 4. 12 - 4. 26 (4 H, m)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (353)

- 5. 09 - 5. 18 (2 H, m)
- 6. 09 - 6. 12 (1 H, m)
- 6. 96 (1 H, d, J = 8. 3 Hz)
- 7. 45 (2 H, d, J = 2. 0 Hz)
- 7. 49 (1 H, dd, J = 2. 0 Hz, 8. 3 Hz)
- 7. 54 (1 H, s)
- 7. 84 (1 H, d, J = 2. 2 Hz)
- 8. 28 (1 H, d, J = 2. 2 Hz)
- 12. 84 (1 H, s)

NMR : 49) 實施例 344 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

- 1. 42 (3 H, d, J = 7. 0 Hz)
- 1. 50 (3 H, t, J = 7. 0 Hz)
- 1. 52 (3 H, t, J = 7. 0 Hz)
- 4. 00 (3 H, s)
- 4. 10 - 4. 33 (4 H, m)
- 5. 07 - 5. 23 (2 H, m)
- 6. 03 - 6. 25 (1 H, m)
- 6. 93 (1 H, d, J = 8. 3 Hz)
- 7. 31 (1 H, s)
- 7. 50 - 7. 66 (2 H, m)
- 7. 94 (1 H, d, J = 2. 2 Hz)
- 8. 33 (1 H, d, J = 2. 3 Hz)

(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 (354)

1 1 . 2 6 (1 H , s)

N M R : 5 0) 實施例 3 4 5 的 化 合 物 :

N M R (C D C l ₃) δ :

1 . 4 9 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)

1 . 5 1 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)

1 . 7 8 (6 H , d , J = 6 . 7 H z)

3 . 9 3 (3 H , s)

4 . 1 0 - 4 . 3 0 (4 H , m)

4 . 6 8 (2 H , d , J = 6 . 3 H z)

5 . 4 2 - 5 . 6 2 (1 H , m)

6 . 9 2 (1 H , d , J = 8 . 4 H z)

7 . 0 4 (1 H , d , J = 8 . 8 H z)

7 . 3 4 (1 H , s)

7 . 5 2 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,

8 . 3 H z)

7 . 6 1 (1 H , d , J = 2 . 0 H z)

8 . 1 0 (1 H , d d , J = 2 . 4 H z ,

8 . 7 H z)

8 . 3 6 (1 H , d , J = 2 . 3 H z)

N M R : 5 1) 實施例 3 4 6 的 化 合 物 :

N M R (C D C l ₃) δ :

1 . 4 9 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)

1 . 4 9 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)

3 . 9 8 (3 H , s)

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)
.....

裝
.....
訂
.....
線
.....

五、發明說明 (395)

- 4 . 0 5 - 4 . 3 0 (4 H , m)
 5 . 0 1 (1 H , d d , J = 1 . 2 H z ,
 5 . 8 H z)
 5 . 0 8 (1 H , s)
 6 . 2 3 - 6 . 4 3 (1 H , m)
 6 . 9 2 (1 H , d , J = 8 . 4 H z)
 7 . 3 0 (1 H , s)
 7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,
 8 . 3 H z)
 7 . 6 1 (1 H , d , J = 2 . 0 H z)
 8 . 1 0 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)
 8 . 3 4 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)
 1 1 . 6 0 (1 H , s)

N M R : 5 2) 實施例 3 4 7 的化合物 :

N M R (C D C l ₂) δ :

- 1 . 4 9 (3 H , t , J = 6 . 9 H z)
 1 . 5 1 (3 H , t , J = 6 . 9 H z)
 1 . 8 7 (3 H , s)
 3 . 9 4 (3 H , s)
 4 . 1 0 - 4 . 3 0 (4 H , m)
 4 . 5 6 (2 H , s)
 5 . 0 3 (1 H , b r s)
 5 . 2 2 (1 H , b r s)
 6 . 9 1 (1 H , d , J = 8 . 4 H z)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (356)

7. 02 (1 H, d, J = 8. 8 H z)

7. 34 (1 H, s)

7. 52 (1 H, d d, J = 2. 1 H z,
8. 4 H z)

7. 61 (1 H, d, J = 2. 1 H z)

8. 10 (1 H, d d, J = 2. 4 H z,
8. 8 H z)

8. 39 (1 H, d, J = 2. 4 H z)

NMR : 53) 實施例 351 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

1. 53 (3 H, t, J = 7. 0 H z)

3. 92 (3 H, s)

3. 95 (3 H, s)

4. 21 (2 H, q, J = 7. 0 H z)

6. 95 (1 H, d, J = 8. 4 H z)

7. 05 (1 H, d, J = 8. 6 H z)

7. 45 (1 H, d, J = 2. 1 H z)

7. 52 (1 H, d d, J = 2. 1 H z,
8. 4 H z)

7. 64 (1 H, s)

7. 95 (1 H, d d, J = 2. 1 H z,

8. 6 H z)

8. 39 (1 H, d, J = 2. 1 H z)

12. 66 (1 H, s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (357)

NMR : 54) 實施例 305 的化合物 :

NMR (DMSO - d₆) δ :

1.38 (3H, t, J = 7.0 Hz)

1.40 (3H, t, J = 6.9 Hz)

4.07 - 4.27 (4H, m)

6.81 (2H, s)

7.08 (1H, q, J = 8.3 Hz)

7.48 - 7.58 (2H, m)

8.04 (1H, s)

14.77 (2H, s)

NMR : 55) 實施例 309 的化合物 :

NMR (CDCl₃) δ :

1.50 (3H, t, J = 7.0 Hz)

1.51 (3H, t, J = 7.0 Hz)

4.10 - 4.33 (4H, m)

實施例 352

懸濁 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羥基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) 噻唑 (1 g) 以及碳酸鉀 (0.35 g) 於二甲基甲醯胺 (10 ml) 中, 在室溫下攪拌 30 分鐘。然後加入溴化乙酸甲酯 (0.46 g), 在同溫下攪拌 4 小時。蒸餾去除溶劑, 殘渣用二氯甲烷 (40 ml) 萃取之。再用水 (10 ml) 和飽和食鹽水 (10 ml) 洗淨, 硫酸鎂乾燥後, 蒸餾去除溶劑。所得殘

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (358)

渣用二異丙醚再結晶處理而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 甲氧基羰基甲氧基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) 噻唑 1. 1 g。

無色針狀結晶

熔點：96 ~ 97 °C

按照實施例 352 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 1, 6, 23, 26 ~ 81, 92, 94 ~ 96, 101 ~ 108, 112, 115, 118, 121, 124, 125 ~ 128, 130 ~ 133, 135, 136, 154 ~ 165, 167 ~ 227, 229 ~ 234, 253 ~ 273, 275 ~ 307, 309 ~ 316, 318 ~ 328, 330 ~ 351 的化合物。

實施例 353

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 丙烯基氧基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) 噻唑 (1 g) 的鄰 - 二氯苯 (25 ml) 溶液經加熱還流 15 小時。反應結束後，蒸餾去除溶劑，所得殘渣從二異丙醚中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 丙烯基苯基) 噻唑 1 g。

無色稜狀晶。

熔點：118 ~ 119 °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 (359)

按照本實施例 3 5 3 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 2 6 2，2 7 5，2 7 7，3 1 6，3 4 2，3 4 4，3 4 6，3 4 8 的化合物。

實施例 3 5 4

將 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 二甲基胺基羰基硫基羰基氧基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) 噻唑 (4.9 g) 在無溶劑下，以 170 °C 加熱攪拌 5 小時。經矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷) 精製後，從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 二甲基胺基羰基硫基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) 噻唑 2.83 g。

黃色粉末狀

熔點：108 ~ 109 °C

實施例 3 3 5

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基 - 4 - (4 - 二甲基胺基羰基硫基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) 噻唑 (250 mg) 的乙醇 (5 ml) 溶液中，加入 10% 氫氧化鉀 (1 ml)，加熱還流 8 小時。蒸餾去除溶劑，所得殘渣用熱乙酸乙酯 (40 ml) 萃取，以 10% 鹽酸酸性處理後，用水 (5 ml)，飽和食鹽水 (10 ml) 洗淨，乾燥之。蒸餾去除溶劑所得殘渣從二噁烷和乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 氫硫基 - 2

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (360)

— 羧基苯基) 噻唑 1 3 0 m g。

淡褐色粉末狀

熔點：2 8 3 ~ 2 8 5 °C

實施例 3 5 6

含有 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羧基) - 4 - 羥基 - 4 - 丙烯基苯基) 噻唑 (1 g) 的甲醇 (2 0 m l) 和四氫呋喃 (2 0 m l) 溶液中，加入四氧化鐵 (4 % 水溶液 0 . 5 m l) 以及 4 - 甲基嗎啉 N - 氧化物 (1 . 2 g) ，在室溫下攪拌 4 小時後蒸餾去除溶劑。所得殘渣用二氯甲烷 (5 0 m l) 和水 (2 5 m l) 分液後，再以飽和食鹽水 (2 5 m l) 洗淨，乾燥，蒸餾去除溶劑，所得殘渣用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷 / 甲醇 = 1 9 9 / 1) 精製而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 甲氧基羧基 - 4 - 羥基 - 5 - (2 , 3 - 二羥基丙基) 苯基] 噻唑 8 6 0 m g 。

$^1\text{H-NMR}$ (C D C l ₂) δ :

1 . 5 0 (3 H , t , J = 6 . 9 H z)

1 . 5 2 (3 H , t , J = 6 . 9 H z)

2 . 2 5 - 2 . 4 0 (1 H , m)

2 . 5 9 (1 H , d , J = 5 . 3 H z)

2 . 8 6 - 3 . 1 4 (2 H , m)

3 . 4 5 - 3 . 8 0 (2 H , m)

4 . 0 1 (3 H , s)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (361)

4. 01 (1 H, b r s)
 4. 10 - 4. 30 (4 H, m)
 6. 93 (1 H, d, J = 8. 3 H z)
 7. 32 (1 H, s)
 7. 54 (1 H, d d, J = 2. 1 H z ,
 8. 3 H z)
 7. 59 (1 H, d, J = 2. 1 H z)
 8. 02 (1 H, d, J = 2. 1 H z)
 8. 34 (1 H, d, J = 2. 2 H z)
 11. 40 (1 H, s)

實施例 357

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 丙烯基苯基) 噻唑 (2 g) 的四氫呋喃 (100 ml) 以及水 (15 ml) 的溶液中，加入四氧化鐵 (4% 水溶液, 2.5 ml) 以及偏過碘酸鈉 (3.9 g)，在室溫下攪拌 14 小時。反應結束後，蒸餾去除溶劑，所得殘渣用二氯甲烷 (60 ml) 和水 (30 ml) 分液萃取，乾燥後，蒸餾去除溶劑，所得殘渣利用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷) 精製而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 甲醯基甲基苯基) 噻唑 1.33 g。

¹H - 核磁氣共振譜 (C D C l₂) δ :

1. 50 (3 H, t, J = 7. 0 H z)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (362)

- 1 . 5 2 (3 H , t , J = 7 . 0 H z)
 3 . 8 2 (1 H , d , J = 1 . 8 H z)
 4 . 0 1 (3 H , s)
 4 . 1 0 - 4 . 3 0 (4 H , m)
 6 . 9 2 (1 H , d , J = 8 . 4 H z)
 7 . 3 3 (1 H , s)
 7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,
 8 . 4 H z)
 7 . 5 9 (1 H , d , J = 2 . 1 H z)
 8 . 0 2 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)
 8 . 3 9 (1 H , d , J = 2 . 2 H z)
 9 . 8 1 (1 H , t , J = 1 . 8 H z)
 1 1 . 2 0 (1 H , s)

實施例 3 5 8

含有 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲
 氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 甲醯基甲基苯基) 噻唑 (
 1 . 3 g) 的甲醇 (3 0 m l) 溶液在冰冷攪拌中，加入
 氫化硼鈉 (1 1 1 m g) ，同溫度下攪拌 3 0 分鐘。反應
 結束後，蒸餾去除溶劑，所得殘渣用矽膠柱管層析法 (溶
 出液：二氯甲烷 / 正己烷 = 4 / 1) 精製。從乙醚中再結
 晶而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 甲氧
 基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - (2 - 羥乙基) 苯基] 噻唑 5 7
 0 m g 。

五、發明說明 (363)

淡褐色針狀結晶

熔點：113 ~ 114 °C

實施例 359

含有 3 - [2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 - 4 - 基] - 6 - 乙醯基胺基苯甲酸鉀鹽 (1 g) 的水 (50 m l) 和 30 % 氫氧化鉀 (10 m l) 溶液，加熱還流 8 小時。反應結束後，蒸餾去除溶劑，所得殘渣用 10 % 鹽酸處理變成弱酸性後，以乙酸乙酯 (80 m l) 萃取之。用飽和食鹽水 (20 m l) 洗淨，乾燥後蒸餾去除溶劑。從乙酸乙酯中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 胺基苯基) 噻唑 168 m g 。

黃色針狀結晶

熔點：228 ~ 229 °C

按照實施例 359 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 298 的化合物。

實施例 360

含有 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 , 4 - 二羥基苯基) 噻唑 (1.5 g) 的丙酮 (40 m l) 溶液中，加入碳酸鉀 (2 g) ，在 - 78 °C 下冷卻中加入乾冰 (40 g) ，並密封在管容器中。然後在 150 °C 下攪拌 18 小時。蒸餾去除溶劑後所得殘渣用乙酸乙酯 (

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (364)

100 ml) 和 10% 鹽酸變為弱酸性後，經分液萃取，再以飽和食鹽水 (30 ml) 洗淨後，乾燥之。蒸餾去除溶媒所得殘渣中加入二氯甲烷 (40 ml)，濾取不溶性物質，再用少量的二氯甲烷洗淨，乾燥，從乙酸乙酯中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4, 6 - 二羥基苯基) 噻唑 241 mg。

淡褐色板狀結晶

熔點：233 ~ 234 °C

按照實施例 360 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 190, 262, 275, 276, 277, 278, 282, 284 ~ 286, 288 ~ 293, 295, 297, 299, 304, 305 和 308 的化合物。

實施例 361

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 乙基 - 4 - 羥基苯基) 噻唑 (1 g)，多聚甲醛 (1 g) 以及鹽酸二甲基胺 (1.1 g) 的乙醇 (20 ml) 懸濁液，在 100 °C 下加熱攪拌 4 小時，蒸餾去除溶劑後所得殘渣中加水 (20 ml) 和 乙酸乙酯 (30 ml) 後分液萃取之。乙酸乙酯層再用 10% 鹽酸 (20 ml × 3) 三次。合併水溶液層用 10% 氫氧化鈉變成鹼性，再以二氯甲烷萃取，飽和食鹽水 (20 ml) 洗淨，乾燥後蒸餾去

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (365)

除溶劑。所得殘渣用矽膠柱管層析法（溶出液：二氯甲烷／甲烷 = 49 / 1）精製，溶解於丙酮，加入鹽酸酸性甲醇並加熱之。濾取所析出結晶，乾燥，從丙酮中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 乙基 - 4 - 羥基苯基) - 5 - 二甲基胺基甲基噻唑二鹽酸鹽 117 mg。

黃色粉末狀結晶

熔點：163 ~ 168 °C

實施例 362

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 氰基苯基) 噻唑 (16 g) 的乙醇 (120 ml) 和 40% 氫氧化鈉水溶液 (90 ml) 的混合液加熱還流 15 小時。反應液中加水，用濃鹽酸變為酸性後以乙酸乙酯 (200 ml × 3) 萃取之。水洗 (100 ml × 3) 後，蒸餾去除溶劑，所得殘渣從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基苯基) 噻唑 8 g。

淡粉紅色針狀結晶

熔點：192 ~ 192.8 °C

實施例 363

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 丙烯基苯基) 噻唑 (250 mg) 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 (366)

甲醇 (10 ml) 溶液中，加入催化劑量的 5% 鈀碳，在氫氣中室溫下攪拌 6 小時。反應結束後，過濾反應液，濃縮濾液，殘渣從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 丙基苯基) 噻唑 193 mg。

白色粉末狀

熔點：179 ~ 180 °C

按照實施例 363 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 295, 302, 319 的化合物。

實施例 364

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基) - 4 - 羥基苯基) 噻唑 (1 g) 的乙醚 (5 ml) 溶液，在 100 °C 下加熱攪拌 4 小時。蒸餾去除溶劑後，所得殘渣溶解於乙酸乙酯 (50 ml) 中，加入飽和碳酸氫鈉水溶液 (10 ml)，並加以分液萃取。乙酸乙酯層用 10% 鹽酸變為酸性，以飽和食鹽水 (10 ml) 洗淨後，乾燥，蒸餾去除溶劑。從乙酸乙酯中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 乙醯基氧基苯基) 噻唑 145 mg。

白色針狀結晶。

熔點：178 ~ 179 °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 (367)

實施例 365

含有 2 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基苯基) - 4 - (3, 4 - 二羥基苯基) 噻唑 (1.2 g) 的二甲基甲醯胺溶液 (20 ml) 中，加入乙基碘 (1.2 g) 以及碳酸鉀 (1.5 g)，在室溫下攪拌 14 小時。蒸餾去除溶劑，所得殘渣中加入氯仿 (40 ml) 和水 (40 ml)，以 10% 鹽酸變為酸性後分液萃取之。再用飽和食鹽水 (20 ml) 洗淨，乾燥後蒸餾去除溶劑，所得殘渣用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷 / 正己烷 = 3 / 1) 精製而得 2 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基苯基) - 4 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 400 mg。

核磁氣共振譜 (CDCI₃) δ :

- 1.35 - 1.60 (6H, m)
- 3.94 (3H, s)
- 4.10 - 4.30 (4H, m)
- 5.73 (1H, s)
- 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz)
- 7.03 (1H, d, J = 8.8 Hz)
- 7.30 (1H, s)
- 7.48 - 7.65 (2H, m)
- 8.13 (1H, dd, J = 2.3 Hz, 8.8 Hz)
- 8.41 (1H, d, J = 2.3 Hz)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (368)

按照本實施例 3 6 5 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 1, 6, 23, 26~81, 92, 94~96, 101~108, 112, 115, 118, 121, 124, 125~128, 130~133, 135, 136, 154~165, 167~227, 229~234, 253~273, 275~307, 309~316, 318~328, 330~351 的化合物。

實施例 3 6 7

按照前述實施例 1 4 7 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 2 5 8 的化合物。

實施例 3 6 8

按照前述實施例 2 3 5 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 2 6 8, 2 7 1, 2 7 2, 2 8 3, 2 8 5, 2 9 8, 3 0 0, 3 1 0, 3 2 0 的化合物。

實施例 3 6 7 ~ 3 7 4

按照前述實施例 1 和 1 3 8 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得 1 2 表中所示化合物。

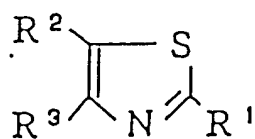
(請先閱讀請背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

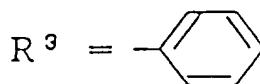
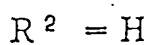
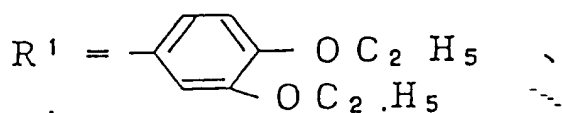
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (369)

第 1 2 表



實施例 3 6 7 的化合物



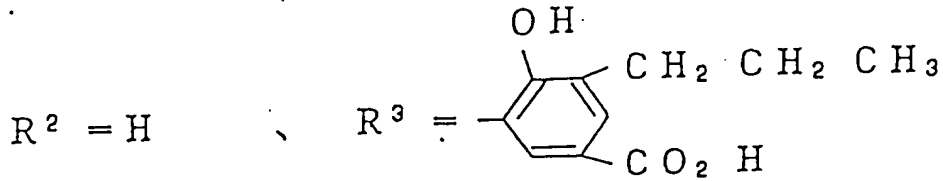
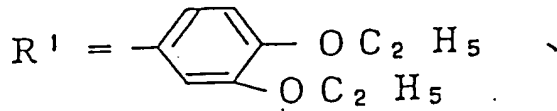
結晶形：淡褐色針狀(從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶)

mp : 92 - 93 °C

形態：遊離

五、發明說明 (370)

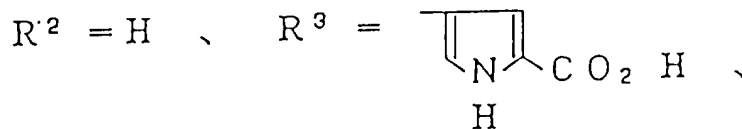
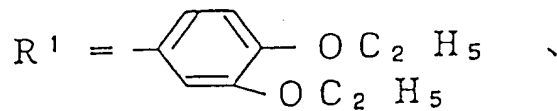
實施例 3 6 8 的化合物



結晶形：白色針狀（從乙醇中再結晶）

mp : 256.8 – 257.0°C 形態：遊離

實施例 3 6 9 的化合物



結晶形：白色粉末狀（從乙酸乙酯和乙醇混液中再結晶）

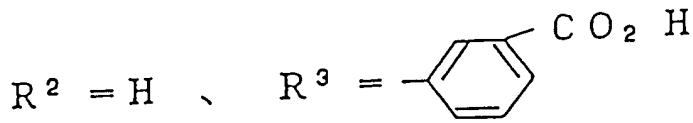
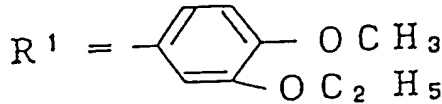
mp : 236.6 – 238.0°C 形態：遊離

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝
訂
線

三、發明說明 (371)

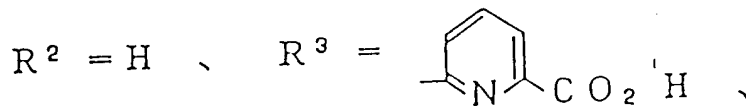
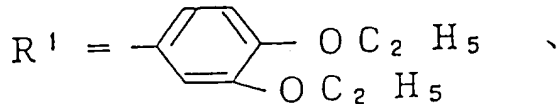
實施例 370 的化合物



結晶形：淡黃色針狀。(從乙醇中再結晶)

mp : 197.8 - 199.3°C 形態：遊離

實施例 371 的化合物



結晶形：白色粉末狀 (從乙醇中再結晶)

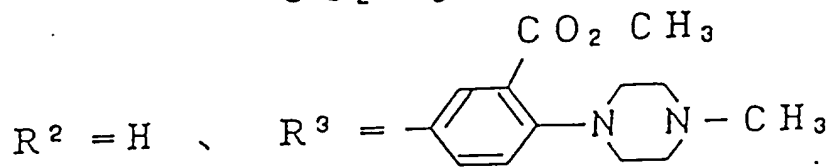
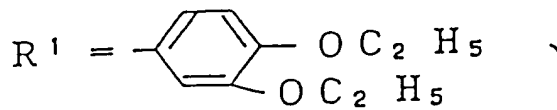
mp : 182 - 184°C 形態：遊離

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

三、發明說明 (872)

實施例 3 7 2 的化合物

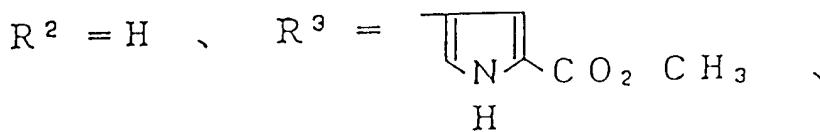
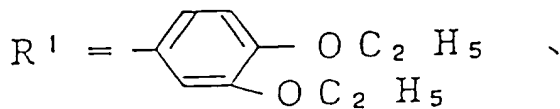


結晶形：黃色粉末狀(從丙酮和二乙醚混液中再結晶)

mp : 111 - 114°C

形態：3 鹽酸鹽 · 1/2 水和物

實施例 3 7 3 的化合物



形態：遊離

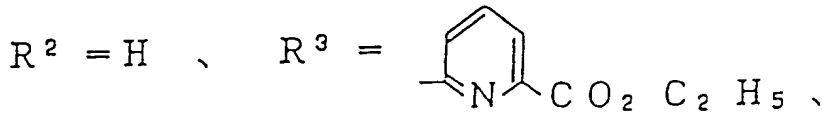
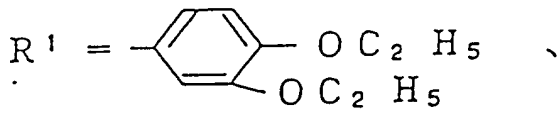
NMR : 56)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 873)

實施例 3 7 4 的化合物



形態：遊離
NMR：57)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 874)

56) 核磁氣共振譜 (DMSO-d₆) δ :

- 1.37 (3H, t, J = 6.9 Hz)
- 1.39 (3H, t, J = 6.9 Hz)
- 3.82 (3H, s)
- 4.13 (4H, m)
- 7.09 (1H, d, J = 8.4 Hz)
- 7.30 (1H, m)
- 7.48 (1H, dd, J = 2.0 Hz, 8.4 Hz)
- 7.58 (2H, m)
- 7.71 (1H, s)
- 2.10 (1H, brs)

57) 核磁氣共振譜 (CDCl₃) δ :

- 1.41 - 1.54 (9H, m)
- 4.07 - 4.26 (6H, m)
- 6.92 (3H, d, J = 8.4 Hz)
- 7.49 (3H, dd, J = 2.0 Hz, 8.4 Hz)
- 7.63 (1H, d, J = 2.0 Hz)
- 7.86 - 8.05 (2H, m)
- 8.20 (1H, s)
- 8.44 (1H, dd, J = 1.0 Hz, 7.7 Hz)

(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

三、發明說明 (B75)

實施例 3 7 5

按照前述實施例 1 4 7 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 3 6 8 ~ 3 7 1 的化合物。

實施例 3 7 6

按照前述實施例 3 6 3 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 3 6 8 的化合物。

實施例 3 7 7

按照前述實施例 3 6 5 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 3 6 7 ~ 3 7 4 的化合物。

實施例 3 7 8 ~ 4 5 2

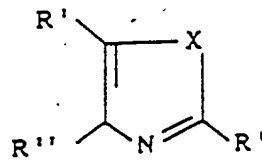
按照前述實施例 1 和 1 3 8 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得表 1 3 中所示化合物。

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)
.....

.....
裝
.....
訂
.....
線
.....

五、發明說明 (876)

第 13 表

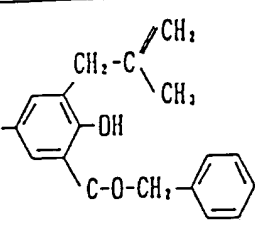
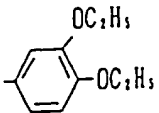
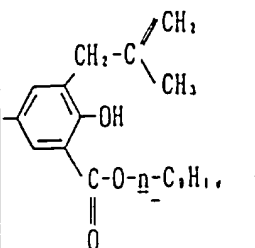
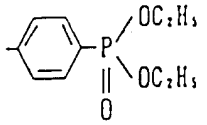
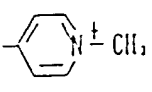
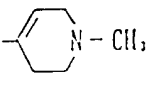
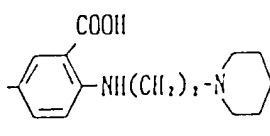


實施例	R'	R''	R'	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (型的形式)
378		H		黃色粉末狀 (二乙醚)	93-94 (2HC 2)
379	"	H		黃色粉末狀 (丙酮)	119-122 (3HC 2)
380		H		淡黃色粉末狀 (乙醇)	203-205.6
381		H		淡黃色粉末狀 (乙酸乙酯)	183.4- 190.4(分解) (-)
382	"	H		白色粉末狀 (乙醇)	67-68 (-)
383	"	H		白色粉末狀 (乙醇)	108-109 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (B77)

第 13 表 (續)

實例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
384	"	H		白色粉末狀 (二乙醚)	99-100 (-)
385		H		白色針狀 (二乙醚- 正己烷)	94-95 (-)
386	"	H		白色粉末狀 (二乙醚)	69-71.4 (-)
387	"	H		暗黃色針狀 (丙酮)	213-214 (I)
388	"	H		淡褐色粉末狀 (二乙醚)	81.2-83.6 (-)
389	"	H		白色粉末狀 (乙醇-二乙醚)	212-214 (HCl)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (B78)

第 13 表 (續)

實例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
390		H		白色粉末狀 (乙醇)	126.8-128.8 (-)
391	"	H		白色粉末狀 (乙酸乙酯)	206.8-208.6 (-)
392	"	H		白色針狀 (正己烷-乙酸 乙酯-二氧甲 烷)	163.2-164.1 (-)
393	"	H		白色針狀 (甲醇)	123-124 (-)
394	"	H		白色針狀 (乙酸乙酯)	144-145 (-)

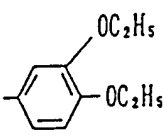
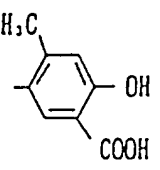
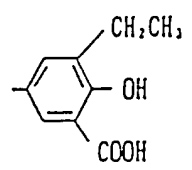
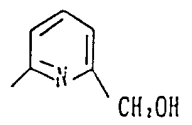
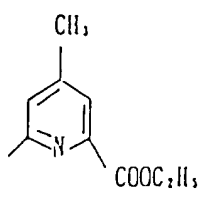
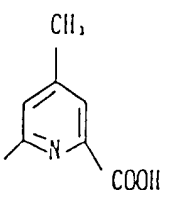
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....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 (B79)

第 13 表 (續)

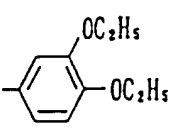
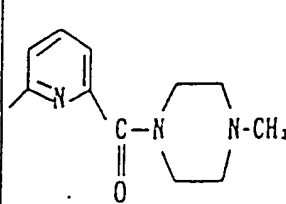
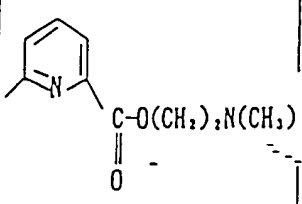
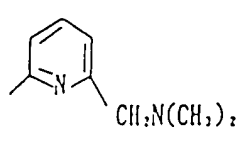
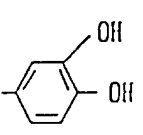
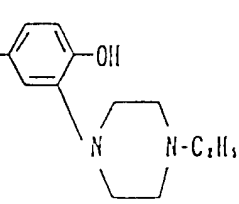
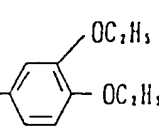
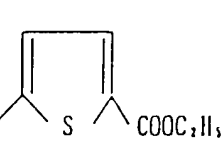
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
395		H		淡褐色稜狀 (乙酸乙酯)	171-172 (-)
396	"	"		白色粉末狀 (乙酸乙酯)	216-217 (-)
397	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯- 正己烷)	109-113 (-)
398	"	"		黃色粉末狀 (乙醇)	181.8-182.4 (分解) (-)
399	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	180.8-182.2 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (380)

第 13 表 (續)

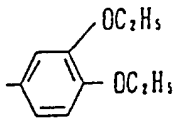
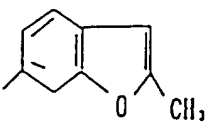
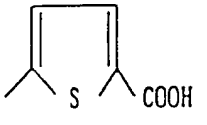
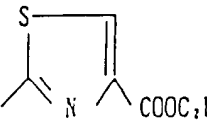
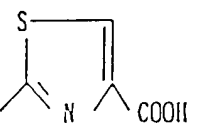
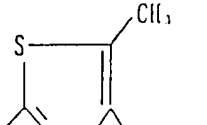
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
400		H		黃色不定形	242.5(分解) (4HCl)
401	"	"		白色針狀 (二乙醚- 正己烷)	216-217 (-)
402	"	"		黃色粉末狀 (二乙醚-乙醇)	195(分解) (2HCl)
403		H		灰色粉末狀 (乙酸-水)	184-186 (分解) (HBr)
404		"		黃色針狀 (乙醇)	104.8-103.8 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (381)

第 13 表 (續)

實 例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
405		H		白色針狀 (乙酸乙酯)	217-219 (-)
406	"	"		淡黃色粉末狀 (乙醇)	189.8-191 (-)
407	"	"		白色針狀 (乙醇)	133.2-139 (-)
408	"	"		白色針狀 (乙醇)	222-223 (-)
409	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯- 乙醇)	240-242 (-)

(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 (82)

第 13 表 (續)

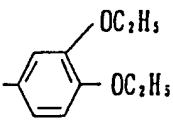
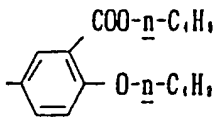
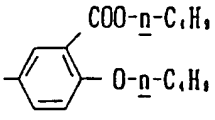
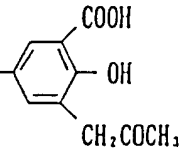
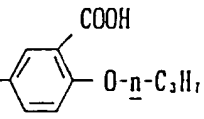
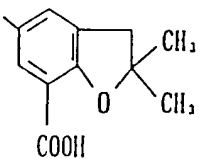
實例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
410		H		淡黃色針狀 (乙酸乙酯)	222-223
411	"	"		白色粉末狀 (乙酸乙酯)	215-216 (-)
412	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	158-159 (-)
413	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	140-141 (-)
414	"	"		白色粉末狀 (乙醇)	234.6- 239.4 (HCl)

(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)

第 13 表 (續)

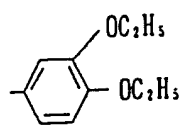
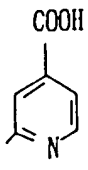
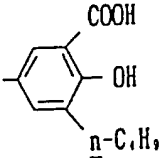
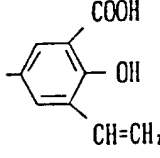
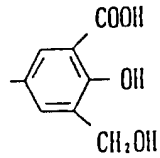
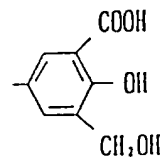
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
415		H		白色粉末狀 (正己烷)	75-76.5
416	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	126.5-128 (-)
417	"	"		白色粉末狀 (乙酸乙酯- 正己烷)	NMR ⁵¹¹ (-)
418	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	159-161 (-)
419	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	106-107 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (884)

第 13 表 (續)

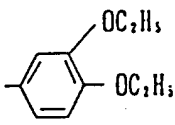
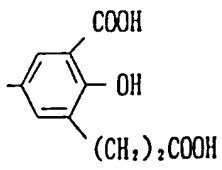
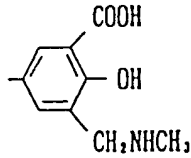
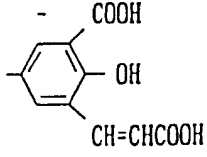
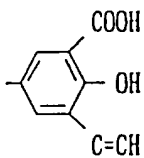
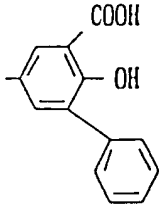
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
420		H		白色粉末狀 (乙酸乙酯)	236.2 - 237.2 (-)
421	"	"			
422	"	"		白色粉末狀 (乙酸乙酯)	212 - 213 (-)
423	"	"			NMR ³⁰¹
424	"	"		黃色粉末狀 (乙酸乙酯)	210 - 212 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線

五、發明說明 885)

第 13 表 (續)

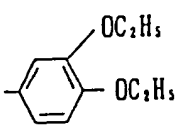
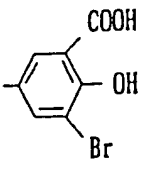
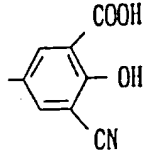
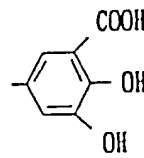
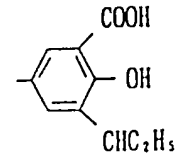

實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
425		H			NMR ¹⁰⁾ (-)
426	"	"		淡褐色粒狀 (二甲基甲酰胺)	271-273 (-)
427	"	"		黃色粉末狀 (乙酸乙酯)	260-261 (-)
428	"	"			
429	"	"			

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (886)

第 13 表 (續)

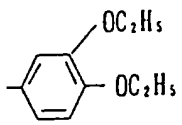
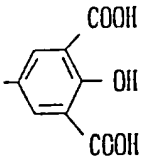
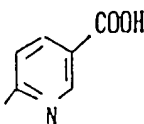
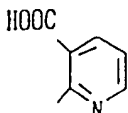
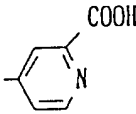
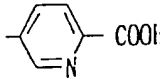
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
430		H		黃色粉末狀 (乙醇)	202-203
431	"	"		白色粉末狀 (甲醇)	254-255 (-)
432	"	"			
433	"	"			
434	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	243-246 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (887)

第 13 表 (續)

實 施 例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
435		H		黃色針狀 (乙醇)	243-244
436	"	"		淡橙色片狀 (乙酸乙酯)	230.4- 231.4 (-)
437	"	"		暗黃色稜狀 (乙酸乙酯-二 乙醚-正己烷)	164.6- 165.5 (-)
438	"	"		淡褐色粉末 (乙酸乙酯)	153.8- 155.4 (-)
439	"	"		白色粉末狀 (乙酸乙酯)	178-178.6 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (388)

第 13 表 (續)

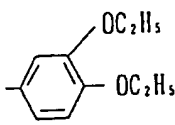
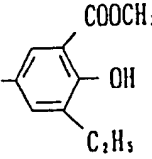
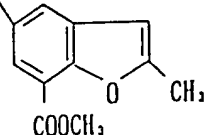
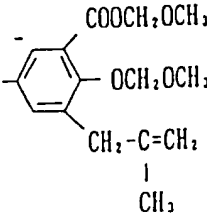
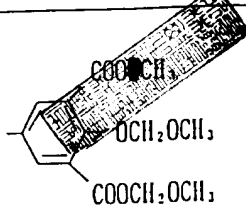
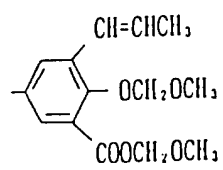
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
440		H		淡黃色粉末狀 (乙醇-二乙醚)	220.8- 223.4
441	"	"		褐色粉末狀 (乙醇)	174.4- 175.6 (-)
442	"	"		白色針狀 (甲醇-二乙醚)	102.5- 103.5 (-)
443	"	"		白色粉末狀 (乙醇)	112-113 (-)
444	"	"		無色油狀	NMR ⁽¹⁾

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (889)

第 13 表(續)

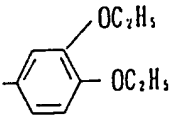
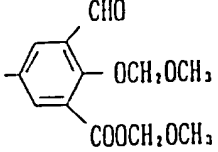
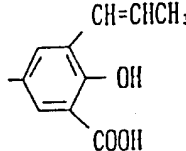
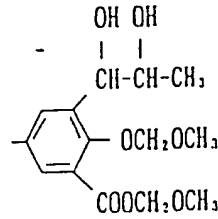
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
445		H		淡褐色針狀 (乙醇)	93-94 (-)
446	"	"		淡褐色針狀 (甲醇-二氧甲 烷)	144-145 NMR ⁽²⁾ (-)
447	"	"		褐色油狀	NMR ⁽³⁾ (-)
448	"	"		無色油狀	NMR ⁽⁴⁾ (-)
449	"	"		白色固体	NMR ⁽⁵⁾

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

..... 裝 訂 線

五、發明說明 (890)

第 1 3 表 (續)

實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
450		H		白色針狀 (乙醇)	113-114 (-)
451	"	"		黃色針狀 (乙酸乙酯)	202-203 (-)
452	"	"			NMR ⁽⁶⁾

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (391)

實施例 4 5 3

含有 4 - [2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - 噻唑] - 1 - 甲基吡啶姆 · 碘化物 (5 0 0 m g) 的甲醇 (6 0 m l) 溶液中，在 0 ° C 下加入氫化硼鈉 (9 4 m g) ，然後在室溫下攪拌 1 5 小時。反應結束後，濃縮反應液，所得殘渣加入乙酸乙酯 (1 0 0 m l) ，然後用水 (5 0 m l) 洗淨之。乙酸乙酯層用硫酸鈉乾燥後，濃縮之。從二乙醚中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (1 - 甲基 - 1 , 2 , 5 , 6 - 四氫吡啶 - 4 - 基) 噻唑 3 0 0 m g 。

淡褐色粉末狀。

熔點：8 1 . 2 ~ 8 3 . 6 ° C

實施例 4 5 4

含有 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 乙氧基羰基 - 6 - 吡啶基) 噻唑 (1 . 9 2 g) 的四氫呋喃 (1 5 0 m l) 溶液中，在 0 ° C 下加入氫化鋁鋰 (2 0 0 m g) ，並在氫氣環境下攪拌 2 小時。反應液中加入飽和硫酸鈉溶液 (1 m l) ，在 ° C 下攪拌 3 0 分鐘後用矽藻土過濾之。濃縮濾液，所得殘渣用矽膠柱管層析法精製後，從乙酸乙酯和正己烷混液中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 羥甲基 - 6 - 吡啶基) 噻唑 3 6 0 m g 。

白色針狀結晶。

五、發明說明 (92)

熔點：109~113℃

按照本實施例 454 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得實施例 412，423，442 的化合物。

實施例 455

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 羧基 - 6 - 吡啶基) 噻唑 (1 g)，鹽酸二甲胺 (245 mg) 以及氰基磷酸二乙酯 (515 mg) 的二甲基甲醯胺 (15 ml) 溶液中，室溫下滴加三乙胺 (1.13 ml)，在同溫度下攪拌 3 小時。繼之，加水 (20 ml) 於反應液中，用二氯甲烷 (50 ml) 萃取 3 次。再用硫酸鈉乾燥二氯甲烷層後，濃縮，所得殘渣從正己烷，乙酸乙酯和二氯甲烷中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 二甲基胺基羧基 - 6 - 吡啶基) 噻唑 800 mg。

白色針狀結晶。

熔點：163.2~164.1℃

按照實施例 455 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得實施例 379，400 和 401 的化合物。

實施例 456

氫氣環境中，含有氫化鋁鋰 (70 mg) 的二乙醚 (

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (93)

10 ml) 的懸濁液中，滴加溶解有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 二甲基胺基羰基 - 6 - 吡啶基) 噻唑 (730 mg) 的四氫呋喃 (15 ml) 溶液並維持在還流狀況，再繼續還流 1.5 小時。所得反應混合物中加入水 (50 ml)，用二氯甲烷每次 50 ml，萃取 3 次。濃縮二氯甲烷層後，殘留物用矽膠薄層層析法精製後，乙醇溶液中加入濃鹽酸變為鹽酸鹽，再從二乙醚和乙醇混液中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 二甲基胺基甲基 - 6 - 吡啶基) 噻唑二鹽酸鹽 60 mg 的黃色粉末。

熔點：195℃ (分解)

實施例 457

溶解有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基苯基) 噻唑 (10 g) 於二氯甲烷 (100 ml) 溶液中，加入三氟甲磺酸酐 (8.5 g)，冰冷下攪拌中滴加三乙胺 (6 ml)。在室溫下攪拌反應物混合物 2 小時後，加入水 (40 ml) 分液後有機層乾燥，蒸餾去除溶劑，殘留物從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 三氟甲磺基氧基苯基) 噻唑的白色粉末 12.7 mg。

熔點：112 ~ 113℃

實施例 458

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (895)

分液，用飽和食鹽水（15 ml）洗淨有機層，乾燥後蒸餾去除溶劑，殘留物經甲醇再結晶處理而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 乙醯基 - 1 - 吡咯基) 甲基噻唑（60 mg）的白色針狀結晶。

熔點：123 ~ 124 °C

實施例 460

溶解 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 三氟甲基磺醯基氧基苯基) 噻唑（1 g），1 - (2 - 胺基乙基) 六氫吡啶（0.73 g）於二甲亞碸（5 ml）中，在 80 °C 下攪拌 5 小時。反應混合物中加入乙酸乙酯（40 ml）和水（20 ml）後分液，有機層用飽和食鹽水（15 ml）洗淨，乾燥後蒸餾去除溶劑。所得殘渣用矽膠柱管層析法（溶出液：二氯甲烷 / 甲醇 = 49 / 1, v / v）精製後，溶解於二乙醚中，再用鹽酸酸性甲醇變成鹽酸鹽後，從二乙醚中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - {3 - 甲氧基羰基 - 4 - [2 - (1 - 六氫吡啶基) 乙胺基] 苯基} 噻唑二鹽酸鹽的黃色粉末 330 mg。

熔點：93 ~ 94 °C

按照實施例 460 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得實施例 389, 403, 433, 434 和 442 的化合物。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

· · · · · 裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (396)

實施例 4 6 1

溶解 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 壬
烷基氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基苯基) 噻唑 (3 4 0
m g) 於乙醇 (2 0 m l) 中，再加入 1 0 % 鹽酸 (2
m l) 並還流 2 0 分鐘。蒸餾去除溶劑，殘渣中加入二氯
甲烷 (4 0 m l) 和水 (2 0 m l) 並行分液，有機層用
飽和食鹽水 (1 5 m l) 洗淨後，乾燥，蒸餾去除溶劑。
所得殘渣從乙醇中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯
基) - 4 - { 3 - 壬烷基氧基羰基 - 4 - 羥基苯基) 噻唑
的白色粉末 2 4 5 m g 。

熔點：6 7 ~ 6 8 °C

按照本實施例 4 6 1 所示相同方法，利用適當原料化
合物可製得前述實施例 3 7 9 , 3 8 0 , 3 8 2 ~ 3 8 5
, 3 9 5 , 3 9 6 , 4 1 1 , 4 1 2 , 4 1 7 , 4 2 1 ~
4 3 5 , 4 4 5 和 4 5 1 的化合物。

實施例 4 6 2

懸濁 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲
氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 丙烯基苯基) 噻唑 (1 g) ，
乙酸鈣 (5 0 m g) 和乙酮銅水合物 (2 3 0 m g) 於甲
醇 (5 0 m l) 和水 (5 m l) 的混合溶劑中，然後在氧
氣環境中，5 0 °C 下攪拌 6 小時。再追加乙酸鈣 (5 0 m
g) ， 1 0 小時後再追加乙酸鈣 5 0 m g 。 1 4 小時後，

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (B97)

反應混合物中的原料固形物用肉眼看不見後再行過濾，所得濾液經濃縮，殘渣用矽膠柱管層析法（溶出液：二氯甲烷／己烷 = 1 / 1，v / v）精製後，從甲醇和二氯甲烷混液中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 甲基 - 7 - 甲氧基羰基 - 5 - 苯駢呋喃基) 噻唑 230 mg。

淡褐色稜狀結晶

熔點：141 ~ 145 °C

核磁氣共振譜⁶²⁾

實施例 463

溶解 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - (2 - 甲基 - 2 - 丙烯基) 苯基] 噻唑 (1 g) 於甲醇 (20 ml) 中，冰冷攪拌下導入臭氧，1 小時後加入二甲硫 (0.5 ml)，在同溫度下攪拌 30 分鐘。從反應混合物中蒸餾去除溶劑，所得殘渣中加入二氯甲烷 (50 ml) 和水 (25 ml)，繼之，將有機層分液，再用飽和食鹽水 (15 ml) 洗淨，乾燥後蒸餾去除溶劑，再用矽膠柱管層析法（溶出液：二氯甲烷／正己烷 = 2 / 3，v / v）精製而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - {3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 乙醯基甲基苯基) 噻唑的無色油狀物質 500 g。

物性：核磁氣共振譜⁶⁴⁾

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (898)

按照實施例 4 6 3 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 4 5 0 的化合物。

實施例 4 6 4

溶解 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 乙醯基甲基苯基) 噻唑 (220 mg) 於乙醇 (15 ml) 中，加入 10% 鹽酸 (1 ml) 並加熱還流 2 小時。繼之，蒸餾去除溶劑，所得殘渣中加入乙酸乙酯 (20 ml) 和水 (10 ml) 而行分液，所得有機層用食鹽水 (10 ml) 洗淨後，乾燥，蒸餾去除溶劑。殘渣用矽膠柱管層析法 (溶出液：氯仿 / 甲醇 = 99 / 1, v / v) 精製後，再從正己烷和乙酸乙酯的混合溶劑中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 乙醯基甲基苯基) 噻唑的白色粉末。

按照實施例 4 6 4 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 3 7 9 - 3 8 5, 3 8 9, 3 9 1, 3 9 4 ~ 3 9 6, 3 9 9, 4 0 3, 4 1 1 ~ 4 1 4, 4 1 6 ~ 4 1 8, 4 2 1 ~ 4 3 5, 4 4 5 和 4 5 1 的化合物。

實施例 4 6 5

將 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 羧基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (899)

- 4 - 羥基 - 5 - (2 - 甲基 - 2 - 丙烯基) 苯基] 噻唑 (2 g) 加熱溶解於鄰 - 二氯苯 (4 0 m l) 中，再加入碘 (大約 1 0 m g) 和碘化鉀 (1 . 5 g ， 經磨碎者) ，加熱還流 1 4 小時。反應混合物中加水 (3 0 m l) 再行分液，加入乙酸乙酯 (3 0 m l) 再用飽和食鹽水 (2 0 m l) 洗淨，乾燥，蒸餾去除溶劑，所得殘渣用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷) 精製後，從二異丙醚中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 , 2 - 二甲基 - 7 - 羧基 - 2 , 3 - 二氫苯駢呋喃 - 5 - 基) 噻唑的白色粉末狀結晶 1 g 。

熔點：1 0 6 ~ 1 0 7 °C

實施例 4 6 6

溶解 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - (1 - 丙烯基) 苯基] 噻唑 (3 . 7 g) 於四氫呋喃 (1 0 0 m l) 和水 (4 0 m l) 的混合溶劑中，再加入四氧化鐵 (1 0 0 m g) 和過碘酸鈉 (5 . 6 g) 並於室溫下攪拌 1 4 小時。過濾反應混合物，濃縮濾液至 1 / 3 容量，加入乙酸乙酯 (1 0 0 m l) 再行分液，用飽和食鹽水 (4 0 m l) 洗淨，乾燥後蒸餾去除溶劑。所得殘渣用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷) 精製而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲醯基苯基) 噻唑 (化合物 A) 6 0 0 m g 以及

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (400)

2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - (1, 2 - 二羥基丙基) 苯基] 噻唑 (化合物 B) 1.28 g。溶解上述化合物 B 於甲醇 (40 ml) 中，再加入過碘酸鈉 (5 g) 和水 (10 ml)，於室溫下攪拌 14 小時後，從反應混合物蒸餾去除溶劑。加入乙酸乙酯 (80 ml) 和水 (40 ml) 於殘渣中再行分液，用飽和食鹽水 (20 ml) 洗淨，乾燥後蒸餾去除溶劑。所得殘渣和上述化合物 A (600 mg) 合併後從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲醯基苯基) 噻唑的白色針狀結晶 1.6 g。

熔點：113 ~ 114 °C

按照本實施例 466 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 417 的化合物。

實施例 467 ~ 509

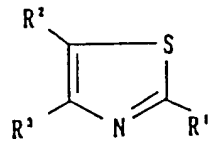
按照實施例 1 和 138 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得表 14 中所示化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (401)

第 14 表



實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
467		H		黃色油狀	NMR ¹¹¹ (-)
468	"	"		赤褐色針狀 (乙酸乙酯)	122-124 (-)
469	"	"		淡黃色針狀 (乙酸乙酯- 正己烷)	166-167 (-)
470	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	NMR ¹¹¹ (-)
471	"	"		淡褐色固体	NMR ¹¹¹ (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (402)

第 1 4 表 (續)

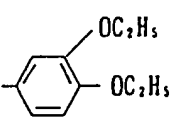
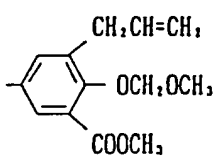
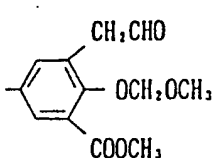
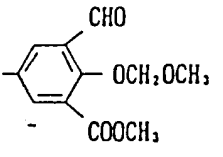
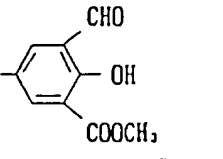
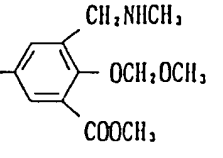
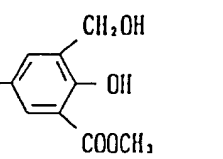
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
472		H		白色針狀 (乙酸乙酯- 正己烷)	167-168 (-)
473		"		白色粉末狀 (乙醇)	175-176 (-)
474	"	"		淡黃色針狀 (乙酸乙酯- 正己烷)	106-107 (-)
475	"	"		淡黃色針狀 (二異丙醚)	89-90 (-)
476	"	"		白色針狀 (二乙醚)	103-105 (-)
477	"	"		白色針狀 (二乙醚)	107-108 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (403)

第 1 4 表 (續)

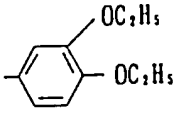
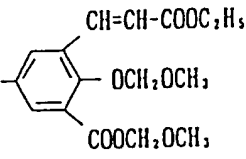
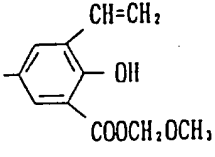
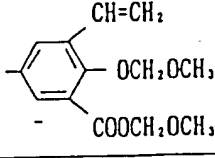
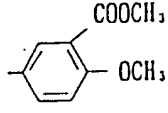
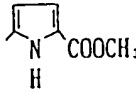

實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
478		H		無色油狀	NMR ¹⁰⁾ (-)
479	"	"		無色油狀	NMR ¹¹⁾ (-)
480	"	"		無色油狀	NMR ¹²⁾ (-)
481	"	"		黃色粒狀 (二氯甲烷-乙醚)	179-181 (-)
482	"	"		無色油狀	NMR ¹³⁾ (-)
483	"	"		黃色固体	NMR ¹⁴⁾ (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (404)

第 1 4 表 (續)

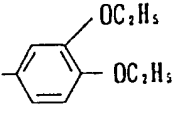
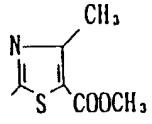
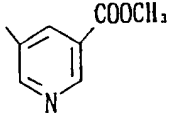
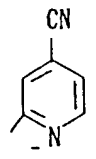
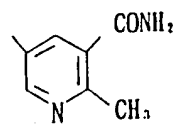
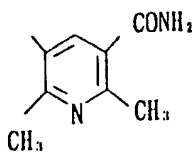
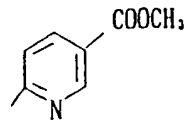
實 施 例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
484		H		黃色粉末狀 (乙醇)	94-96 (-)
485	"	"		無色油狀	NMR ¹⁵¹
486	"	"			NMR ¹⁵¹
487	"	"		白色針狀 (二異丙醚)	92-93 (-)
488	"	"		白色針狀 (乙醇)	125.8- 127.8
489	"	"		黃色針狀 (乙醇)	226.5-229 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (405)

第 1 4 表 (續)

實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
490		H		白色針狀 (乙醇)	152-154 (-)
491	"	"		黃色粉末狀 (乙醇)	172.4- 175.6 (HBr)
492	"	"		黃色粉末狀 (乙醇)	237.2-238 (-)
493	"	"			NMR ¹¹¹ (-)
494	"	"		灰色粉末狀 (乙醇-二甲基 甲酰胺)	272-277
495	"	"		黃色粉末狀 (乙醇)	215-215.8 (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (406)

第 1 4 表 (續)

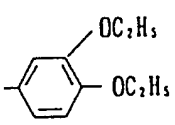
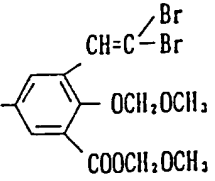
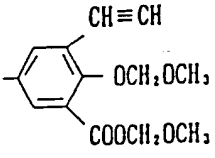

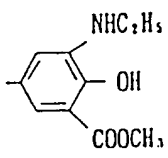
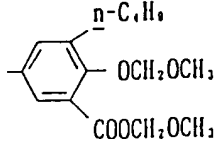
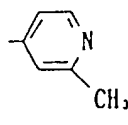
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (變的形態)
496		H		黃色粉末狀 (乙醇)	204-205.4 (HBr)
497	"	"		無色油狀	NMR ¹⁰¹
498	"	"		白色稜狀 (乙酯乙酯-正己烷)	101.3-103 (-)
499	"	"		白色粉末狀 (丙酮)	107-110 (-)
500	"	"		黃色油狀	NMR ¹⁰¹
501	"	"			

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (407)

第 1 4 表 (續)

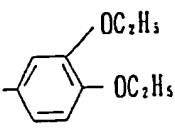
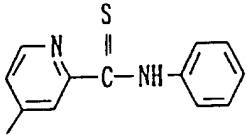
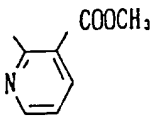
實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C) (鹽的形態)
502		H			
503	"	"			
504	"	"		白色針狀 (乙酸乙酯)	197-198 (-)
505	"	"			
506	"	"			
507	"	"			NMR ⁰¹ (-)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (408)

第 1 4 表 (續)

實施例	R ¹	R ²	R ³	結晶形狀 (再結晶溶劑)	熔點(°C)) (鹽的形態)
508		H			NMR ¹¹⁾ (-)
509	"	"		-	NMR ¹²⁾ (HBr)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · 訂 · 線

五、發明說明 (409)

實施例 5 1 0

溶解 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲醯基苯基) 噻唑 (5 0 0 m l) 於甲醇 (3 0 m l) 中，加入 3 0 % 甲胺溶液 (3 m l) ，在室溫下攪拌 1 4 小時，然後在 7 0 ° C 下攪拌 1 小時。繼之在冰冷攪拌下加入氫化硼鈉 (5 3 0 m l) ，於室溫下攪拌 3 小時。從反應混合物中蒸餾去除溶劑，所得殘渣中加入乙酸乙酯 (4 0 m l) 和水 (2 0 m l) 後分液，有機層用飽和食鹽水 (1 0 m l) 洗滌，乾燥後，蒸餾去除溶劑。所得殘渣用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷 / 甲醇 = 4 9 / 1 ， v / v) 精製，從溶出部分取得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲基胺基甲基苯基) 噻唑 1 5 0 m g 。

無色油狀物

物性：核磁氣共振譜⁷³⁾

按照本實施例 5 1 0 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得實施例 4 0 2 的化合物。

實施例 5 1 1

懸濁 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 甲醯基苯基) 噻唑 (3 0 0 m g) 於甲醇 (2 0 m l) 中，攪拌下於 0 ° C 加入氫化硼

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (410)

鈉 (26.5 mg)，再在室溫下攪拌1小時。再追加氫化硼鈉 (26.5 mg)，同溫度下再攪拌1小時。從反應組成物中蒸餾去除溶劑，所得殘渣中加入二氯甲烷 (30 ml) 和水 (15 ml) 而行分液，有機層用飽和食鹽水 (10 ml) 洗淨，乾燥後，蒸餾去除溶劑而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 羥基甲基苯基) 噻唑 300 mg。

黃色固形物。

物性：核磁氣共振譜⁷⁴⁾

按照本實施例 5 1 1 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得實施例 3 9 7，4 1 2，4 2 3，4 4 5 和 4 9 8 的化合物。

實施例 5 1 2

將 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲醯基苯基) 噻唑 (500 mg) 加入含有新調製好的威第希氏試劑 [三乙基膦酸基乙酸鹽 (270 mg)；氫化鈉 (48 mg)] 的四氫呋喃 (20 ml) 溶液中，在室溫下攪拌4小時。從反應混合物中蒸餾去除溶劑，所得殘渣中加入乙酸乙酯 (20 ml) 和水 (15 ml) 而行分液，用飽和食鹽水 (10 ml) 洗淨，乾燥後，蒸餾去除溶劑。所得殘渣從乙醇中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)
.....

裝
.....
訂
.....
線
.....

五、發明說明 (411)

- [3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - (2 - 乙氧基羰基乙烯基) 苯基] 噻唑 380 mg。

黃色粉末狀物。

熔點：94 ~ 96 °C

按照本實施例 5 1 2 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 4 7 8，4 8 5，4 8 6，5 0 1 和 5 0 2 的化合物。

實施例 5 1 3

在四氫呋喃 (1 0 m l) 中懸濁攪拌甲基三苯基磷基溴 (5 3 5 m g)，在 - 5 °C 下加入第三丁醇鉀 (1 9 0 m g)，同溫度下攪拌 1 小時。再加入 2 - (3，4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲醯基苯基) 噻唑 (5 0 0 m g) 同溫度下攪拌 2 小時，再升溫至室溫下攪拌 1 小時。反應混合物中加入乙酸乙酯 (3 0 m l) 和水 (2 0 m l) 而行分液，有機層用飽和食鹽水 (2 0 m l) 洗淨，乾燥後蒸餾去除溶劑。所得殘渣用矽膠柱管層析法 (溶出液：二氯甲烷 / 正己烷 = 2 / 1，v / v) 精製而得 2 - (3，4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 羥基 - 5 - 乙烯基苯基) 噻唑 (A) 2 4 0 m g 和 2 - (3，4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 乙烯基苯基) 噻唑 (B) 1 2 0 m g。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (413)

1 7 . 7 H z) , 7 . 4 3 (1 H , S) , 7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 1 ; 8 . 4 H z) , 7 . 6 1 (1 H , d , J = 2 . 1 H z) , 8 . 2 9 (2 H , d , J = 1 . 3 H z) 。

實施例 5 1 4

溶解 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 甲氧基甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - (2 - 乙氧基羰基乙烯基) 苯基] 噻唑 (3 5 0 m g) 於乙醇 (1 0 m l) 中 , 加入 1 0 % 鹽酸 (0 . 2 m l) , 在 6 0 ° C 下加熱還流 1 小時。然後加入 1 0 % 氫氧化鈉 (1 m l) , 並加熱還流 4 小時。從反應混合物中蒸餾去除溶劑 , 所得殘渣加入水 (1 5 m l) , 用 1 0 % 鹽酸變為弱酸性後 , 再以熱乙酸乙酯 (4 0 m l) 萃取 , 再用飽和食鹽水 (1 5 m l) 洗淨 , 乾燥後蒸餾去除溶劑。殘渣從乙酸乙酯中再結晶而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - (2 - 羧基乙烯基) 苯基] 噻唑 1 7 0 m g 。

黃色粉末狀物

溶點 : 2 6 0 ~ 2 6 1 ° C

實施例 5 1 5

溶解 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 甲氧基甲氧基 - 5 - 甲基胺基甲基苯基)

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (414)

噻唑 (150 mg) 於甲醇 (20 ml) 中，加入 10% 鹽酸 (0.2 ml) 於 60°C 下攪拌 30 分鐘。繼之，加入 10% 氫氧化鈉 (2 ml) 加熱還流 1 小時。反應混合物用 10% 鹽酸變為中性後，蒸餾去除溶劑，殘渣中加入乙醇後濾取不溶性物，用水洗淨並乾燥之。從二甲基甲醯胺中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羧基 - 5 - 甲基胺基甲基苯基) 噻唑 35 mg。

淡褐色粒狀物

溶點：271 ~ 273 °C

實施例 516

將 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 氰基 - 2 - 吡啶基) 噻唑 (500 mg)，乙醇 (20 ml) 和 4% 氫氧化鈉水溶液 (17 ml) 的混合液加熱還流 16 小時。反應混合物冷卻後加水 (200 ml)，再用二氯甲烷 (80 ml) 萃取 2 次後，水液層用濃鹽酸變為酸性 (pH = 3)，再用乙酸乙酯 150 ml 萃取 3 次。乙酸乙酯層經無水硫酸鈉乾燥後，濃縮，所得殘渣從乙酸乙酯中再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羧基 - 2 - 吡啶基) 噻唑 290 mg。

白色針狀結晶

溶點：236.2 ~ 237.2 °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 (415)

實施例 5 1 7

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基苯基) 噻唑 (402 g) 的二甲基甲醯胺 (60 ml) 的懸濁液，在室溫下依序加入咪唑 (5.23 g)，第三丁基二甲基氯化矽烷 (4.85 g)，在同溫度下攪拌 4 小時。反應混合物中加入冰水 (100 ml)，乙酸乙酯 (200 ml)，分離有機層，依序用水 (100 ml)，飽和食鹽水 (50 ml) 洗淨後，經無水硫酸鎂乾燥，蒸餾去除溶劑，所得殘渣用矽膠層析法 (溶出液：正己烷 / 乙酸乙酯 = 10 / 1) 精製而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 第三丁基二甲基甲矽烷基氧基苯基) 噻唑 5.14 g。

無色油狀物。物性：核磁氣共振譜⁷⁸⁾

實施例 5 1 8

含有 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 第三丁基二甲基甲矽烷基氧基苯基) 噻唑 (5.43 g) 的四氫呋喃 (100 ml) 溶液中，冰冷下加入氫化鋁鋰 (548 mg)，在同溫度下攪拌 7 小時。反應混合物中加入水 (1.1 ml) 和硫酸鈉 (3 g)，經矽藻土過濾，蒸餾去除溶劑後加入乙酸乙酯 (200 ml) 和水 (50 ml)，再以 5 N 鹽酸中和後，濾除不溶性物質，濾液經分液後，有機層用水 (50 ml) 洗淨

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (416)

，經無水硫酸鎂乾燥後，蒸餾去除溶劑。所得殘渣用矽膠柱管層析法（溶出液：正己烷／乙酸乙酯 = 10 / 1，v / v）精製後，再經乙酸乙酯和正己烷混液再結晶而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羥基甲基 - 4 - 第三丁基二甲基甲矽烷基氧基苯基) 噻唑 1.23 g。

白色稜狀結晶

溶點：101.3 ~ 103 °C

按照本實施例 518 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得前述實施例 397, 412, 423, 445 和 483 的化合物。

實施例 519

按照實施例 1 和 138 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得下列化合物。

2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - (1 - 異丁烯基) 苯基] 噻唑

物性：¹H - 核磁氣共振譜 (DMSO - d₆) δ :

1.38 (3H, t, J = 6.9 Hz), 1.40 (3H, t, J = 6.9 Hz), 1.86 (3H, s), 1.95 (3H, s), 4.12 (2H, q, J = 6.9 Hz), 4.15 (2H, q, J = 6.9 Hz), 6.33 (1H, brs), 7.09 (1H, d, J

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (417)

= 8.7 Hz), 7.48 - 7.62 (2H, m),
7.93 (1H, s), 7.95 (1H, d, J =
2.1 Hz), 8.31 (1H, d, J = 2.1 Hz)
。

實施例 520

按照實施例 1 和 138 所示相同方法，利用適當原料化合物可製得下列化合物。

4 - [2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - 噻唑基] 吡啶姆 - 1 - 氧化物

物性：¹H - 核磁氣共振譜 (-DMSO - d₆) δ :

1.35 (3H, t, J = 6.9 Hz), 1.37
(3H, t, J = 6.9 Hz), 4.07 (4H, m)
, 7.07 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.52 (1H, dd, J = 2.0 Hz, 8.3 Hz), 7.58
(1H, d, J = 2.0 Hz), 8.03 (2H, d, J = 7.2 Hz), 8.29 (2H, d, J = 7.2 Hz), 8.33 (1H, s)。

2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 氨基 - 4 - 吡啶姆) 噻唑

物性：¹H - 核磁氣共振譜 (DMSO - d₆) δ :

1.36 (3H, t, J = 6.9 Hz), 1.38
(3H, t, J = 6.9 Hz), 4.08 - 4.23 (

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (418)

4 H, m), 7.08 (1 H, d, $J = 8.3 \text{ Hz}$),
7.55 - 7.61 (2 H, m), 8.32 (1 H, d
d, $J = 1.3 \text{ Hz}$, 5.2 Hz), 8.64 (2 H,
s), 8.84 (1 H, d, $J = 5.2 \text{ Hz}$)。

實施例 417, 423, 425, 444, 446 ~
449, 452, 467, 470, 471, 478 ~
480, 482, 483, 485, 486, 493, 4
97, 500, 507 ~ 509 的化合物的核磁氣共振譜
資料如下 (NMR⁵⁸) ~ NMR⁸²) :

實施例 417 的化合物 :

NMR⁵⁸) : ¹H - NMR (DMSO - d₆) δ :

1.38 (3 H, t, $J = 7.0 \text{ Hz}$),
1.40 (3 H, t, $J = 7.0 \text{ Hz}$),
2.22 (3 H, s),
3.87 (2 H, s),
4.08 (2 H, q, $J = 7.0 \text{ Hz}$),
4.16 (2 H, q, $J = 7.0 \text{ Hz}$),
7.10 (1 H, d, $J = 8.2 \text{ Hz}$),
7.48 - 7.60 (2 H, m),
7.99 (1 H, s),
8.08 (1 H, d, $J = 2.3 \text{ Hz}$),
8.38 (1 H, d, $J = 2.3 \text{ Hz}$)。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (419)

實施例 4 2 3 的化合物：

NMR⁵⁹⁾ : ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1. 38 (3 H, t, J = 6.9 Hz),
- 1. 40 (3 H, t, J = 6.9 Hz),
- 4. 11 (2 H, q, J = 6.9 Hz),
- 4. 15 (2 H, q, J = 6.9 Hz),
- 4. 60 (2 H, s),
- 7. 08 (1 H, d, J = 8.9 Hz),
- 7. 45 - 7. 63 (2 H, m),
- 7. 77 (1 H, s),
- 8. 06 (1 H, d, J = 2.2 Hz),
- 8. 34 (1 H, d, J = 2.2 Hz)。

實施例 4 2 5 的化合物：

NMR⁶⁰⁾ : ¹H-NMR (CDCl₃) δ :

- 1. 48 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
- 1. 50 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
- 2. 78 (2 H, t, J = 6.7 Hz),
- 3. 09 (2 H, t, J = 6.7 Hz),
- 4. 07 - 4. 30 (4 H, m),
- 6. 91 (1 H, d, J = 8.3 Hz),
- 7. 52 (1 H, d, J = 8.3 Hz),
- 7. 60 (1 H, b r s),
- 8. 02 (1 H, b r s),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (420)

8.38 (1 H, b r s) ,

實施例 4 4 4 的化合物：

N M R ⁽¹⁾ : ¹H - N M R (C D C l ₃) δ :

0.08 - 1.00 (3 H, m) ,

1.00 - 1.67 (18 H, m) ,

1.67 - 1.95 (2 H, m) ,

3.54 (3 H, s) ,

4.16 (2 H, q, J = 7.0 H z) ,

4.23 (2 H, q, J = 7.0 H z) ,

4.35 (2 H, t, J = 6.6 H z) ,

5.30 (2 H, s) ,

6.92 (1 H, d, J = 8.4 H z) ,

7.27 (1 H, d, J = 8.7 H z) ,

7.36 (1 H, s) ,

7.53 (1 H, d d, J = 2.0 H z ,
8.4 H z) ,

7.62 (1 H, d, J = 2.0 H z) ,

8.08 (1 H, d d, J = 2.3 H z ,
8.7 H z) ,

8.35 (1 H, J = 2.3 H z) 。

實施例 4 4 6 的化合物：

N M R ⁽²⁾ : ¹H - N M R (C D C l ₃) δ :

(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)

1. 50 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1. 52 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 2. 55 (3 H, d, J = 0.9 Hz),
 4. 04 (3 H, s),
 4. 16 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4. 23 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 6. 50 (1 H, d, J = 1.0 Hz),
 6. 93 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7. 45 (1 H, s),
 7. 55 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8. 4 Hz),
 7. 64 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
 8. 34 (1 H, d, J = 1.8 Hz),
 8. 42 (1 H, d, J = 1.8 Hz)。

實施例 447 的化合物：

NMR (300 MHz, CDCl₃) δ :

1. 49 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1. 51 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1. 78 (3 H, s),
 3. 54 (2 H, s),
 3. 59 (3 H, s),
 4. 16 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4. 22 (2 H, q, J = 7.0 Hz),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (422)

4. 71 (1 H, b r s) ,
 4. 90 (1 H, b r s) ,
 5. 09 (2 H, s) ,
 5. 51 (2 H, s) ,
 6. 92 (1 H, d, J = 8. 4 H z) ,
 7. 40 (1 H, s) ,
 7. 53 (1 H, d d, J = 2. 1 H z ,
 8. 4 H z) ,
 7. 61 (1 H, d, J = 2. 1 H z) ,
 7. 98 (1 H, d, J = 2. 4 H z) ,
 8. 34 (1 H, d, J = 2. 4 H z) 。

實施例 4 4 8 的化合物：

NMR ⁶⁴) : ¹H - NMR (C D C l₃) δ :

1. 49 (3 H, t, J = 7. 0 H z) ,
 1. 51 (3 H, t, J = 7. 0 H z) ,
 2. 24 (3 H, s) ,
 3. 56 (3 H, s) ,
 3. 59 (3 H, s) ,
 3. 95 (2 H, s) ,
 4. 16 (2 H, q, J = 7. 0 H z) ,
 4. 22 (2 H, q, J = 7. 0 H z) ,
 5. 09 (2 H, s) ,
 5. 50 (2 H, s) ,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (423)

- 6.92 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7.42 (1 H, s),
 7.52 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8.4 Hz),
 7.60 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
 8.01 (1 H, d, J = 2.3 Hz),
 8.39 (1 H, d, J = 2.3 Hz)。

實施例 449 的化合物：

NMR (65) : ¹H-NMR (CDCl₃) δ :

- 1.50 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.51 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.97 (3 H, dd, J = 1.6 Hz,
 6.6 Hz),
 3.58 (3 H, s),
 3.59 (3 H, s),
 4.16 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4.22 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 5.09 (2 H, s),
 5.50 (2 H, s),
 6.38 (1 H, dq, J = 15.9 Hz,
 6.6 Hz),
 6.83 (1 H, d, J = 15.9 Hz),
 6.93 (1 H, d, J = 8.4 Hz)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (424)

, 7.42 (1 H, s),
 7.55 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8.4 Hz),
 7.61 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
 8.23 (1 H, d, J = 2.2 Hz),
 8.27 (1 H, d, J = 2.2 Hz)。

實施例 450 的化合物：

NMR ⁶⁶) : ¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.16 (1.5 H, d, J = 6.3 Hz
),
 1.22 (1.5 H, d, J = 6.3 Hz
),
 1.43 - 1.57 (6 H, m),
 3.59 (3 H, s),
 3.62 (3 H, s),
 4.05 - 4.36 (4 H, m),
 5.07 - 5.28 (2 H, m),
 5.30 (2 H, s),
 5.50 (2 H, s),
 6.93 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7.45 (1 H, s),
 7.54 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8.4 Hz),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (425)

7. 61 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
8. 21 (0.5 H, d, J = 2.3 Hz),
8. 32 (5 H, d, J = 2.3 Hz),
8. 48 (1 H, m)。

(立體異構物的混合物)

實施例 467 的化合物：

NMR ⁶⁷⁾ : ¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1. 49 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
1. 50 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
3. 49 (3 H, s),
4. 17 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
4. 19 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
5. 28 (2 H, s),
5. 40 (2 H, s),
6. 91 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
7. 22 - 7. 70 (9 H, m),
8. 08 (1 H, dd, J = 2.4 Hz,
8. 7 Hz),
8. 40 (1 H, d, J = 2.4 Hz)。

實施例 470 的化合物：

NMR ⁶⁸⁾ : ¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1. 44 - 1. 67 (12 H, m),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (426)

4 . 0 4 (3 H , s) ,
 4 . 1 0 - 4 . 3 3 (8 H , m) ,
 6 . 9 2 (2 H , d , J = 8 . 4 H z) ,
 7 . 3 7 (1 H , s) ,
 7 . 4 6 (1 H , s) ,
 7 . 5 2 - 7 . 6 3 (3 H , m) ,
 7 . 6 6 (1 H , d , J = 2 . 0 H z) ,
 7 . 7 5 (2 H , d , J = 8 . 4 H z) ,
 8 . 0 8 (2 H , d , J = 8 . 4 H z) ,
 8 . 2 0 (1 H , d , J = 2 . 2 H z) ,
 8 . 4 6 (1 H , d , J = 2 . 2 H z) ,
 1 1 . 4 3 (1 H , s) 。

實施例 4 7 1 的化合物：

NMR⁽⁶⁹⁾ : ¹H - NMR (CDCl₃) δ :

1 . 5 0 (3 H , t , J = 7 . 0 H z) ,
 1 . 5 3 (3 H , t , J = 7 . 0 H z) ,
 2 . 4 2 (3 H , s) ,
 3 . 9 6 (3 H , s) ,
 4 . 1 7 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,
 4 . 2 3 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,
 6 . 9 4 (1 H , d , J = 8 . 4 H z) ,
 7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,
 8 . 4 H z) ,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

五、發明說明 (427)

- 7.59 (1 H, s),
 7.60 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
 8.76 (1 H, d, J = 2.3 Hz),
 8.80 (1 H, d, J = 2.3 Hz)。

實施例 478 的化合物：

NMR ($^70^\circ$) : ^1H -NMR (CDCl₃) δ :

- 1.49 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.51 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 3.59 (3 H, s),
 3.59 (2 H, d, J = 6.3 Hz),
 3.94 (3 H, s),
 4.16 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4.22 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 5.08 (2 H, s),
 5.07 - 5.17 (1 H, m),
 5.17 - 5.27 (1 H, m),
 5.96 - 6.16 (1 H, m),
 6.92 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7.40 (1 H, s),
 7.54 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8.4 Hz),
 7.60 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
 7.98 (1 H, d, J = 2.4 Hz),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (428)

8.27 (1 H, d, J = 2.4 Hz)。

實施例 479 的化合物：

NMR ⁷¹⁾ : ¹H - NMR (CDCl₃) δ :

1.48 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.51 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 3.55 (3 H, s),
 3.89 (2 H, d, J = 1.7 Hz),
 3.94 (3 H, s),
 4.15 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4.21 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 5.09 (2 H, s),
 6.91 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7.43 (1 H, m),
 7.52 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8.4 Hz),
 7.59 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
 8.04 (1 H, d, J = 2.3 Hz),
 8.36 (1 H, d, J = 2.3 Hz),
 9.79 (1 H, t, J = 1.7 Hz)。

實施例 480 的化合物：

NMR ⁷²⁾ : ¹H - NMR (CDCl₃) δ :

1.50 (3 H, t, J = 7.0 Hz),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (429)

- 1 . 5 2 (3 H , t , J = 7 . 0 H z) ,
 3 . 6 0 (3 H , s) ,
 3 . 9 8 (3 H , s) ,
 4 . 1 6 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,
 4 . 2 3 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,
 5 . 2 2 (2 H , s) ,
 6 . 9 2 (1 H , d , J = 8 . 4 H z) ,
 7 . 5 0 (1 H , s) ,
 7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,
 8 . 4 H z) ,
 7 . 6 0 (1 H , d , J = 2 . 1 H z) ,
 8 . 5 7 (1 H , d , J = 2 . 5 H z) ,
 8 . 7 3 (1 H , d , J = 2 . 5 H z) ,
 1 0 . 5 0 (1 H , s) 。

實施例 4 8 2 的化合物：

N M R ⁷³) : ¹H - N M R (C D C l ₃) δ :

- 1 . 4 9 (3 H , t , J = 7 . 0 H z) ,
 1 . 5 1 (3 H , t , J = 7 . 0 H z) ,
 2 . 5 0 (3 H , s) ,
 3 . 6 0 (3 H , s) ,
 3 . 9 2 (2 H , s) ,
 3 . 9 4 (3 H , s) ,
 4 . 1 5 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (430)

- 4 . 2 2 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,
- 5 . 1 2 (2 H , s) ,
- 6 . 9 2 (1 H , d , J = 8 . 4 H z) ,
- 7 . 4 4 (1 H , s) ,
- 7 . 5 4 (1 H , d d , J = 2 . 1 H z ,
- 8 . 4 H z) ,
- 7 . 6 0 (1 H , d , J = 2 . 1 H z) ,
- 8 . 1 3 (1 H , d , J = 2 . 4 H z) ,
- 8 . 3 7 (1 H , d , J = 2 . 4 H z) 。

實施例 4 8 3 的化合物：

N M R ⁷⁴) : ¹H - N M R (C D C l ₃) δ :

- 1 . 5 0 (3 H , t , J = 7 . 0 H z) ,
- 1 . 5 2 (3 H , t , J = 7 . 0 H z) ,
- 2 . 4 1 (1 H , t , J = 6 . 6 H z) ,
- 4 . 0 1 (3 H , s) ,
- 4 . 1 6 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,
- 4 . 2 3 (2 H , q , J = 7 . 0 H z) ,
- 4 . 8 2 (2 H , d , J = 6 . 6 H z) ,
- 6 . 9 3 (1 H , d , J = 8 . 4 H z) ,
- 7 . 3 4 (1 H , s) ,
- 7 . 5 5 (1 H , d d , J = 2 . 0 H z ,
- 8 . 4 H z) ,
- 7 . 6 0 (1 H , d , J = 2 . 0 H z) ,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....
訂.....
線.....
.....

五、發明說明 (431)

8.10 (1 H, d, J = 2.3 Hz),
 8.40 (1 H, d, J = 2.3 Hz),
 11.38 (1 H, s)。

實施例 485 的化合物：

NMR ⁷⁵) : ¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.49 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.51 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 3.58 (3 H, s),
 3.95 (3 H, s),
 4.15 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4.22 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 5.08 (2 H, s),
 5.43 (1 H, dd, J = 1.1 Hz,
 11.1 Hz),
 5.89 (1 H, dd, J = 1.1 Hz,
 17.7 Hz),
 6.92 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7.17 (1 H, dd, J = 11.1 Hz,
 17.1 Hz),
 7.43 (1 H, s),
 7.54 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8.4 Hz),
 7.61 (1 H, d, J = 2.1 Hz),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (432)

8.27 (1 H, d, J = 1.3 Hz)。

實施例 486 的化合物：

NMR ⁷⁶) : ¹H - NMR (CDCl₃) δ :

1.49 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.51 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 3.58 (3 H, s),
 3.59 (3 H, s),
 4.15 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4.22 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 5.10 (2 H, s),
 5.43 (1 H, dd, J = 1.1 Hz,
 11.1 Hz),
 5.51 (2 H, s),
 5.89 (1 H, dd, J = 1.1 Hz,
 17.7 Hz),
 6.92 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7.18 (1 H, dd, J = 11.1 Hz,
 17.7 Hz),
 7.43 (1 H, s),
 7.54 (1 H, dd, J = 2.1 Hz,
 8.4 Hz),
 7.61 (1 H, d, J = 2.1 Hz),
 8.29 (2 H, d, J = 1.3 Hz)。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (433)

實施例 493 的化合物：

NMR⁷⁷) : ¹H - NMR (DMSO - d₆) δ :

- 1.35 (3H, t, J = 6.9 Hz),
 1.37 (3H, t, J = 6.9 Hz),
 2.72 (3H, s),
 4.11 (4H, m),
 7.09 (1H, d, J = 9.0 Hz),
 7.57 (1H, dd, J = 2.2 Hz,
 9.0 Hz),
 7.60 (1H, d, J = 2.2 Hz),
 7.89 (1H, brs),
 8.22 (1H, brs),
 8.44 (1H, s),
 8.70 (1H, d, J = 2.0 Hz),
 9.27 (1H, d, J = 2.0 Hz)。

實施例 497 的化合物：

NMR⁷⁸) : ¹H - NMR (CDCl₃) δ :

- 0.24 (6H, s),
 1.03 (9H, s),
 1.49 (3H, t, J = 7.0 Hz),
 1.51 (3H, t, J = 7.0 Hz),
 3.91 (3H, s),
 4.15 (2H, q, J = 7.0 Hz),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (435)

7.62 (1 H, d, J = 2.0 Hz),
 7.97 (1 H, dd, J = 8.8 Hz),
 8.25 (1 H, d, J = 2.2 Hz)。

實施例 507 的化合物：

NMR⁸⁰⁾ : ¹H-NMR (CDC₃) δ :

1.49 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.51 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 2.63 (3 H, s),
 4.10 - 4.27 (4 H, m),
 6.89 (1 H, d, J = 8.4 Hz),
 7.48 (1 H, dd, J = 2.1 Hz, 8.4 Hz),
 7.59 - 7.64 (3 H, m),
 7.74 (1 H, s),
 8.53 (1 H, d, J = 5.2 Hz)。

實施例 508 的化合物：

NMR⁸¹⁾ : ¹H-NMR (CDC₃) δ :

1.45 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 1.49 (3 H, t, J = 7.0 Hz),
 4.09 (2 H, q, J = 7.0 Hz),
 4.17 (2 H, q, J = 7.0 Hz),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (436)

- 6. 8 9 (1 H, d, J = 8. 4 H z),
- 7. 2 5 - 7. 3 2 (1 H, m),
- 7. 4 2 - 7. 4 6 (2 H, m),
- 7. 4 9 (1 H, d d, J = 2. 2 H z,
- 8. 4 H z),
- 7. 6 1 (1 H, d, J = 2. 2 H z),
- 7. 8 1 (1 H, s),
- 8. 0 8 - 8. 1 5 (3 H, m),
- 8. 5 7 (1 H, d d, J = 0. 6 H z,
- 5. 0 H z),
- 9. 2 0 (1 H, d d, J = 0. 6 H z,
- 1. 5 H z),
- 1 2. 1 1 (1 H, b r s)。

實施例 5 0 9 的化合物：

N M R ⁸²) : ¹H - N M R (C D C l₃) δ :

- 1. 4 7 (3 H, t, J = 7. 0 H z),
- 1. 5 0 (3 H, t, J = 7. 0 H z),
- 3. 8 1 (3 H, s),
- 4. 1 0 - 4. 2 4 (4 H, m),
- 6. 9 3 (1 H, d, J = 8. 4 H z),
- 7. 4 6 - 7. 5 5 (3 H, m),
- 8. 0 0 (1 H, d d, J = 1. 6 H z,
- 7. 8 H z),

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 (437)

8 . 2 1 (1 H , s) ,

8 . 7 4 - 8 . 7 6 (1 H , m) 。

實施例 5 2 1

按照實施例 1 和 1 4 7 所示相同方法，利用下列各種原料化合物分別可製得下列目的化合物。

○ 利用 5 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 吡咩以及 3 , 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同方法進行反應後，按照實施例 1 4 7 相同方法加水分解而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (5 - 羧基 - 2 - 吡咩基) 噻唑。

○ 利用 4 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 嘧啶以及 3 , 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同方法進行反應後，按照實施例 1 4 7 相同方法加水分解而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羧基 - 2 - 嘧啶基) 噻唑。

○ 利用 5 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 嘧啶以及 3 , 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同方法進行反應後，再依照實施例 1 4 7 同樣方法加水分解而得 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (5 - 羧基 - 2 - 嘧啶基) 噻唑。

○ 利用 6 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 吡咩以及 3 , 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (438)

方法反應後，再按實施例 1 4 7 相同方法進行加水分解而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (6 - 羧基 - 2 - 吡啶基) 噻唑。

○ 利用 4 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 吡咯以及 3, 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同方法反應後，再按實施例 1 4 7 相同方法進行加水分解而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羧基 - 2 - 吡咯基) 噻唑。

○ 利用 4 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 呋喃以及 3, 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同方法反應後，再按實施例 1 4 7 相同方法進行加水分解而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羧基 - 2 - 呋喃基) 噻唑。

○ 利用 5 - 乙氧基羰基 - 3 - (α - 溴化乙醯基) 呋喃以及 3, 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同方法反應後，再按實施例 1 4 7 相同方法進行加水分解而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (5 - 羧基 - 3 - 呋喃基) 噻唑。

○ 利用 4 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 噻吩以及 3, 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺，按照實施例 1 相同方法反應後，再按實施例 1 4 7 相同方法進行加水分解而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羧基 - 2 - 噻吩基) 噻唑。

○ 利用 5 - 乙氧基羰基 - 3 - (α - 溴化乙醯基) 噻吩

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....
裝.....訂.....線.....

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

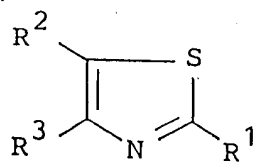
五、發明說明 (439)

以及 3, 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺, 按照實施例 1 相同方法反應後, 再按實施例 1 4 7 相同方法進行加水分解而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (5 - 羧基 - 3 - 噻唑基) 噻唑。

○ 利用 5 - 乙氧基羰基 - 2 - (α - 溴化乙醯基) 噻吩以及 3, 4 - 二乙氧基硫基苯甲醯胺, 按照實施例 1 相同方法反應後, 再按實施例 1 4 7 相同方法進行加水分解而得 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (5 - 羧基 - 2 - 噻唑基) 噻唑。

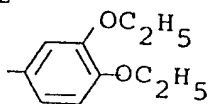
實施例 5 2 2

按實施例 1 及 1 3 8 同樣之方法, 使用適當之啓始原料, 得以下之化合物

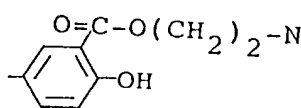


實施例

522



R³



R²
CH₃
CH₃ H

結晶形	熔點(°C)
(再結晶溶媒)	(塩)
黄色粉末状	119-122
(丙酮)	(3HCl)

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

裝 訂 線

五、發明說明 (440)

製劑例 1

2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基)	5 m g
) - 4 - (3 , 4 - 二羧基經基	
喹啉 - 6 - 基) 噻唑	
澱粉	1 3 2 m g
硬脂酸鎂	1 8 m g
乳糖	4 5 m g
<hr/>	
合計	2 0 0 m g

按照一般方法製成每錠中含有上述組成分的錠劑。

製劑例 2

2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基)	5 0 0 g
) - 4 - (2 - 氧基 - 苯駢噁唑	
- 5 - 基) 噻唑	
聚乙二醇 (分子量 : 4 0 0 0)	0 . 3 g
氯化鈉	0 . 9 g
聚氧化乙烯基山梨糖醇單油酸酯	0 . 4 g
偏過亞硫酸鈉	0 . 1 g
對 - 甲基苯甲酸	0 . 1 8 g
對 - 丙基苯甲酸	0 . 0 2 g
注射用蒸餾水	1 0 0 m l

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (441)

將上述對苯甲酸類，偏過亞硫酸鈉以及氯化鈉在攪拌中 80 °C 下溶解於上述蒸餾水中。所得溶液冷卻至 40 °C，依序溶解本發明化合物，聚乙二醇以及聚氧化乙烯基山梨糖醇單油酸酯，再加上注射用蒸餾水於上述溶液中，調整為最終容量，經過適當濾紙滅菌過濾後每按 1 ml 容量分裝在安瓶中調製成為注射劑。

藥理試驗：

依照下述方法進行本發明化合物有關藥理試驗。

(1) 對於人嗜中性白細胞產生 O_2^- 的作用

依照麥卡特氏等的方法 (參考 M. Markert et al: Methods in Enzymology, 105: p. 358~365, 1984 年) 調製人嗜中性白細胞。直言之，從正常健康成人所得的抗凝固處理的全部血液中，施加葡聚糖—低滲透壓處理而得白血球細胞，再利用費克—派格氏 (Ficoll-Paque) 的密度傾斜離心法而得嗜中性白細胞。

O_2^- 的產生乃按照克倫斯坦氏等人的方法 (參考 B. N. Cronstein, J. Exp. Med. 158, p. 1160~1177, 1983 年) 藉鐵細胞色素 C (ferricytochrome C) 法調查之。換言之，在黑倍斯緩衝漢克士的溶液 (Hepes-Buffered Hanks' pH 7.4) 中，於鐵細胞色素 C (1.3 mg/ml) 和細胞鬆弛素 B (cytochalasin B, 5 μ g/ml) 的共存中，37 °C 下，將嗜中性白細胞 (1×10^6 細胞) 用 3×10^{-7} M 的 N-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 (442)

醯基 - L - 甲硫基丁胺醯基 - L - 白胺醯基 - L - 苯基丙胺酸 (簡稱 f M L P) 刺激後, 在 4 分鐘裡所還原的鐵細胞色素 C 量藉分光光度計測定波長 550 nm 處的吸光度, 再求得和超氧化歧化酶 (Superoxide dismutase, 簡稱 S O D) 存在 (25.1 μ g/ml) 下吸光度的差值做為 O_2^- 的生產量。被驗藥物溶解於二甲亞碲中, 在添加 f M L P 前加入在嗜中性白細胞中, 37 $^{\circ}$ C 下, 施行 20 分鐘的預保溫培養處理。 O_2^- 生成抑制作用和溶劑中僅添加二甲亞碲者比較, 計算得 % 抑制率再以 50 % 抑制濃度 (I C₅₀) 表示之。

供試化合物：

1. 2 - (3 - 吡啶基) - 4 - 苯基噻唑 · 1 / 4 氯化亞鐵鹽
2. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - 苯基噻唑
3. 2, 4 - 二 (3 - 吡啶基) 噻唑
4. 2 - (3 - 吡啶基) - 4 - 甲基 - 5 - 乙氧基羰基噻唑 · 鹽酸鹽
5. 2 - (2, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫化羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑
6. 2 - (2 - 吡啶酮 - 3 - 基) - 4 - 苯基噻唑
7. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫化羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑
8. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二

五、發明說明 (443)

經基苯基) 噻唑·鹽酸鹽

9. 2 - (4 - 吡啶基) - 4 - (3, 4 - 二經基苯基)

噻唑·鹽酸鹽

10. 2 - (3 - 噻吩基) - 4 - (3, 4 - 二經基苯基)
噻唑

11. 2 - (2 - 噻吩基) - 4 - (3, 4 - 二經基苯基)
噻唑

12. 2 - (4 - 氧基 - 1, 4 - 二氫化喹啉 - 3 - 基)
- 4 - (3, 4 - 二經基苯基) 噻唑

13. 2 - (吡啶 - 2 - 基) - 4 - (3, 4 - 二經基苯基) 噻唑

14. 2 - (3, 4 - 二經基咪基) - 4 - (3, 4 - 二
氫化經基喹啉 - 6 - 基) 噻唑·溴氫酸鹽

15. 2 - (經基喹啉 - 3 - 基) - 4 - (3, 4 - 二經基
苯基) 噻唑

16. 2 - (吡咯 - 2 - 基) - 4 - (3, 4 - 二經基苯基) 噻唑

17. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (4 - 甲基
- 2 H - 1, 4 - 苯駢噻吡 - 3 (4 H) - 酮 - 6
- 基) 噻唑

18. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 - 經基
- 4 - 戊氧基苯基) 噻唑

19. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (4 - 甲基
磺醯基苯基) 噻唑

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (444)

20. 2-苯基-4-(3,4-二羥基苯基)噻唑鹽酸鹽
21. 2-(3,4,5-三甲氧基苯基)-4-(3,4-二羥基苯基)噻唑·鹽酸鹽
22. 2-(3,4-亞甲二氧基苯基)-4-(3,4-二羥基苯基)噻唑
23. 2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-(3-羥基喹啉-6-基)噻唑
24. 2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-(7-羥基-3,4-二氫化羥基喹啉-6-基)噻唑
25. 2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-(2-氧基吡啶-5-基)噻唑
26. 2-(3,4-二氫化羥基喹啉-6-基)-4-(3,4-二羥基苯基)噻唑·鹽酸鹽
27. 2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-(3-氧基-3,4-二氫-2H-1,4-苯駢吡啶-6-基)噻唑
28. 2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-(3,4-二氫-2H-1,4-苯駢吡啶-6-基)噻唑·鹽酸鹽
29. 2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-(2-氧基苯駢咪唑-5-基)噻唑
30. 2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-(3-氧基-4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯駢

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝——訂——線

五、發明說明 (445)

嘮咩 - 6 - 基) 嘮咩

31. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (10 - 乙醯基吩嘮咩 - 2 - 基) 嘮咩

32. 2, 4 - 二 (3, 4 - 二甲氧基苯基) 嘮咩

33. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 - 乙醯基胺基 - 4 - 羥基苯基) 嘮咩

34. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫化羥基喹啉 - 7 - 基) 嘮咩

35. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2 - 氧基苯駢嘮咩 - 6 - 基) 嘮咩

36. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2 - 氧基苯駢嘮咩 - 5 - 基) 嘮咩

37. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 - 胺基 - 4 - 羥基苯基) 嘮咩 · 二鹽酸鹽

38. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (1 - 甲基 - 3, 4 - 二氫化羥基喹啉 - 7 - 基) 嘮咩

39. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 5 - 二羥基苯基) 嘮咩

40. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2, 5 - 二羥基苯基) 嘮咩

41. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2, 6 - 二羥基苯基) 嘮咩

42. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2 - 氧基 - 3 - 甲基苯駢嘮咩 - 6 - 基) 嘮咩

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (446)

43. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 - 硝基 - 4 - 乙醯基胺基苯基) 噻唑
44. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (1, 3 - 二甲基 - 2 - 氧基苯駢咪唑 - 5 - 基) 噻唑
45. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2, 4 - 二羥基苯基) 噻唑
46. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 - 硝基 - 4 - 氯苯基) 噻唑
47. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 5 - (3, 4 - 二氫化羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑
48. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 4 - 二乙醯基胺基苯基) 噻唑
49. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2 - 氧基 - 3 - 甲基苯駢噁唑 - 5 - 基) 噻唑
50. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 - 硝基苯基) 噻唑
51. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 5 - 二胺基 - 4 - 羥基苯基) 噻唑
52. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3, 5 - 二硝基 - 4 - 羥基苯基) 噻唑
53. 2 - (3 - 甲氧基 - 4 - 硫基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫化羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑
54. 2 - (3 - 甲氧基 - 4 - 甲基亞磺醯基苯基) - 4 - (3, 4 - 二氫化羥基喹啉 - 6 - 基) 噻唑

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明 (447)

55. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2 - 氧基
苯駢嘔啞 - 6 - 基) 嘍啞
56. 2 - (3 - 吡啶基) - 4 - (4 - 氟苯基) 嘍啞 ·
1 / 3 氯化亞鐵鹽
57. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2, 3 -
二氧基 - 1, 2, 3, 4 - 四氫喹啉 - 6 - 基)
嘍啞
58. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯甲醯基) - 4 - (3,
4 - 二氫化羥基喹啉 - 6 - 基) 嘍啞
59. 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3, 4 -
二氫化羥基喹啉 - 6 - 基) 嘍啞
60. 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (2 - 吡啶
基) 嘍啞 · 鹽酸鹽
61. 4 - (3, 5 - 二羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二
乙氧基苯基) 嘍啞
62. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 -
二乙氧基苯基) 嘍啞
63. 4 - (4 - 羥基磺醯氧基苯基) - 2 - (3, 4 -
二甲氧基苯基) 嘍啞
64. 4 - (4 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基
苯基) 嘍啞
65. 4 - (3 - 乙醯胺基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - (3,
4 - 二乙氧基苯基) 嘍啞
66. 4 - (4 - 羥基 - 3 - 胺基苯基) - 2 - (3, 4

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(448)

—二乙氧基苯基) 噻唑·二鹽酸鹽

67. 4-(4-氟基苯基)-2-(3,4-二乙氧基苯基) 噻唑

68. 4-(3,4-二氫化羥基喹啉-6-基)-2-(4-甲氧基-3-丙氧基苯基) 噻唑

69. 4-(4-脲基苯基)-2-(3,4-二乙氧基苯基) 噻唑·鹽酸鹽

70. 4-(2,4,6-三羥基苯基)-2-(3,4-二甲氧基苯基) 噻唑

71. 4-(3,5-二胺基苯基)-2-(3,4-二甲氧基苯基) 噻唑·二鹽酸鹽

72. 4-(4-胺基苯基)-2-(3,4-二乙氧基苯基) 噻唑鹽酸鹽

73. 4-[1-羥基-1-(3,4-二甲氧基苯基)甲基]-2-(3,4-二乙氧基苯基) 噻唑

74. 4-[4-甲氧基-3-(4-乙基-1-六氫吡啶基) 苯基]-2-(3,4-二羥基苯基) 噻唑·三鹽酸鹽

75. 4-(4-氯基苯基)-2-(3,4-二乙氧基苯基) 噻唑

76. 4-(3,4-二乙醯基氧基苯基)-2-(3-吡啶基) 噻唑

77. 4-[2-(3,4-二甲氧基苯基) 噻唑-4-基] 苯基-β-D-葡糖基吡喃糖基屈酸甲酯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明 (449)

78. 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [4 - (2, 3, 4, 6 - 四 - O - 乙醯基 - β - D - 葡糖基吡喃糖基氧基) 苯基] 噻唑
79. 4 - (3, 5 - 二乙醯基氧基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
80. 4 - (4 - 羥基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
81. 4 - (4 - 甲氧基羰基甲氧基 - 3 - 甲氧基羰基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
82. 4 - (4 - 羥基 - 3 - 胺基甲醯基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
83. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 丙烯基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
84. 4 - {3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - (2 - 甲基 - 2 - 丙烯基) 苯基} - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
85. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 甲基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
86. 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - (3 - 甲氧基 - 4 - 乙氧基苯基) 噻唑
87. 4 - (3 - 羧基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
88. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - (3 - 甲氧基 - 4 - 乙氧基苯基) 噻唑

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (450)

89. 4 - (3 - 胺基 - 4 - 羥基 - 5 - 甲氧基羰基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
90. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 丙基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
91. 4 - (3 - 羧基 - 6 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
92. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基苯基 - 2 - (3 - 乙氧基 - 4 - 甲氧基苯基)) 噻唑
93. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 異丁基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
94. 4 - {3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - (2 - 羥基乙基) 苯基} - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
95. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 胺基 - 6 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
96. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 胺基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
97. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 乙醯基氧基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
98. 4 - (3 - 乙基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
99. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) - 5 - 甲基噻唑
100. 4 - (3 - 羧基 - 4, 6 - 二羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑

五、發明說明 (451)

101. 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 5 - 硝基 - 6 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
102. 4 - (3 - 甲氧基羰基 - 5 - 胺基 - 6 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
103. 4 - (3 - 羧基 - 5 - 丙烯基 - 6 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
104. 4 - (3 - 羧基 - 6 - 羥基苯基) - 2 - (3 - 乙氧基 - 4 - 甲氧基苯基) 噻唑
105. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - (3, 4 - 二甲氧基苯基) 噻唑 (日本專利特公昭 46 - 15935 號公報所記載中實施例 3 所示化合物)
106. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基苯基) - 2 - 苯基噻唑 (日本專利特公昭 46 - 15935 號公報所記載中實施例 3 所示化合物)
107. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 甲氧基苯基) - 2 - 苯基噻唑 (日本專利特公昭 46 - 15935 號公報所記載中實施例 4 的化合物)
108. 4 - (3 - 羧基 - 4 - 甲氧基苯基) - 2 - 苯甲基噻唑 (日本專利特公昭 46 - 15935 號公報所記載中實施例 9 所示化合物)
109. 4 - (3 - 羧基苯基) - 2 - (4 - 氯苯基) 噻唑 (日本專利特公昭 46 - 15935 號公報中所包括的化合物。)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明 (452)

- 1 1 0 . 4 - (3 - 羧基 - 5 - 經基苯基) - 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (日本專利特公昭 4 6 - 1 5 9 3 5 號公報中所包括的化合物) 。
- 1 1 1 . 4 - (3 - 羧基 - 4 - 經基苯基) - 2 - (3 , 4 - 二丁氧基苯基) 噻唑 (日本專利特公昭 4 6 - 1 5 9 3 5 號公報中所包括的化合物)
- 1 1 2 . 4 - (3 - 羧基 - 6 - 甲氧基苯基) - 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 (日本專利特公昭 4 6 - 1 5 9 3 5 號公報中所包括的化合物)
- 1 1 3 . 4 - (2 - 經基 - 3 - 胺基 - 5 - 羧基苯基) - 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑 · 鹽酸鹽
- 1 1 4 . 4 - (2 - 經基 - 3 - 丙基 - 5 - 羧基苯基) - 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
- 1 1 5 . 4 - (6 - 羧基 - 2 - 吡啶基) - 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) 噻唑
- 1 1 6 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - 苯基噻唑
- 1 1 7 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - { 3 - 甲氧基羧基 - 4 - [2 - (1 - 六氫吡啶基) 乙基胺基] 苯基 } 噻唑 · 二鹽酸鹽
- 1 1 8 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [4 - 經基 - 3 - (2 - 二甲基胺基乙氧基羧基) 苯基] 噻唑 · 三鹽酸鹽
- 1 1 9 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 羧基 - 5 - 吡咯基) 噻唑

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明 (453)

- 1 2 0 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羥基 - 3 - 正壬基氧基羰基苯基) 噻唑
- 1 2 1 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 甲氧基羰基 - 5 - 呋喃基) 噻唑
- 1 2 2 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 羧基 - 5 - 呋喃基) 噻唑
- 1 2 3 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 二甲基胺基羰基 - 6 - 吡啶基) 噻唑
- 1 2 4 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 乙醯基 - 1 - 吡咯基) 噻唑
- 1 2 5 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 甲氧基苯基) 噻唑
- 1 2 6 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 乙基苯基) 噻唑
- 1 2 7 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 羥基甲基 - 5 - 吡咯啶基) 噻唑
- 1 2 8 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [2 - (4 - 甲基 - 1 - 六氫吡啶基) 羰基 - 6 - 吡啶基] 噻唑
- 1 2 9 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 羧基 - 5 - 噻吩基) 噻唑
- 1 3 0 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 甲基 - 7 - 羧基 - 5 - 苯駢呋喃基) 噻唑
- 1 3 1 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 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 (454)

氧基羰基 - 2 - 噻唑基) 噻唑

1 3 2 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羧基 - 2 - 噻唑基) 噻唑

1 3 3 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 羥基 - 3 - 羥基甲基苯基) 噻唑

1 3 4 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (4 - 乙氧基 - 3 - 羧基苯基) 噻唑

1 3 5 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 5 - 吡啶基) 噻唑 · 鹽酸鹽

1 3 6 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 正丁氧基羰基 - 4 - 正丁氧基苯基) 噻唑

1 3 7 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 正丁氧基苯基) 噻唑

1 3 8 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 正丙氧基苯基) 噻唑

1 3 9 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 , 2 - 二甲基 - 7 - 羧基 - 2 , 3 - 二氫苯駢呋喃 - 5 - 基) 噻唑

1 4 0 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - [3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - (1 - 丙烯基) 苯基] 噻唑

1 4 1 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 甲基 - 3 - 羧基 - 5 - 吡啶基) 噻唑

1 4 2 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 甲醯基苯基) 噻唑

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明 (455)

- 1 4 3 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 6 - 吡啶基) 噻唑
- 1 4 4 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (2 - 羧基 - 5 - 吡啶基) 噻唑
- 1 4 5 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 溴化苯基) 噻唑
- 1 4 6 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 二甲基胺基苯基) 噻唑
- 1 4 7 . 2 - (3 , 4 - 二乙氧基苯基) - 4 - (3 - 羧基 - 4 - 羥基 - 5 - 乙烯基苯基) 噻唑
- 1 4 8 . 2 - (3 , 4 - 二甲氧基苯基) - 4 - (3 , 4 - 二氫化喹啉酮 - 4 - 基) 噁唑

上述供試化合物的試驗結果示於第 1 5 表，本發明化合物中，供試化合物 N o . 6 2 , 8 7 , 8 8 , 9 1 , 9 2 和 1 0 4 和已知技術所得化合物間的比較試驗結果另示於第 1 6 表。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (457)

第 1 5 表 (續)

供試化合物 (No.)	IC ₅₀ (μ M)	供試化合物 (No.)	IC ₅₀ (μ M)
41	0.2	61	0.003
42	0.08	62	0.01
43	0.4	63	0.03
44	0.04	64	0.04
45	0.3	65	0.06
46	1	66	0.06
47	1	67	0.07
48	1	68	0.08
49	0.07	69	0.1
50	0.4	70	0.2
51	0.03	71	0.2
52	0.2	72	0.2
53	0.4	73	0.2
54	0.8	74	0.3
55	0.07	75	0.6
56	1	76	0.6
57	0.3	77	0.8
58	1.0	78	1
59	0.08	79	0.0013
60	0.05	80	0.01

(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 (458)

第 15 表 (續)

供試化合物 (No.)	IC ₅₀ (μ M)	供試化合物 (No.)	IC ₅₀ (μ M)
81	0.026	95	0.0087
82	0.06	96	0.023
83	0.04	97	0.1
84	0.02	98	0.083
85	0.08	99	0.72
86	0.033	100	0.048
87	0.0048	101	0.01
88	0.1	102	0.069
89	0.007	103	0.094
90	0.008	104	0.034
91	0.023	113	0.025
92	0.02	114	0.1
93	0.012	115	0.08
94	0.18		

(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

修正
 年 月 日
 補充

 A 6
 B 6

五、發明說明 (459)

第 1 5 表 (續)

供試化合物 (No)	I C 50 (μ M)	供試化合物 (No)	I C 50 (μ M)
116	0.37	136	0.13
117	0.46	137	0.11
118	0.56	138	0.14
119	0.024	139	0.1
120	0.49	140	0.0047
121	0.038	141	0.094
122	0.019	142	0.12
123	0.38	143	0.27
124	0.12	144	0.035
125	0.19	145	0.11
126	0.014	146	0.11
127	0.02	147	0.01
128	0.58	148	21
129	0.082		
130	0.24		
131	0.19		
132	0.05		
133	0.0092		
134	0.13		
135	0.035		

(請先閱讀請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

三、發明說明 (460)

第 1 6 表

	供試化合物 (NO.)	I C ₅₀ (μ M)
本 發 明 化 合 物	6 2	0 . 0 1
	8 7	0 . 0 0 4 8
	8 8	0 . 1
	9 1	0 . 0 2 3
	9 2	0 . 0 2
	1 0 4	0 . 0 3 4
已 知 技 術 化 合 物	1 0 5	1 . 0
	1 0 6	N E
	1 0 7	N E
	1 0 8	N E
	1 0 9	N E
	1 1 0	0 . 6 6
	1 1 1	8 . 3
	1 1 2	8 . 7

N E : 示無效

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....裝.....

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (461)

(2) 對於鼠心臟冠狀動脈閉鎖一再灌流時所發生心室性不整脈的影響。

試驗動物使用 S D 雄鼠 (7 ~ 10 週齡, 250 ~ 350 g 重)。供試化合物溶解於生理食鹽水中, 按照 $33 \mu\text{g} / \text{kg}$ 的用藥量以溶液狀態投與。經戊巴比妥麻醉, 人工呼吸下剖胸, 以絲絨結紮左冠狀動脈前下行支管 10 分鐘, 然後再使之暢流並觀察 10 分鐘。由標準四肢第 II 誘導心電圖記錄調查所發生心室性不整脈的情形。上述結紮 5 分鐘前將試驗化合物按 $1 \text{mg} / \text{kg}$ 用藥量施行靜脈投與。

上述供試化合物投與試驗群和生理食鹽水投與對照群的試驗結果示於第 17 表。

第 17 表

供試化合物	再灌流時心室性 細動持續時間 (秒鐘)	死亡率 (%)
No. 37	16.6	20
對照群 (生理食鹽水)	89.9	60

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (462)

(3) 對於腎臟的虛血再灌流腎障礙之影響

本試驗中，以體重大約 250 g 的 SD 雄鼠，並經 18 小時斷食後供用。供試化合物用 20% 或 40% 二甲基甲藍胺溶解以溶液狀態按 1 ml / kg 的用藥量投與之。摘取鼠的右腎臟，將左腎動脈血液遮斷 60 分鐘後再讓血流暢通。供試化合物在血流再暢流 15 分鐘前，按 3 mg / kg 的用藥量進行靜脈投與，自流再暢流 24 小時和 48 小時後採血，利用日本和光純藥工業公司製品的肌酸酐 (Creatinine) 試劑 (mg / 100 ml) 測定血漿肌酸酐，並計算其平均值和標準誤差值 (mean ± SE)，其結果示於第 18 表。

.....
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)
.....

裝.....
訂.....
線.....

五、發明說明 463)

第 1 8 表

供試化合物	2 4 小時	4 8 小時
對照 (20% 二甲基甲醯胺)	3.64 ± 0.44	3.37 ± 0.77
No. 8	2.21 ± 0.19	2.04 ± 0.40
對照 (40% 二甲基甲醯胺)	3.30 ± 0.38	3.37 ± 0.72
No. 33	2.63 ± 0.47	1.76 ± 0.18

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

(4) 對於鼠心臟的冠狀動脈閉鎖一再灌流液所引起心肌壞死的作用

本試驗中使用 S D 雄鼠 (7 ~ 10 週齡, 250 ~ 350 g 重), 並以組織內的肌酸磷酸激酶 (Creatine phosphokinase, 簡稱 C P K) 活性做為心肌壞死的指數。

供試化合物用少量的 1 N 氫氧化鈉水溶液溶解後, 再以生理食鹽水稀釋按照 1 m l / k g 的用藥量投與之。經戊巴比妥麻醉, 人工呼吸下剖胸, 再用絲線結紮左冠狀動

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (464)

脈前下行支管 1 2 分鐘，然後再行灌流。繼之閉胸並從麻醉下覺醒。再灌流 2 小時後在麻醉下摘取心臟，將虛血部分均質化後測定所含的肌酸磷酸激酶活性。供試化合物係在上述結紮 5 分鐘前按照 6 m g / k g 的用藥量行靜脈內投與之。

化合物投與試驗群和氫氧化鈉生理食鹽水投與對照群的比較結果示於第 1 9 表。

： 斷，並計算其平均值和標準誤差值 (m e a n ± S E)，其結果示於第 1 8 表。

第 1 9 表

	n	組織內肌酸磷酸激酶活性 (U / m g 蛋白) Mean ± S. B.
對照群		14.86 ± 0.89
供試化合物 N o . 6 2		19.53 ± 1.56*

* : $p < 0.05$ 2 行程阿諾巴分析 (2 Way Anova Analysis) (和對照群比較)

n : 試驗重複數

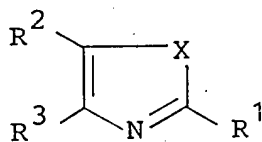
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

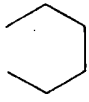
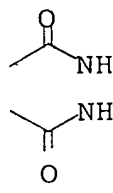
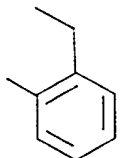
裝
訂
線

附件三：

修正
本 年 第 四 次
請 查 82. 8. 2

各取代基與實施例之關係表



取代基		實施例
R ² ：	水素原子	有多數例子
	苯基	84
	鹵素原子	86
	低級烷氧羰基	87、158、222
	做為取代基具有低級 烷基之胺基低級烷基	319
	二羥基喹啉	96
R ² 與R ³ 之結合：	基 	98
	基 	223
	基 	99、100

取代基		實施例
X:	硫原子	有多數例子
	氧原子	136
R ¹ ; R ³ :	苯基(1-5個)	
	C ₁ -C ₁₈ 烷氧基	有多數例子
	三低級烷基取代甲矽 烷氧基	101、497、498
	低級 烷基	33、34、46、111、199、278、284、 295、319、350、368、395、396、 421、445、468、506
	經基	有多數例子
	低級烯基氧基	125、256、311、314、343、345、347
	低級烷基硫基	37、115
	苯基 (該苯環上具有烷氧 基在苯環上做為取代 基之噻唑基羧基及經 基所成群中選擇基者)	43、410、411、429、469、470

取代基	實施例
低級烷基亞碳醯基	118
低級烷基磺醯基	45、121
鹵素原子	55、80、82、90、109、113、122、134、 179、192、193、195、272、286、349、 430、473、474、476
硝基	77、80、103、105、110、154、173、 180、187、188、189、194、264、265、 269、270、307、315、471
$-(A)_l - N \begin{matrix} / & R^8 \\ & \backslash \\ & R^9 \end{matrix}$ $l=0$ R ⁸ , R ⁹ : 氫原子	55、70、91、101、104、120、156、181、 197、198、208、232、233、258、268、 271、272、283、285、298、300、310、320、
低級烷基	123、178、234、426、442、482、499、 500、505
低級烷醯基	66、76、77、81、159、175、296、327、 332、434、504
做為取代基具有烷基 之胺基低級烷基	201

取代基	實施例
六氫吡啶基— 低級烷基	378、389
雜環	187、188、189、191、204、205
(雜環上之取代基) 低級烷醯基	202、203
(雜環上之取代基) 低級烷基	173、180、181、186、206、207 209、210、211、216、218、372、 403
A: $l=1$ 低級烯基	209、213、218、426、482
$\begin{array}{c} \text{—C—} \\ \\ \text{O} \end{array}$	120、216、217、233、234、258
低級烷醯基	116、450、480、481
R ¹ , R ³ : 低級烷醯氧基	119、213、229、230、301、472
烷氧基羰基	有多數例子
氨基	170、273、340、431

取代基	實施例
四氫吡喃基氧基 (1-4 個) 羥基 低級烷氧基 羰基 苯基低級烷氧基 低級烷鹽氧基 取代低級烷基 低級烷鹽氧基	171、176、183、184
脘基	172
羥基磺基氧基	174、185
R^1, R^3 : 低級烷氧基羰基取代 低級烷氧基	255
羰基取代低級烷氧基	257
氫硫基	263
低級烷氧基置換 低級烷氧基	266、267、327、444、447、448、 449、450、452、467、474、478、 479、480、482、484、486、501、 502、503、506
具有羥基之低級烷基	297、298、324、326、412、423、 442、452、483、498
低級烯基	260、262、274、277、316、342、 344、346、348、384、385、422、 447、449、451、478、485、486 501、519

取代基	實施例
具有低級烷基為取代基的胺基硫基羧基氧基	322
具有低級烷基為取代基之胺基羰基硫基	323
低級烷醯基取代低級烷基	325、417、479
羧基	有多數例子：
低級伸烷基二氧基	24、30、47
$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{OR}^{21} \\ \parallel \quad / \\ \text{-P} \\ \backslash \quad \quad \quad \\ \text{OR}^{22} \end{array}$ <p>R²¹, R²² 氫原子：</p>	386
低級烷基：	
苯基低級烷氧基羰基	383、467、477
環烷基	
低級烯基	428、503
低級烷氧基羰基取代低級烷基	

取代基	實施例
羧基取代— 低級烷基	425
低級烷氧基羰基 取代低級烯基	484
羧基取代 低級烯基	427
低級烷基 磺醯氧基 鹵素原子	443
低級烷氧基取代低級 烷氧基羰基	447、448、449、450、452、 484、485、486、501、502、 503、506
鹵素取代 低級烯基	502
苯基低級烷氧基	476、477
R ¹ , R ³ : 具有 1~2 個氮原子、 氧原子或硫原子之 5~ 15 環之單環、雙環或 三環構造之雜環殘基	2-5、8-10、12、13、15-17、 19、21、52、58、64、82-91、 97-99、100、133、134、221、 225、229、489
雜環之取代基 (1~3 個) 氧基	3、6、14、18、20、25、27-29、 32、35、36、48-53、56、59、61、 67-69、71、75、78、92-95、102、 106-129、131、135、160-168、177、 200、228、230、520

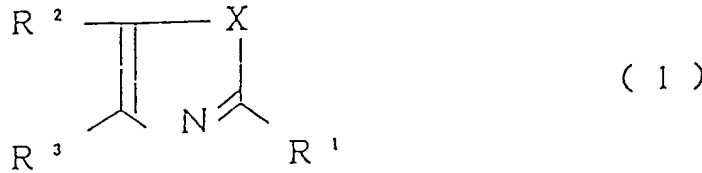
取代基	實施例
烷基	29、35、36、42、48、61、62、71、75、78、102、387、388、399、405、409、440、441、446、490、493、494、507
苯甲醯基	40
低級烷醯基	44、57、63
羥基	50、53
羧基	369、371、381、391、399、406、408、409、414、419、420、436-440、521
低級烷氧基— 羧基	273、274、390、404、407、446、488、491、495、496、509
低級烷基硫基	54
$R^1, R^3:$ $\begin{array}{c} R^{23} \\ \diagup \\ -A-N \\ \diagdown \\ R^{24} \end{array}$ $R^{23}, R^{24}: \text{氫原子}$	494
低級烷基	392、402、493
5—6環之飽和雜環	400

取代基	實施例
低級烷基	
氨基	492、520
具有羥基之低級烷基	397
苯基胺基硫基— 羰基	508
具有低級烷基之胺 基低級烷氧基羰基	401
R ¹ , R ³ : 低級烷基	87
低級烷氧基羰基— 低級烷基	88
低級烷氧基羰基	222
胺基甲醯基低級烷基	89
具有氧基或羥基為取 代基之 2, 3-二羥 基苊基	60

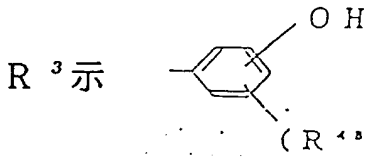
取代基	實施例
於苯環上做為取代基 含有低級烷氧基 之 低級烷基之上，做為 取代基含有遷基之苯 基低級烷基	126、128、226
苯環上做為取代基含 有低級烷氧基之苯甲 基	127、227
苯環上做為取代基含 有低級烷氧基之苯基 低級烯基	129、135、231
R^1, R^2 六氫吡啶環上做為取 代基含有低級烷基之 六氫吡啶低級烷基	224
金鋼烷基	31

四、中文發明摘要(發明之名稱：新穎噻唑衍生物、嘔唑衍生物及抑制活性氧用藥學組成物)

本發明乃含有以下列一般式(1)所示噻系衍生物或其鹽類為有效成分的活性氧抑制劑有關者。



[上式中，R¹示苯環上具有1~3個低級烷基為取代基的苯基，或具有低級伸烷基氧基的苯基等。R²示氫原子，苯基，鹵素原子，低級烷基羰基，低級烷基，具有低級烷基為取代基的胺基低級烷基或二氫化羥基噻啉基。



，(上式中，R⁴示羥基，羧基，低級烯基，或低級烷基。m示0，1或2。) Z示硫原子或氧原子。]

英文發明摘要(發明之名稱：)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

修正
317136 補充

公告本

A8
B8
C8
D8

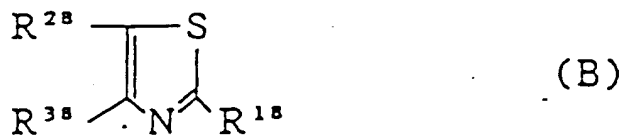
六、申請專利範圍

第 8 0 1 0 9 4 1 0 號 專 利 申 請 案

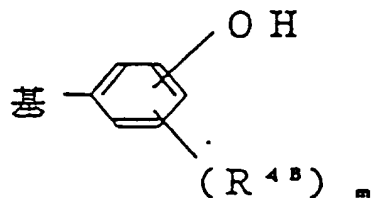
中 文 申 請 專 利 範 圍 修 正 本

民 國 8 6 年 5 月 修 正

1. 一種噻唑衍生物或其鹽類，其特徵為具有下列一般式 (B) 所示者：



[上 式 中 ， R^{1B} 示 苯 環 上 可 具 有 1 ~ 3 個 $C_1 \sim C_6$ 烷 氧 基 為 其 取 代 基 的 苯 基 ， 具 有 $C_1 \sim C_4$ 伸 烷 基 二 氧 基 的 苯 基 ， 可 具 有 氧 基 的 吡 啶 基 ， 噻 吩 基 ， 2 - 羥 喹 啉 基 ， 吡 嘧 基 ， 吡 咯 基 ， 可 具 有 氧 基 的 喹 啉 基 或 3 ， 4 - 二 氫 2 - 羥 喹 啉 基 ； R^{2B} 示 氫 原 子 ； R^{3B} 示



(R^{4B} 示 $C_1 \sim C_{18}$ 烷 氧 基 ， $C_1 \sim C_6$ 烷 基 ， 羥 基 ， $C_2 \sim C_6$ 烯 基 氧 基 ， (在 苯 環 上 可 具 有 選 自 ； (a) 在 噻 唑 環 上 具 有 苯 基 為 取 代 基 之 噻 唑 基 (該 苯 基 之 苯 環 上 可

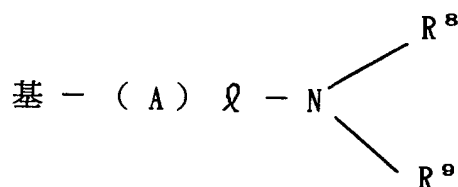
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍

具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基) , (b) 羧基以及 (c) 羥基所構成基群之基作為取代基之苯基) , 鹵素原子 , 硝基 ,



(上式中 , A 示 C₁ ~ C₆ 伸烷基或 -C- 基 ; ρ 示 0 或 1 ; R⁸ 和 R⁹ 可為相同或不同構造 , 表示氫原子 , C₁ ~ C₆ 烷基 , C₁ ~ C₆ 烷醯基 , 或可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷基 ; 另外 , R⁸ 和 R⁹ 可介由氮原子或氧原子與不介由氮原子或氧原子、再連同所結合的氮原子互相結合形成飽和或不飽和的 5 ~ 6 節雜環 (該雜環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷醯基或 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基)) , C₁ ~ C₆ 烷醯基 , 氰基 , 具 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基 , 可具羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基 , C₂ ~ C₆ 烯基 , 具 C₁ ~ C₆ 烷醯基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基 , 具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羧基 , 苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羧基 , C₂ ~ C₆ 炔基 , 具羧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基 , 具羧基取代的 C₂ ~ C₆ 烯基 , 以及具 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基羧基 ; m 示 0 , 1 或 2 } 或 ② 在苯環上

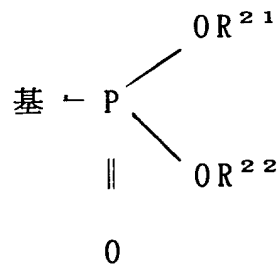
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

可具有 1 ~ 3 個選自 C₁ ~ C₆ 烷醯氧基，羥基磺醯氧基，氨基，脞基，硝基，C₁ ~ C₆ 烷基硫基，C₁ ~ C₆ 烷基磺醯基，（可具有 1 ~ 4 個選自羥基、C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基、苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基、具羥基或 C₁ ~ C₆ 烷醯氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基以及 C₂ ~ C₆ 烷醯氧基所構成基群中之基為其取代基的四氫吡喃基氧基），（在苯環上可具有選自（a）在噻唑環上具有苯基為取代基之噻唑基（該苯基之苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基）；（b）羧基以及（c）羥基所構成基群之基作為取代基的苯基），具有羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基；及



（上式中，R²¹和 R²²示 C₁ ~ C₆ 烷基）所構成基群中之基為取代基的苯基；③具有 C₁ ~ C₄ 伸烷基二氧基的苯基；④ C₁ ~ C₆ 烷基；⑤ C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基烷基；⑥ C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基；⑦胺甲醯基 C₁ ~ C₆ 烷基；⑧可具有氧基或 / 和羥基為取代基的 2, 3 - 二氫茚基；⑨苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基而且 C₁ ~ C₆ 烷基上可具有羥基為其取代基的苯基 C₁ ~ C₆ 烷基；⑩苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基為其取代基的苯甲醯基；

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂
線

六、申請專利範圍

① 苯環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基為其取代基的苯基 $C_2 \sim C_6$ 烯基；② 或在六氫吡啶環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷基作為取代基的六氫吡啶基 $C_1 \sim C_6$ 烷基；但 R^{4B} 為 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基取代 $C_1 \sim C_6$ 烷基，羧基， $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基或羧基取代 $C_1 \sim C_6$ 烷基時， m 示 2；但 R^{1B} 示在苯環上有 1 ~ 3 個 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基或有 $C_1 \sim C_4$ 伸烷二氧基為其取代基之苯基， m 為 1 時， R^{4B} 不可為在羥基之鄰位取代，羥基， $C_1 \sim C_6$ 烷氧基或 $C_1 \sim C_6$ 烷醯氧基； R^{3B} 不可為具有 $C_1 \sim C_4$ 伸烷二氧基之苯基；又， R^{1B} 為在苯環上具有 1 ~ 3 個 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基作為取代基之苯基，或具有 $C_1 \sim C_4$ 伸烷二氧基之苯基時， m 不可為 0；但 R^{3B} 示胺基甲醯 $C_1 \sim C_6$ 烷基或 $C_1 \sim C_6$ 烷氧羰基 $C_1 \sim C_6$ 烷基時， R^{1B} 不可為未取代之吡啶基）。

2. 一種噻唑衍生物或其鹽類，其特徵為具有下列一般式 (C) 所示者：

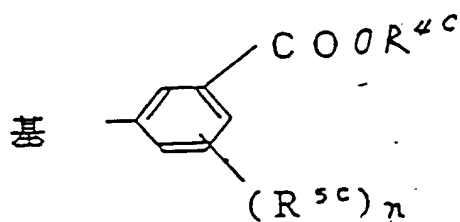


〔上式中， R^{1c} 示苯環上可具有 1 ~ 3 個 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基為其取代基的苯基； R^{2c} 示氫原子； R^{3c} 示

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

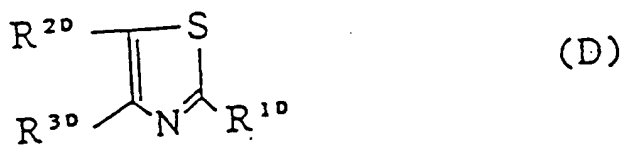
訂
線

六、申請專利範圍



(上式中， R^{4c} 示氫原子， $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷基，苯基
 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷基或具 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷氧基取代的 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$
烷基； R^{5c} 示胺基， $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷氧基 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷基，
 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷基，硝基， $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ 烯基， $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷
醯基，具有鹵素原子的 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ 烯基，苯基 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$
烷氧基，鹵素原子或具羥基取代的 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷基； n 示
2))。

3. 一種噻唑衍生物或其鹽類，其特徵為具有下列一
般式 (D) 所示者：



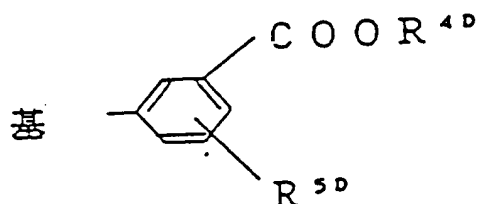
[上式中， R^{1D} 示在苯環上可具有 1 ~ 3 個 $\text{C}_1 \sim$
 C_6 烷氧基為其取代基的苯基； R^{2D} 示氫原子； R^{3D} 示

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

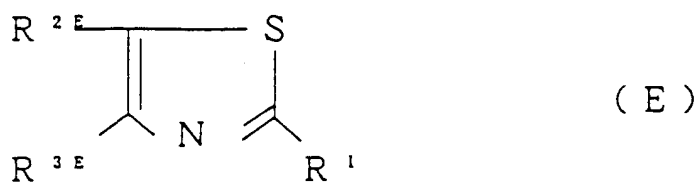
線

六、申請專利範圍



(上式中，R^{4D}示氫原子或C₁～C₆烷基；R^{5D}示胺基，C₁～C₆烷氧基羰基，C₁～C₆烷氧基，硝基，C₂～C₆烯基氧基，具C₁～C₆烷氧基取代的C₁～C₆烷氧基，氫硫基，C₁～C₆烷醯氧基，可具有C₁～C₆烷基為取代基的胺基羰硫基，可具有C₁～C₆烷基為取代基的胺基巯氧基，具羰基取代的C₁～C₆烷氧基或可具有鹵素原子的C₁～C₆烷基磺醯氧基)]。

4. 一種噻唑衍生物或其鹽類，其特徵為具有下列一般式(E)所示者：



{ 上式中，R¹示①苯環上可具有1～5個選自C₁～C₁₈烷氧基、C₁～C₆烷基、羥基、C₂～C₆烯基氧基、C₁～C₆烷基硫基、C₁～C₆烷基亞磺醯基

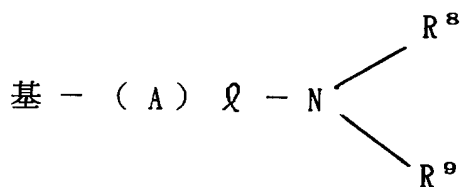
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

、 C₁ ~ C₆ 烷基磺醯基、鹵素原子、硝基、



(上式中，A 示 C₁ ~ C₆ 伸烷基或 -C- 基； ϱ 示 0 或 1；R⁸ 和 R⁹ 示可為相同或不同構造，表示氫原子或 C₁ ~ C₆ 烷基)、C₁ ~ C₆ 烷醯基、C₁ ~ C₆ 烷醯氧基、C₁ ~ C₁₈ 烷氧基羰基及羧基所成群之基作為取代基之苯基；②具有 C₁ ~ C₄ 伸烷基二氧基的苯基；③含 1 個氮原子的 5 ~ 10 節環所構成之單環或苯并單環構造的雜環殘基（該雜環上具有 1 ~ 3 個氧基作為取代基）；

④在其苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基作為取代基或在其 C₁ ~ C₆ 烷基上可具有羥基為其取代基的苯基 C₁ ~ C₆ 烷基，⑤在其苯環上具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基為其取代基的苯甲醯基或⑥在其苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基為其取代基的苯基 C₂ ~ C₆ 烯基；

R^{2E} 示氫原子；R^{3E} 示具有 1 ~ 2 個氮原子、氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環所構成單環、雙環或三環構造的雜環殘基〔該雜環基具有 1 ~ 3 個選自氧基、烷基、苯甲醯基、C₁ ~ C₆ 烷醯基、羥基、羧基、C₁ ~ C₆ 烷氧

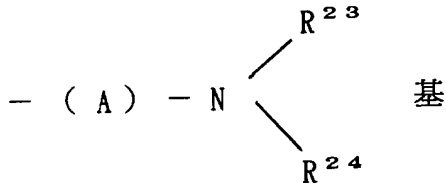
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

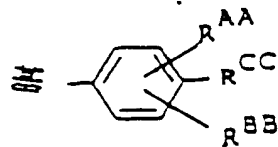
六、申請專利範圍

基羰基、C₁~C₆ 烷基硫基、



[上式中，A 所示如同前述，R²³和 R²⁴可為相同或不同構造，表示氫原子或 C₁ ~ C₆ 烷基；另外，R²³和 R²⁴係與此等結合之氮原子，並介由氮原子相互結合形成

[$\begin{pmatrix} N \\ N \end{pmatrix}$ 的雜環（該雜環上具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基）]、氰基、具有羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基、苯基胺基巯基以及可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基所構成基群中之基作為取代基]；但 R^{3E} 不可為未取代之吡嗪基，取代或未取代之薰草基，或取代或未取代之 5, 6 - 苯并薰草基且不可為 3 - 羥基 - 2, 5 - 二氧 - 3 - 吡咯啉基；當 R^{3E} 表示苯嵌 - 5 - 氮雜茛菪烷（julolidine）或可具有 C₁ ~ C₆ 烷基之四氫化喹啉（tetrahydroquinoline）時，R¹ 不可為



（其中，R^{CC}係表示羥基、經單或二 - C₁ ~ C₆ 烷基取代之胺基；R^{AA}及 R^{BB}係表示相同或不同的氫原子，C₁ ~ C₆ 烷氧基或 C₁ ~ C₆ 烷基），苯嵌 - 5 - 氮雜茛菪烷或四

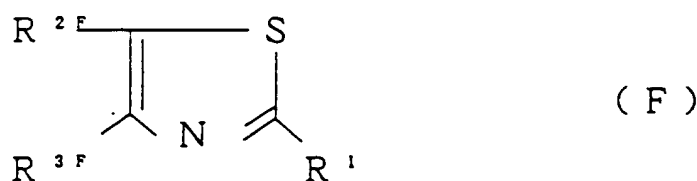
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂 線

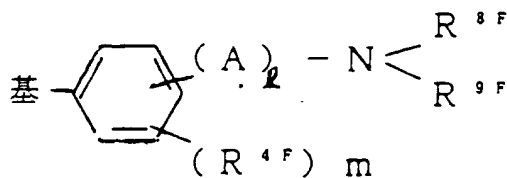
六、申請專利範圍


氫化喹啉}。

5. 一種噻唑衍生物或其鹽類，其特徵為具有下列一般式 (F) 所示者：



{ 上式中， R^1 如前述申請專利範圍第4項所定義； R^{2F} 示氫原子； R^{3F} 示



[上式中， A ， l ， m 如申請專利範圍第1項所定義； R^{8F} 和 R^{9F} 可為相同或不同構造，表示 $C_1 \sim C_6$ 烷醯基，或六氫吡啶基 $C_1 \sim C_6$ 烷基；另外， R^{8F} 和 R^{9F} 和其所結合的氮原子一起、介由氮原子或氧原子或不介由氮原子或氧原子而互相結合形成 $\left[\begin{smallmatrix} N \\ O \end{smallmatrix} \right]$ 、 $\left[\begin{smallmatrix} N \\ N \end{smallmatrix} \right]$ 、的雜環（該雜環具有 $C_1 \sim C_6$ 烷醯基或 $C_1 \sim C_6$ 烷基為其取代基）； R_{4F} 係表示 $C_1 \sim C_{18}$

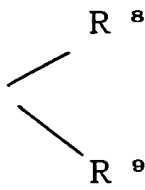
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

之烷氧基，硝基， $-(A)_\lambda - N$  基者（式中 A 係

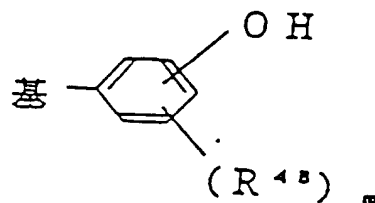
表示 $C_1 \sim C_6$ 伸烷基或 $-\overset{\overset{O}{||}}{C}-$ 基； λ 為 0 或 1； R^8

及 R^9 為相同或不同之氫原子，或 $C_1 \sim C_6$ 烷基或 $C_1 \sim C_6$ 烷醯基）， $C_1 \sim C_{18}$ 烷氧基羰基或羧基〕}。

6. 如申請專利範圍第 1 項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{1B} 係苯環上可具有 1 ~ 3 個 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基為其取代基的苯基，或具有 $C_1 \sim C_4$ 伸烷基二氧基的苯基所示者。

7. 如申請專利範圍第 1 項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{1B} 係可具有氧基的吡啶基，噻吩基，2-羥喹啉基，吡啶基，吡咯基，可具有氧基的喹啉基或 3, 4-二羥 2-羥喹啉基所示者。

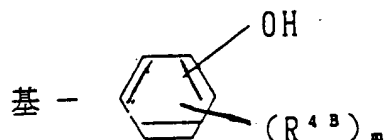
8. 如申請專利範圍第 6 項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{3B} 係



所示者；（式中， R^{4B} 和 m 所示如申請專利範圍第 1 項所定義）。

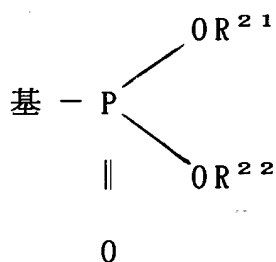
六、申請專利範圍

9. 如申請專利範圍第 7 項的噻唑衍生物或其鹽類，
其中 R^{3B} 係



所示者；（式中，R^{4B}和 m 所示如申請專利範圍第 1 項所
定義）。

10. 如申請專利範圍第 6 或 7 項的噻唑衍生物或其
鹽類，其中 R^{3B} 係在苯環上可具有 1 ~ 3 個選自 C₁ ~
C₆ 烷醯氧基，羥基磺醯氧基，氰基，脞基，硝基，C₁
~ C₆ 烷基硫基，C₁ ~ C₆ 烷基磺醯基，（具有 1 ~ 4
個選自羥基、C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基、苯基 C₁ ~ C₆ 烷
氧基、羥基或具 C₁ ~ C₆ 烷醯氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷
基以及 C₁ ~ C₆ 烷醯氧基所構成基群之基為其取代基的
四氫吡喃基氧基），（在苯環上具有選自（a）在噻唑環上
具有苯基為取代基之噻唑基（該苯基之苯環上可具有 C₁
~ C₆ 烷氧基），（b）羧基以及（c）羥基所構成基群
中之基作為取代基的苯基），具有羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基



（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

六、申請專利範圍

(上式中， R^{21} 和 R^{22} 所示如申請專利範圍第1項所述)所構成基群之基作為取代基的苯基。

1 1 . 如申請專利範圍第6或7項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{3B} 係具有 $C_1 \sim C_4$ 仲烷基二氧基的苯基； $C_1 \sim C_6$ 烷基； $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基； $C_1 \sim C_6$ 烷基； $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基；胺甲鹽基； $C_1 \sim C_6$ 烷基；可具有氧基或/和羥為取代基的2,3-二氫茛基；苯環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基而且 $C_1 \sim C_6$ 烷基上可具有羥基為其取代基的苯基； $C_1 \sim C_6$ 烷基；苯環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基為其取代基的苯甲鹽基；苯環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基為其取代基的苯基； $C_2 \sim C_6$ 烯基；六氫吡啶環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷基的六氫吡啶基； $C_1 \sim C_6$ 烷基。

1 2 . 如申請專利範圍第8或9項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{4B} 係羥基，羰基， $C_2 \sim C_6$ 烯基或 $C_1 \sim C_6$ 烷基所示者。

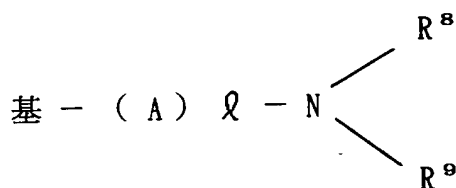
1 3 . 如申請專利範圍第8或9項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{4B} 係 $C_1 \sim C_{18}$ 烷氧基， $C_2 \sim C_6$ 烯基氧基，(在苯環上可具有選自：(a)在噻唑環上具有苯基為取代基之噻唑基(該苯基在其苯環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基)，(b)羰基以及(c)羥基所構成基群中之基作為取代基的苯基)，鹵素原子，硝基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂


線

六、申請專利範圍



0

||

[上式中，A 示 C₁ ~ C₆ 伸烷基或 -C- 基； ϱ 示 0 或 1；R⁸ 和 R⁹ 可為相同或不同構造，表示氫原子，C₁ ~ C₆ 烷基，C₁ ~ C₆ 烷醯基，或可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷基；另外，R⁸ 和 R⁹ 可介由氮原子或氧原子與不介由氮原子或氧原子、再連同所結合的氮原子互相結合形成為 $\left[\begin{array}{c} \text{N} \\ \text{O} \end{array} \right]$ 、 $\left[\begin{array}{c} \text{N} \\ \text{N} \end{array} \right]$ 、 的雜環（該雜環上具有 C₁ ~ C₆ 烷醯基或 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基），C₁ ~ C₆ 烷醯基，C₁ ~ C₁₈ 烷氧基羰基、氰基，具 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基，具有羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基，具 C₁ ~ C₆ 烷醯基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基，可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，C₂ ~ C₆ 炔基，具羧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基，具羧基取代的 C₂ ~ C₆ 烯基，以及具 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基。

14. 如申請專利範圍第 2 項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{4c} 係氫原子者。

15. 如申請專利範圍第 2 項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R^{4c} 係 C₁ ~ C₆ 烷基，苯基 C₁ ~ C₆ 烷基或

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

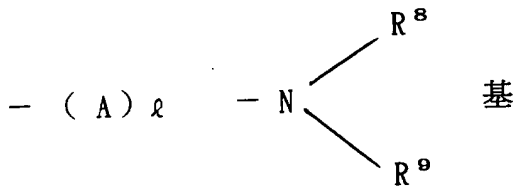
訂

線

六、申請專利範圍

具 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基者。

16. 如申請專利範圍第4項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R¹ 係 ① 在苯環上可具有 1 ~ 5 個選自 C₁ ~ C₁₈ 烷氧基、C₁ ~ C₆ 烷基、羥基、C₂ ~ C₆ 烯基氧基、C₁ ~ C₆ 烷基硫基、C₁ ~ C₆ 烷基亞磺基、C₁ ~ C₆ 烷基磺基、鹵素原子、硝基、



0
||

(上式中，A 示 C₁ ~ C₆ 伸烷基或 -C- 基；ℓ 示 0 或 1；R⁸ 和 R⁹ 示可為相同或不同構造，表示氫原子或 C₁ ~ C₆ 烷基)、C₁ ~ C₆ 烷鹽基、C₁ ~ C₆ 烷鹽氧基、C₁ ~ C₁₈ 烷氧基羰基及羧基所構成群之基為其取代基的苯基；② 具有 C₁ ~ C₄ 伸烷基二氧基的苯基。

17. 如申請專利範圍第4項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R¹ 係含有 1 ~ 2 個氮原子、氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環所構成單環、雙環或三環構造的雜環殘基（該雜環上具有 1 ~ 3 個氧基為其取代基）。

18. 如申請專利範圍第4項的噻唑衍生物或其鹽類，其中 R¹ 係在其苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基或在其

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍

25. 如申請專利範圍第5項的噻唑衍生物或其鹽類，其中R¹係含有1~2個氮原子，氧原子或硫原子的5~15節環所構成單環、雙環或三環的雜環殘基（該雜環上可具有1~3個氧基為其取代基）。

26. 如申請專利範圍第5項的噻唑衍生物或其鹽類，其中R¹係在其苯環上可具有C₁~C₁₈烷氧基，或在其C₁~C₆烷基上可具有羥基為其取代基的苯基C₁~C₆烷基，在其苯環上可具有C₁~C₆烷氧基為其取代基的苯甲醯基，在其苯環上可具有C₁~C₆烷氧基為其取代基的苯基C₂~C₆烯基。

27. 如申請專利範圍第24項的噻唑衍生物或其鹽類，其中R¹係含有1~3個C₁~C₁₈烷氧基或/及羥基的苯基。

28. 如申請專利範圍第25項的噻唑衍生物或其鹽類，其中雜環殘基係吡咯烷基，六氫吡啶基，六氫吡嗪基，嗎啉基，吡啶基，1,2,5,6-四氫吡啶基噻吩基，喹啉基，1,4-二氫喹啉基，苯駢噻唑基，吡嗪基，嘧啶基，吡喇嗪基噻吩基，吡咯基，2-羥喹啉基，3,4-二氫2-羥喹啉基，1,2,3,4-四氫喹啉基，吡啶基，異吡啶基，吡啶基，苯駢咪唑基，苯駢噁唑基，咪唑烷基，異喹啉基，喹啉基，喹啉基，嘧啶基，嘧啶基，吡啶基，吡啶基，異吡啶基，異吡啶基，吡啶基，咪唑基，吡啶基，吡啶基，啡嗪基，苯駢呋喃基，2,3-二氫苯駢〔b〕呋喃基苯駢噻吩基，啡嗪基，啡嗪

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

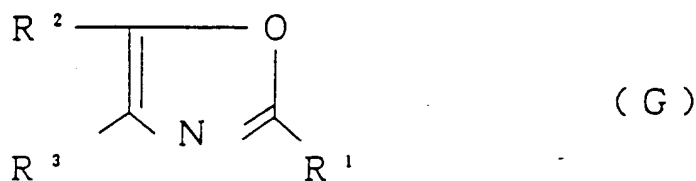
線

六、申請專利範圍

吡基，4 H - 吡啶基，1 H - 吡啶基，吡嗪基，吡嗪基，噻
 噁基，異吡啶基，2 - 咪啶基，2 - 吡咯基，咪喃
 基，嘔啶基，異嘔啶基，噻啶基，異噻啶基，嘔喃基，吡
 啶基，2 - 吡啶基，噻啶基，1，4 - 苯駢嘔啶基，
 3，4 - 二氫 - 2 H - 1，4 - 苯駢嘔啶基，3，4 - 二
 氫 - 2 H - 1，4 - 苯駢噻啶基，1，4 - 苯駢噻啶基，
 1，2，3，4 - 四氫噻啶基，1，3 - 二噻基 - 2，
 4 - 二氫噻基，吡啶基，1，4 - 二噻基噻基，二苯駢 [b，
 e] 氮雜庚因，6，11 - 二氫 - 5 H - 二苯駢 [b，
 e] 氮雜庚因基。

29. 如申請專利範圍第 27 項的噻啶衍生物或其鹽類，其中 R¹ 係含有 1 ~ 3 個 C₁ ~ C₁₈ 烷氧基的苯基。

30. 一種噻啶系衍生物或其鹽類，其特徵為以下列一般式 (G) 所示者：



[上式中，R¹ 為表示苯環上可具有 1 - 3 個 C₁ ~ C₈ 烷氧基之苯基；R² 示氫原子；R³ 係 3，4 - 二氫 - 2 - 嘔啶基]。

31. 一種噻啶系衍生物和其鹽類，其特徵為以下列一般式 (H) 所示者：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

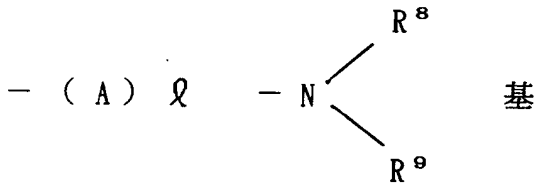
訂


線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍

~ C₆ 烯基氧基、C₁ ~ C₆ 烷基硫基、(在苯環上可具有選自：(a) 在噻唑環上具有苯基為取代基之噻唑基(該苯基係苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基)，(b) 羧基以及(c) 羥基所成群之基做為取代基的苯基)、C₁ ~ C₆ 烷基亞磺醯基、C₁ ~ C₆ 烷基磺醯基、鹵素原子、硝基



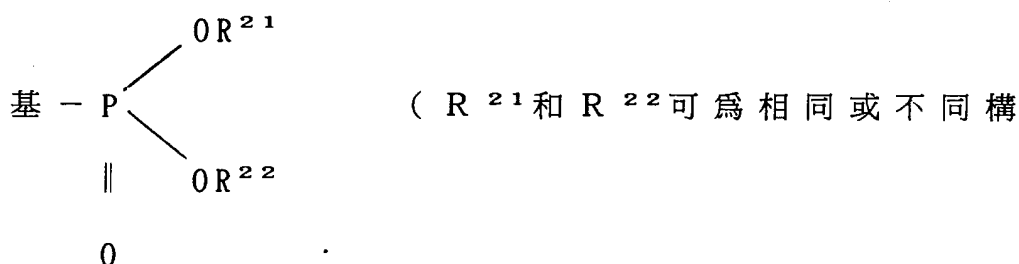
[上式中，A 示 C₁ ~ C₆ 伸烷基或 -C- 基； ϱ 示 0 或 1；R⁸ 和 R⁹ 可為相同或不同構造，表示氫原子，C₁ ~ C₆ 烷基，C₁ ~ C₆ 烷醯基，可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷基或六氫吡啶基 C₁ ~ C₆ 烷基；又 R⁸ 和 R⁹ 可介由氧原子或氮原子與不介由氧原子或氮原子，由本身所結合的氮原子互相結合而形成 $\left[\begin{matrix} N \\ O \end{matrix} \right]$ 、 $\left[\begin{matrix} N \\ N \end{matrix} \right]$ 、 的雜環(該雜環上具備 C₁ ~ C₆ 烷醯基或 C₁ ~ C₆ 烷基做為其取代基)]、C₁ ~ C₆ 烷醯基、C₁ ~ C₆ 烷醯氧基、C₁ ~ C₁₈ 烷氧基羰基、氰基、(具 1 ~ 4 個選自羥基、C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基、苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基、羥基或 C₁ ~ C₆ 烷醯氧基取代的

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

六、申請專利範圍

C₁ ~ C₆ 烷基以及 C₂ ~ C₆ 烷醯氧基所構成群之基為取代基的四氫吡喃基氧基)、脞基、羥基磺基氧基、具 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基、具羧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基、氫硫基、具 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基、具羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基、C₂ ~ C₆ 烯基，可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為取代基的胺基硫氧基、可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為取代基的胺基羰硫基、具 C₁ ~ C₆ 烷醯基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基、羧基、



造，示氫原子或 C₁ ~ C₆ 烷基)、苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基、C₂ ~ C₆ 炔基、具羧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基、C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基取代 C₂ ~ C₆ 烯基、羧基取代 C₂ ~ C₆ 烯基、可具有鹵素原子的 C₁ ~ C₆ 烷基磺醯氧基以及 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，可具有鹵素原子的 C₂ ~ C₆ 烯基，以及苯基 C₁ ~ C₄ 烷氧基所成群之基為取代基的苯基；②可具有 C₁ ~ C₄ 伸烷基二氧基的苯基；③含有 1 ~ 2 個氮原子，氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環所構成單環、雙環或三環構造的雜環殘基〔該雜環上係具有 1 ~ 3 個選自氧基，C₁ ~ C₁₈

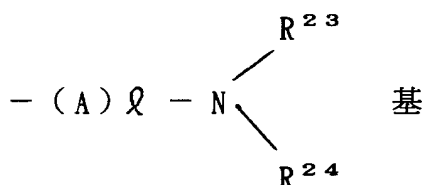
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

紙

六、申請專利範圍

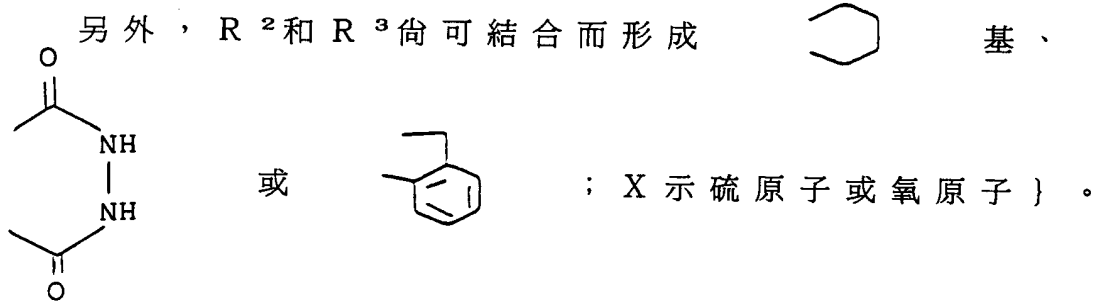
烷基，苯甲醯基，C₁ ~ C₆ 烷醯基，羥基，羧基，C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，C₁ ~ C₆ 烷硫基



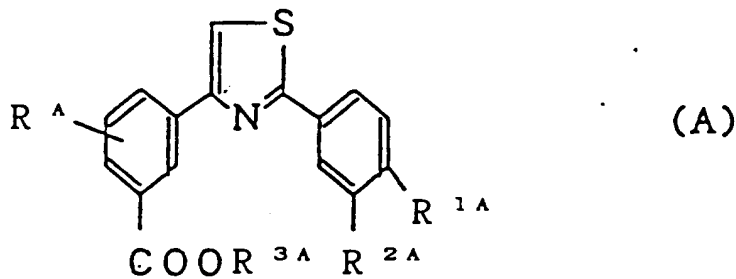
(A 和 Q 所示如前述；R²³和 R²⁴可為相同或不同構造，表示氫原子，或 C₁ ~ C₆ 烷基；R₂₃ 和 R₂₄ 係與此等所結合之氮原子，同時介由氮原子相互結合形成 $\begin{bmatrix} N \\ N \end{bmatrix}$ 的雜環亦可；該雜環上具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基)；
 ① 氨基，具有羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基，苯基胺基羰基，以及可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基所構成群之基為其取代基]；
 ② C₁ ~ C₆ 烷基；
 ③ C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基 C₁ ~ C₆ 烷基；
 ④ C₁ ~ C₆ 烷基；
 ⑤ C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基；
 ⑥ 胺甲醯基 C₁ ~ C₆ 烷基；
 ⑦ 可具有氧基或 / 及羥基為取代基的 2, 3 - 二氫茛基；
 ⑧ 在其苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基，或在其 C₁ ~ C₆ 烷基上可具有羥基為其取代基的苯基 C₁ ~ C₆ 烷基；
 ⑨ 在其苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基為其取代基的苯甲醯基；
 ⑩ 在其苯環上可具有烷氧基為其取代基的苯基 C₂ ~ C₆ 烯基；
 ⑪ 在其六氫吡咩環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的六氫吡咩基 C₁ ~ C₆ 烷基或 ⑬ 金鋼烷基；
 R³ 除前述之外，尚可示氫原子；R² 示氫原子、苯基，鹵素

六、申請專利範圍

原子， $C_1 \sim C_6$ 。烷氧基羰基， $C_1 \sim C_6$ 。烷基，可具有
 $C_1 \sim C_6$ 。烷基為其取代基的胺基 $C_1 \sim C_6$ 。烷基或二氫
2-脛嗪基；



34. 如申請專利範圍第33項的抑制活性氧用藥學組成物，其中，含有以下列一般式(A)所示噻唑衍生物和其鹽類者：



[上式中， R^A 示氫原子或羟基； R^{1A} 和 R^{2A} 分別示甲氧基或乙氧基； R^{3A} 示氫原子或 $C_1 \sim C_6$ 。烷基； R^A 的結合位置為苯環上的4位或6位；但 R^{1A} 和 R^{2A} 不可以同時為甲氧基]。

35. 如申請專利範圍第33項的抑制活性氧用藥學組成物，其中含有以下列一般式(B)所示噻唑衍生物和其鹽類者：

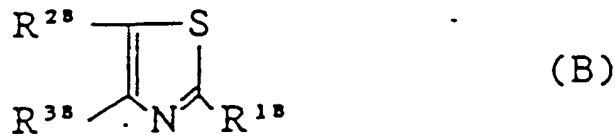
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

綠

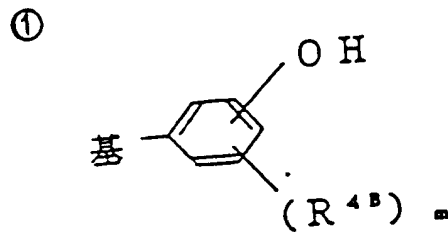
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍



{ 上式中， $\text{R}^{1\text{B}}$ 示苯環上可具有 1 ~ 3 個 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷氧基為其取代基的苯基，具有 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ 伸烷基二氧基的苯基，可具有氧基的吡啶基，噻啶基，2-羥喹啉基，吡啶基，吡咯基，氧基的喹啉基，或 3, 4-二氫-2-羥喹啉基； $\text{R}^{2\text{B}}$ 示氫原子；

$\text{R}^{3\text{B}}$ 示



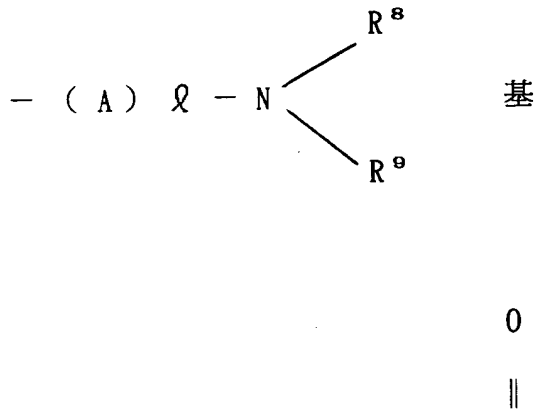
{ $\text{R}^{4\text{B}}$ 示 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{18}$ 烷氧基， $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷基，羥基， $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ 烯基氧基，（在苯環上可具有選自：(a) 噻啶環上具有苯基為取代基之噻啶基（該苯基之苯環上可具有 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 烷氧基），(b) 羧基以及 (c) 羥基所構成基群之基作為取代基的苯基），鹵素原子，硝基，


（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

六、申請專利範圍



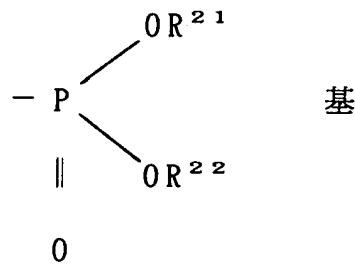
[上式中，A 示 C₁ ~ C₆ 伸烷基或 -C- 基； ϱ 示 0 或 1；R⁸和 R⁹可為相同或不同構造，表示氫原子，C₁ ~ C₆ 烷基，C₁ ~ C₆ 烷鹽基或可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷基；另外，R⁸和 R⁹可介由氮原子或氧原子與不介由氮原子或氧原子，再連同所結合的氮原子互相結合形成為 $\left[\begin{array}{c} \text{N} \\ \text{O} \end{array} \right]$ 、 $\left[\begin{array}{c} \text{N} \\ \text{N} \end{array} \right]$ 、 的雜環（該雜環上具有 C₁ ~ C₆ 烷鹽基或 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基）]，C₁ ~ C₆ 烷鹽基，C₁ ~ C₁₈ 烷氧基羰基，氰基，具 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代的 C₁ ~ C₆ 烷氧基，可具羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基，C₂ ~ C₆ 烯基，具 C₁ ~ C₆ 烷鹽基取代的 C₁ ~ C₆ 烷基，羧基，苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，C₂ ~ C₆ 炔基，羧基取代 C₁ ~ C₆ 烷基，羧基取代 C₂ ~ C₆ 烯基，以及 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，m 示 0，1 或 2] 或 ② 苯環上可具有 1 ~ 3 個選自：C₁ ~ C₆ 烷鹽氧基，羥基磺鹽氧基，氰基，脞基，硝基，C₁ ~ C₆ 烷基硫基，C₁ ~ C₆ 烷基磺鹽基，（1 ~ 4 個選自羥基、C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基，羥基或 C₁ ~ C₆ 烷鹽氧

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂 線

六、申請專利範圍

基取代 C₁ ~ C₆ 烷基以及 C₂ ~ C₆ 烷醯氧基所構成基群的基為其取代基的四氫吡喃基氧基)，（在苯環上可具有選自：（a）在噻唑環上具有苯基為取代基之噻唑基（該苯基之苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基），（b）羧基以及（c）羥基所構成基群之基作為取代基的苯基），具有羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基及



（上式中，R²¹和 R²²所示如同前述）所構成基群之基作為取代基的苯基；③具有 C₁ ~ C₄ 伸烷基二氧基的苯基；④ C₁ ~ C₆ 烷基；⑤ C₁ ~ C₆ 烷氧基羧基 C₁ ~ C₆ 烷基；⑥ C₁ ~ C₆ 烷氧基羧基；⑦ 胺甲醯基 C₁ ~ C₆ 烷基；⑧ 可具有氧基或 / 和羥基為取代基的 2, 3-二氫茛基；⑨ 苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基而且 C₁ ~ C₆ 烷基上可具有羥基為其取代基的苯基 C₁ ~ C₆ 烷基；⑩ 苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基為其取代基的苯甲醯基；⑪ 苯環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷氧基為其取代基的苯基 C₂ ~ C₆ 烯基；⑫ 六氫吡啶環上可具有 C₁ ~ C₆ 烷基的六氫吡啶基 C₁ ~ C₆ 烷基或 ⑬ 金鋼烷基；但 R^{4B} 為 C₁ ~ C₆ 烷氧基羧基取代 C₁ ~ C₆ 烷基或羧基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

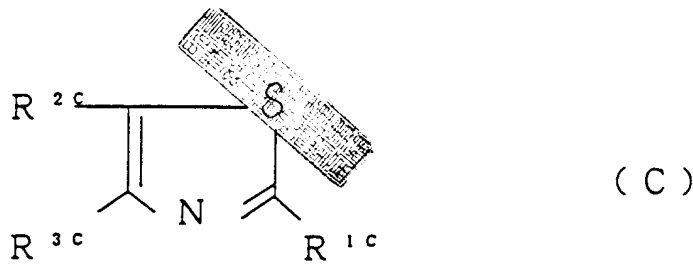
訂

線

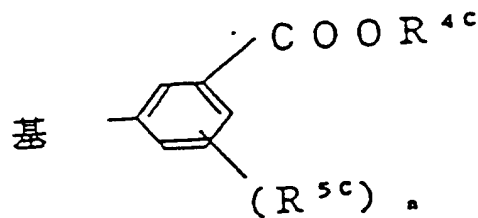
六、申請專利範圍

取代 C₁ ~ C₆ 烷基時，m 示 2 }。

36. 如申請專利範圍第 33 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中含有下列一般式 (C) 所示噻唑衍生物和其鹽類者：



[上式中，R^{1c} 示苯環上可具有 1 ~ 3 個 C₁ ~ C₆ 烷氧基為其取代基的苯基；R^{2c} 示氫原子；R^{3c} 示



(上式中，R^{4c} 示氫原子，C₁ ~ C₆ 烷基，苯基 C₁ ~ C₆ 烷基或 C₁ ~ C₆ 烷氧基取代 C₁ ~ C₆ 烷基；R^{5c} 示胺基，C₁ ~ C₆ 烷氧基，C₁ ~ C₆ 烷氧基，C₁ ~ C₆ 烷基，硝基，C₂ ~ C₆ 烯基，C₁ ~ C₆ 烷醯基，具有鹵素原子的 C₂ ~ C₆ 烯基，苯基 C₁ ~ C₆ 烷氧基，鹵素原子或經基取代 C₁ ~ C₆ 烷基；n 示 2)]。

37. 如申請專利範圍第 33 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中含有以下列一般式 (D) 所示噻唑衍生物和

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

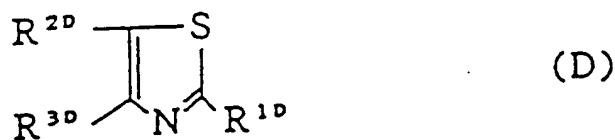
訂

線

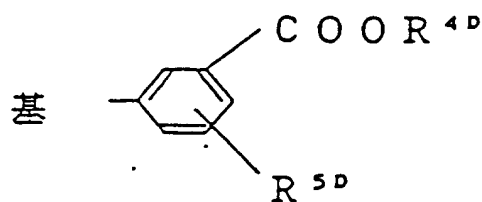
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍

其鹽類者：



[上式中，R^{1D}示苯環上可具有1~3個C₁~C₆烷氧基為其取代基的苯基；R^{2D}示氫原子；R^{3D}示



(上式中，R^{4D}示氫原子或C₁~C₆烷基；R^{5D}示胺基；C₁~C₆烷氧基羰基C₁~C₆烷氧基，硝基，C₂~C₆烯基氧基，C₁~C₆烷氧基取代C₁~C₆烷氧基或氫硫基，C₁~C₆烷醯氧基，可具有C₁~C₆烷基為取代基的胺基羰硫基，可具有C₁~C₆烷基為取代基的胺基羧基，羧基取代C₁~C₆烷氧基，或可具有鹵素原子的C₁~C₆烷基磺醯氧基)]。

38. 如申請專利範圍第33項的抑制活性氧用藥學組成物，其中含有下列一般式(E)所示噻唑衍生物和其鹽類者：

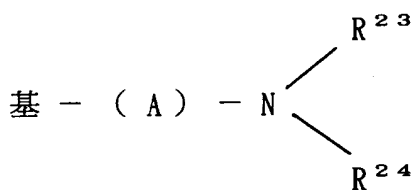
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

②具有 $C_1 \sim C_4$ 伸烷基二氧基的苯基；③含有 1 ~ 2 個氮原子，氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環之單環、雙環或三環構造的雜環殘基（該雜環上可具有 1 ~ 3 個氧基作為取代基）；④在其苯環上具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基，或在其 $C_1 \sim C_6$ 烷基上可具有羥基為其取代基的苯基 $C_1 \sim C_6$ 烷基；⑤在其苯環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基為其取代基的苯甲醯基或⑥在其苯環上可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基為其取代基的苯基 $C_2 \sim C_6$ 烯基； R^{2E} 示氫原子； R^{3E} 示具有 1 ~ 2 個氮原子、氧原子或硫原子的 5 ~ 15 節環所構成單環、雙環或三環構造的雜環殘基〔該雜環基可具有 1 ~ 3 個選自氧基， $C_1 \sim C_{18}$ 烷基，苯甲醯基， $C_1 \sim C_6$ 烷醯基，羥基，羧基， $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基， $C_1 \sim C_6$ 烷基硫基，



（上式中，A 所示如同前述； R^{23} 和 R^{24} 可為相同或不同構造，表示氫原子或 $C_1 \sim C_6$ 烷基；另外 R^{23} 和 R^{24} 可介由氮原子或氧原子，或不介由氮原子或氧原子，由其所結合的氮原子一起互相結合而形成 $\left[\begin{array}{c} N \\ N \end{array} \right]$ 的雜環；該雜環上具有 $C_1 \sim C_6$ 烷基為其取代基），氧基，具有羥基的 $C_1 \sim C_6$ 烷基，苯基胺基硫基羰基以及

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

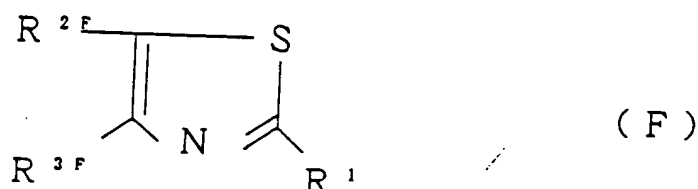
訂

錄

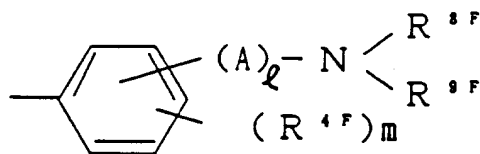
六、申請專利範圍

可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基所構成基群中之基作為取代基]。

39. 如申請專利範圍第 33 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中含有下列一般式 (F) 所示噻唑衍生物和其鹽類者：



[上式中，R¹ 係與上述申請專利範圍第 4 項之定義相同；R^{2F} 示氫原子；R^{3F} 示



(上式中，A，l，m 所示如同前述；R^{8F} 和 R^{9F} 可為相同或不同構造，示 C₁ ~ C₆ 烷鹽基或六氫吡啶基 C₁ ~ C₆ 烷基；另外，R^{8F} 和 R^{9F} 和其所結合的氮原子一起，介由氮原子或氧原子或不介由氮原子或氧原子，互相結合而形成飽和或不飽和的 5 ~ 6 節環構造的雜環；該雜

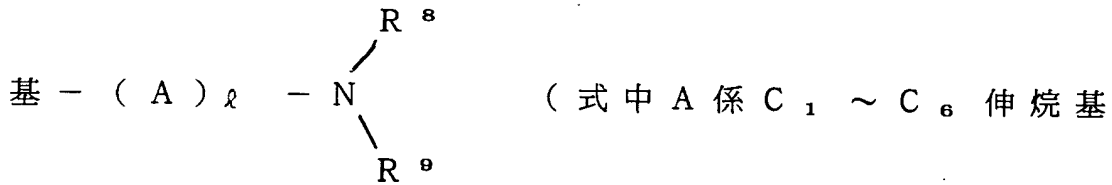
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

環具有 C₁ ~ C₆ 烷醯基或 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基； R^{4F} 為 C₁ ~ C₁₈ 之烷氧基、硝基、



基 - C - C ; ℓ 為 0 或 1 ; R⁸ 及 R⁹ 為同一或不同構成
 $\begin{matrix} || \\ O \end{matrix}$
 之氫原子，或 C₁ ~ C₆ 烷基或 C₁ ~ C₆ 烷醯基) ，
 C₁ ~ C₁₈ 烷氧基羰基或羧基) 。

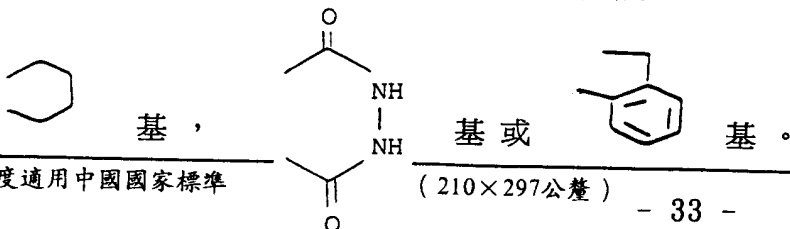
40 . 如申請專利範圍第 33 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中 X 示硫原子者。

41 . 如申請專利範圍第 33 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中 X 示氧原子者。

42 . 如申請專利範圍第 40 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中 R² 示氫原子者。

43 . 如申請專利範圍第 40 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中 R² 示苯基，鹵素原子，C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，C₁ ~ C₆ 烷基，可具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷基或二氫 - 2 - 羥喹啉基。

44 . 如申請專利範圍第 40 項的抑制活性氧用藥學組成物，其中 R² 和 R³ 結合而形成



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍

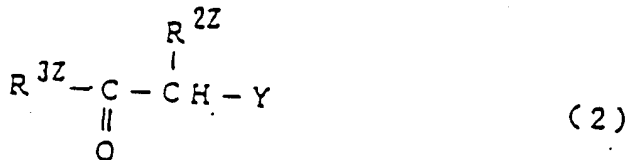
45. 如申請專利範圍第33項之抑制活性氧用藥學組成物，其含有2-(3,4-二乙氧基苯基)-4-(3-羧基-4-羥基苯基)噻唑者。

46. 如申請專利範圍第33項之抑制活性氧用藥學組成物，其含有2-(3,4-二乙氧基苯基)-4-(3-羧基-4-羥基-5-(2-甲基-2-丙烯基)苯基)噻唑者。

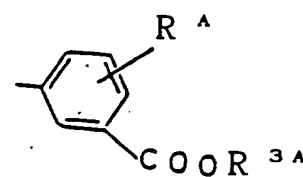
47. 如申請專利範圍第33項之抑制活性氧用藥學組成物，其含有2-(3,4-二乙氧基苯基)-4-(3-羧基-4-羥基-5-甲基苯基)噻唑者。

48. 如申請專利範圍第33項之抑制活性氧用藥學組成物，其含有2-(3,4-二乙氧基苯基)-4-(2-羧基-6-吡啶基)噻唑者。

49. 一種製備如申請專利範圍第1、2、3、4、5、30項或31項的噻唑衍生物或其鹽的製造方法，其中以一般式(2)所表示的化合物



[式中R^{2Z}係表示氫原子或前述R^{2H}，

R^{3Z}係表示前述基， (R^A及R^{3A}係與前

述相同)，-R^{3B}基，-R^{3C}基，-R^{3D}基，-R^{3E}

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

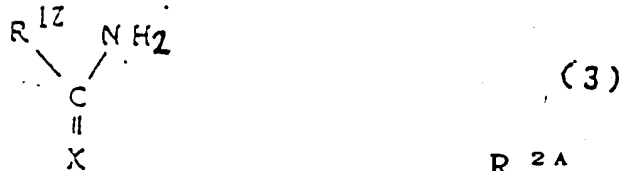
訂

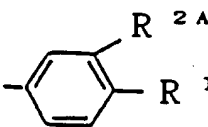
紙

六、申請專利範圍

基， $-R^{3F}$ 基， $-R^3$ 基或 $-R^{3H}$ 基，Y 係表示鹵原子]

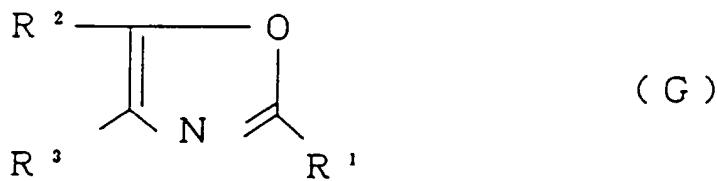
及以一般式 (3) 所表示的化合物



[式中 R^{1Z} 係表示，前述基， (R^{2A} 及 R^{1A} 與前述相同)， $-R^{1B}$ 基， $-R^{1C}$ 基， $-R^{1D}$ 基或 $-R^1$ 基]

在適當的溶媒中予以加熱反應。

50. 一種製備如申請專利範圍第 30 項所示一般式 (G) 所示嘔唑衍生物和其鹽類的製造方法：



(上式中， R^1 ， R^2 和 R^3 所示如申請專利範圍第 30 項所述)。

其特徵為由下列一般式 (2) 所示化合物，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

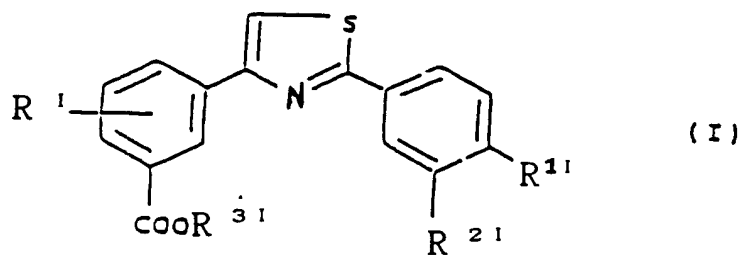
線

六、申請專利範圍

(上式中， R^{1Y} ， R^{2Y} 和 R^{3Y} 所示意義如同前述)

繼之，將上述化合物(7)在無溶劑下，或適當溶劑中和2,4-雙(4-甲氧基苯基)-1,3-二噁基-2,4-二磷乙烷-2,4-二硫化物〔勞遜氏試劑(Lawesson's reagent)〕，在五硫化磷等硫化劑存在下反應而製成一般式(1b)所示化合物之製法。

52. 如申請專利範圍第33項之抑制活性氧用藥學組成物，其含有具有下列一般式(I)所示噻唑衍生物或其鹽類為有效成份者，



[上式中， R^1 示 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基， R_{31} 示 $C_1 \sim C_6$ 烷基， R^{11} 及 R^{21} 係分別示乙氧基， R^1 的結合位置為苯環上之4位或5位者]。

53. 如申請專利範圍第33項之抑制活性氧用藥學組成物，其含有2-(3,4-二乙氧基苯基)-4-(3-羧基-5-甲氧基苯基)噻唑為有效成份。

54. 如申請專利範圍第4項的噻唑衍生物或其鹽類，其中， R^1 為可具有 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基的苯基； R^{3E} 係表示①吡啶基，②呋喃基〔該吡啶基及呋喃基可具有1~3個選自氧基、 $C_1 \sim C_6$ 烷基、苯甲醯基、 $C_1 \sim C_6$

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

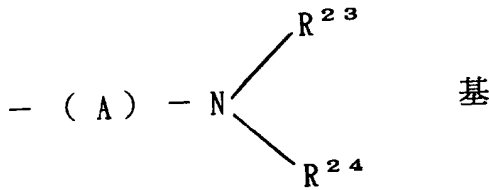
線

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

六、申請專利範圍

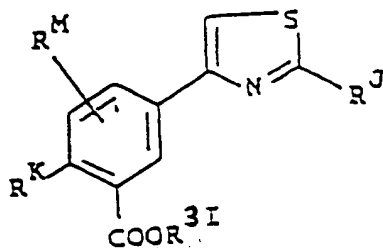
烷醯基、羥基、羧基、C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基、C₁ ~ C₆ 烷基硫基、



(上式中，A 表示 C₁ ~ C₆ 伸烷基或 -CO- 基；R²³ 和 R²⁴ 可為相同或不同構造，表示氫原子或 C₁ ~ C₆ 烷基；另外，R²³ 和 R²⁴ 係與此等結合之氮原子並介由氮原子相互結合形成 $\left[\begin{matrix} N \\ N \end{matrix} \right]$ 的雜環（該雜環上具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基）、氰基、具有羥基的 C₁ ~ C₆ 烷基、苯基胺基硫基以及具有 C₁ ~ C₆ 烷基為其取代基的胺基 C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基所構成基群之基作為取代基）。

55. 如申請專利範圍第 54 項的噻唑衍生物或其鹽類，其中，R^{3E} 係表示 ① 可具有 1 ~ 3 個選自羥基，羧基，C₁ ~ C₆ 烷氧基羰基，具羥基之 C₁ ~ C₆ 烷基所構成基群之取代基的吡啶基；及 ② 呋喃基。

56. 一種噻唑衍生物或其鹽類，其特徵係以一般式



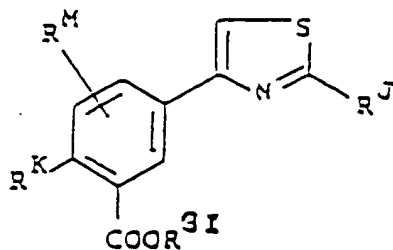
[式中 R^{3I} 示 C₁ ~ C₆ 烷基；R^K 係表示 C₁ ~ C₆ 之

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍

烷氧基； R^M 係表示 $C_1 \sim C_6$ 烷基或 $C_2 \sim C_6$ 烯基；
 R^J 係表示苯環上可具有 1 ~ 3 個 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基之苯基) 表示。

57. 如申請專利範圍第 33 項之抑制活性氧用藥學組成物，其含有如申請專利範圍第 56 項所示以一般式



[式中 R^{3I} , R^K , R^M , R^J 之定義同於申請專利範圍第 56 項] 表示之噻唑衍生物或其鹽類。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線